

PATENTSCHRIFT 141 778

Wirtschaftspatent

Erteilt gemäß § 5 Absatz 1 des Änderungsgesetzes zum Patentgesetz

In der vom Anmelder eingereichten Fassung veröffentlicht

			Int. Cl. ³
(11)	141 778	(44)	21.05.80 3(51) A 01 N 47/38
(21)	WP A 01 N / 210 532	(22)	18.01.79

(71) siehe (72)

(72) Franke, Friedrich, Dr.rer.nat. Dipl.-Chem.; Klepel, Manfred, Dr.rer.nat. Dipl.-Chem.; Lehmann, Hans, Dr.agr. Dipl.-Landw.; Brämer, Brigitte, DD

(73) siehe (72)

(74) VEB Fahlberg-List, HA Forschungsvorbereitung, Abt. Patente und Lizenzen, 3013 Magdeburg, Alt-Salbke 60-63

(54) Fungizide Mittel

(57) Die Erfindung betrifft fungizide Mittel zur Bekämpfung phytopathogener Pilze, insbesondere des Erregers der Kraut- und Knollenfäule der Kartoffel, *Phytophthora infestans*. Das Ziel der Erfindung ist es, neue fungizide Mittel mit besseren Gebrauchswerteigenschaften insbesondere systemischen Effekten bereitzustellen. Die Aufgabe wird durch die erfindungsgemäßen Mittel gelöst, die als Wirkstoff Morpholin-4-carbonsäureanilide der allgemeinen Formel II enthalten. In Formel II bedeuten R Wasserstoff, Halogen, Alkoxy, Nitro oder Alkyl, X Wasserstoff, Halogen oder Alkyl und R¹ Wasserstoff oder Methyl. Die erfindungsgemäßen Mittel sind geeignet, das Wachstum von phytopathogenen Pilzen, wie z.B. *Phytophthora infestans*, *Septoria apii*, *Botrytis cinerea* und *Erysiphe graminis*, zu verhindern und zeichnen sich daher durch ein relativ breites Wirkungsspektrum aus. Sie stellen auf Grund ihrer systemischen Eigenschaften eine wertvolle Bereicherung des Standes der Technik dar.



Anwendungsgebiet der Erfindung

Die Erfindung betrifft neue fungizide Mittel zur Bekämpfung phytopathogener Pilze, insbesondere des Erregers der Kräut- und Knollenfäule der Kartoffel, *Phytophthora infestans*.

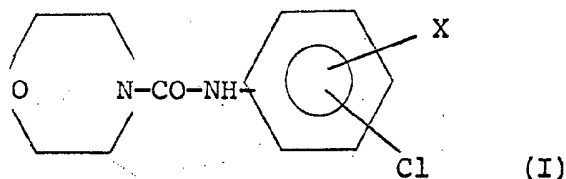
Charakteristik der bekannten technischen Lösungen

Die zur Bekämpfung der *Phytophthora*-Krankheit anerkannten Mittel auf der Grundlage der Fungizide Maneb, Zineb und anderer Dithiocarbamate sowie der Zinnpräparate besitzen u.a. folgende Mängel:

- Sie wirken nur präventiv und sind daher nur zur vorbeugenden Behandlung der Kartoffelbestände geeignet.
- Zum Schutz des pflanzlichen Neuzuwachses sowie zum Ersatz der durch Abwaschung und Abbau eingetretenen Wirkstoffverluste ist eine Erneuerung des Spritzbelages notwendig. Im Durchschnitt sind 4 bis 5 Behandlungen erforderlich.
- Der als Metabolit aus den Dithiocarbamatfungiziden Maneb und Zineb entstehende Ethylenthioharstoff ist toxikologisch nicht unbedenklich, so daß in einigen Ländern bereits ein Verbot dieser Fungizide erwogen wird.
- Insbesondere die Zinnpräparate verursachen zum Teil phytotoxische Schäden an den Kulturpflanzen.

Von dieser unbefriedigenden Situation ausgehend besteht ein dringendes volkswirtschaftliches Interesse an der Auffindung neuer *Phytophthora*fungizide mit besseren Gebrauchswerteigenschaften, insbesondere systemischen Effekten.

Morpholin-4-carbonsäureanilide der allgemeinen Formel I, worin X Chlor oder Wasserstoff bedeuten kann,



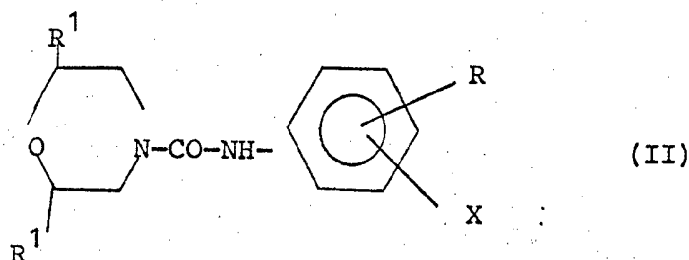
sind aus der Patentliteratur bisher nur als Herbizide bekannt (US-PS 2 913 322, DE-AS 1 188 861, DE-OS 2 125 353). Sie sollen zur selektiven Unkrautbekämpfung in Gerste-, Weizen- und anderen wichtigen Hauptkulturen geeignet sein. Hinweise auf mikrobizide, insbesondere fungizide Wirkungen dieser Substanzklasse werden nicht gegeben.

Ziel der Erfindung

Das Ziel der Erfindung ist es, neue fungizide Mittel bereitzustellen, die mit hoher Effektivität zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten, insbesondere der Kraut- und Knollenfäule der Kartoffel eingesetzt werden und damit wesentlich zur Ertragssteigerung und Qualitätsverbesserung in dieser wichtigen landwirtschaftlichen Kultur beitragen können.

Darlegung des Wesens und der Merkmale der Erfindung

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, daß Morpholin-4-carbonsäureanilide der allgemeinen Formel II



auch als Wirkstoffe für fungizide Mittel zur Bekämpfung phytopathogener Pilze genutzt werden können.

In der allgemeinen Formel II bedeuten

R Wasserstoff, Halogen, Alkoxy, Nitro oder Alkyl,

X Wasserstoff, Halogen oder Alkyl,

R¹ Wasserstoff oder Methyl

Die guten fungiziden Eigenschaften wurden bei den Schaderregern *Phytophthora infestans*, *Septoria apii*, *Botrytis cinerea* und *Erysiphe graminis* an den Kulturen Tomate, Sellerie, Ackerbohne und Gerste nachgewiesen und bestimmt.

Insbesondere bei der Vorbeugung und Bekämpfung von Infektionen durch *Phytophthora infestans* zeichnen sich die erfindungsgemäßen Mittel durch ihre systemische sowie curative Wirkung aus und übertreffen damit die anerkannten Standardpräparate.

Die Wirkstoffe können nach schon bekannten Verfahren, insbesondere durch Umsetzung von substituierten Phenylisocyanaten mit Morpholinen einfach und in guten Ausbeuten hergestellt werden. Die Morpholin-4-carbonsäureanilide der allgemeinen Formel II können für sich allein eingesetzt oder mit geeigneten Trägerstoffen und/oder Verdünnungsmitteln und gegebenenfalls oberflächenaktiven Substanzen oder anderen üblichen Hilfsstoffen nach herkömmlichen Methoden zu Stäubemitteln, Spritzpulvern, Beizmitteln, Granulaten, emulgierbaren Konzentraten oder Lösungen formuliert werden.

Die fungiziden Mittel können zusätzlich zu den erfindungsgemäßen Wirkstoffen noch andere bekannte Wirkstoffe enthalten oder in Kombination mit anderen Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmitteln oder Agrochemikalien eingesetzt werden.

Der Wirkstoffgehalt der fungiziden Mittel beträgt im allgemeinen je nach Verwendungszweck etwa 10 bis 90 Ma.-%.

Die erfindungsgemäßen Mittel sind geeignet, das Wachstum von pflanzenpathogenen Pilzen, wie z.B. *Phytophthora infestans*, *Septoria apii*, *Botrytis cinerea* und *Erysiphe graminis*, zu verhindern und zeichnen sich daher durch ein relativ breites Wirkungsspektrum aus. Sie sind zur Behandlung von Pflanzen und Pflanzenteilen (Früchte, Blüten, Laubwerk, Stengel, Knollen und Wurzeln) geeignet und können auch als Beizmittel angewendet werden. Der landwirtschaftlichen Praxis stehen gegenwärtig keine anerkannten fungiziden Mittel zur Verfügung, die gegen die blattparasitäre wichtige Gruppe der Phycomyceten (z.B. *Phytophthora infestans*) systemische Eigenschaften zeigen. Die erfindungsgemäßen Mittel stellen somit auf Grund ihrer systemischen Eigenschaften eine wertvolle Bereicherung des Standes der Technik dar.

Ausführungsbeispiele

Die fungizide Wirkung der erfindungsgemäßen Mittel wurde gegen *Phytophthora infestans*, *Septoria apii*, *Botrytis cinerea* und *Erysiphe graminis* geprüft. Die folgenden Beispiele sollen die Erfindung erläutern, ohne sie jedoch einzuschränken.

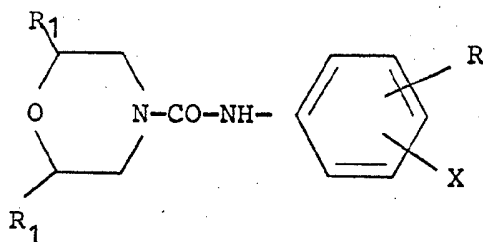
Beispiel 1

Die Wirtspflanzen (Tomate, Sellerie, Ackerbohne bzw. Gerste) wurden mit 2 000 ppm Wirkstoff enthaltender Spritzbrühe behandelt und nach Antrocknen des Spritzbelages mit dem pilzlichen Krankheitserreger inokuliert. Nach der Inkubationsperiode wurde der prozentuale Blattbefall ermittelt und in Boniturnoten erfaßt.

- 0 = kein Bekämpfungserfolg
- + = geringer Bekämpfungserfolg
- ++ = mittlerer Bekämpfungserfolg
- +++ = guter Bekämpfungserfolg

Tabelle 1

Fungizide Wirkung von Beispielen der erfindungsgemäßen Verbindungen



Verbindung			P.i.	S.a.	B.c.	E.g.
R	R ₁	X				
3-Cl	CH ₃	H	+++	+	0	0
4-Cl	CH ₃	H	+++	+	+	0
2-Cl	CH ₃	H	+	++	+	++
4-Me	CH ₃	H	++	+	+	++
4-OCH ₃	CH ₃	H	++	++	+	+
3-Me	H	H	+++	+++	+++	++
4-Me	H	H	+++	+++	++	+
3-Cl	H	H	+++	+++	++	++
Zineb			+++	+++	+++	+
unbehandelt			0	0	0	0

Beispiel 2:

Tomatenpflanzen werden in mit Boden gefüllte Glasröhrchen pikiert, mit der zu prüfenden formulierten Substanz (2 000 ppm Wirkstoff) gegossen und mit einer Zoosporangiensuspension des Erregers inokuliert.

Nach der Inkubationsperiode wurde der prozentuale Blattbefall ermittelt und in Boniturnoten (siehe Beispiel 1) erfaßt.

In den mit a) versehenen Prüfungen traten bereits phytotoxische Erscheinungen auf.

Tabelle 2

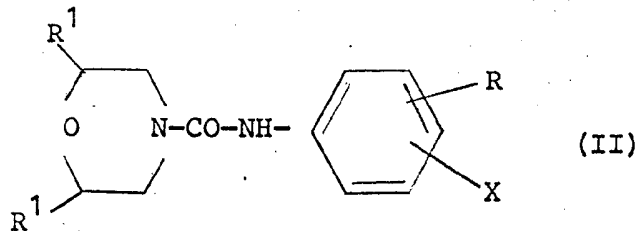
Systemfungizide Wirkung von Beispielen der erfindungsgemäßen Verbindungen

Verbindungen

R	R ₁	X	System. Wirkung
3-Cl	Me	H	+
4-Cl	Me	H	++
3-CH ₃	H	H	++ a)
4-CH ₃	H	H	+ a)
4-Cl	H	H	++ a)
Zineb			0
unbehandelt			0

Erfindungsanspruch:

Fungizide Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an Morpholin-4-carbonsäureaniliden der allgemeinen Formel II,



worin R Wasserstoff, Halogen, Alkoxy, Nitro oder Alkyl

X Wasserstoff, Halogen oder Alkyl

und R¹ Wasserstoff oder Methyl

bedeuten.