

51902/ZE

KÖZZÉTETELI
PÉLDÁNY

-55010-

KIVONAT

Mikrobicid készítmények

Bejelentő: CIBA-GEIGY AG, Bazel, Svájc

A bejelentés napja: 1990. 06. 28.

Elsőbbsége: 1989. 06. 29. (2411/89-0) Svájc

A találmány tárgyát az (I) általános képletű vegyületek, ahol

X oxigén- vagy kénatom,

Het 1-3 egyforma vagy különböző heteroatomot (nitrogén-, oxigén- vagy kénatomot) tartalmazó, adott esetben halogénatommal, ciano-, nitro-, alkil-, cikloalkil-, alkoxi-, halogénezett alkoxi- vagy trifluor-metilcsoporttal szubsztituált, öt- vagy hattagú heterociklus,

B $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{R}^2)-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}=\text{C}(\text{R}^2)-\text{CH}_2-$ vagy $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{R}^2)=\text{CH}-$ általános képletű csoport,

R^1 halogénatom, alkil-, vagy alkoxics csoport,

n 0, 1 vagy 2,

m 0 vagy 1,

R^2 és R^3 hidrogénatom vagy alkilcsoport,

R^4 hidrogénatom, hidroxil-, alkoxi- vagy adott esetben szubsztituált alkilcsoport,

Z oxigénatom, kénatom vagy metincsoport lehet --

és a fenti vegyületek savaddíciós sóinak mikrobicidként hatásos mennyiségeit tartalmazó készítmények és az előállításukra szolgáló eljárás képezik.

A találmány tárgyát képező mikrobicid készítmények, növénykórokozó gombák ellen használhatók.

KÖZZÉTETELI PÉLDÁNY

S.B.G. & K.
BUDAPESTI NEMZETKÖZI ÜGYVÉDI
ÉS SZABADALMI IRODA
1061 BUDAPEST, DALSZÍNHÁZ U. 10.
TELEFON: 153-3733

51902/ZE

-55010-

Mikrobicid készítmények-

CIBA-GEIGY AG, Basel, Svájc

Feltaláló: REBLI Peter, Glswil, Svájc

A bejelentés napja: 1990. 06. 28.

Elsőbbsége: 1989. 06. 29. (2411/89-0) Svájc

A találmány tárgyát az (I) általános képletű hetero- ciklusos fenil-éterszármazékok és savaddíciós sóik, valamint olyan mikrobicid készítmények képezik, amelyek hatóanyagként a fenti vegyületek legalább egyikét tartalmazzák. A találmány tárgyát képezik továbbá káros mikroorganizmusok -- elsősorban növényi kórokozó gombák -- elleni védekező eljárások, amelyekben az (I) általános képletű hatóanyagokat alkalmazzuk.

Az (I) általános képletben

X oxigén- vagy kénatom lehet;

Het öt- vagy hattagú heterociklus lehet, amely egy, kettő vagy három egyforma vagy különböző heteroatomot (nitrogén-, oxigén- vagy kénatomot) tartalmazhat és lehet szubsztituálatlan vagy egyszeresen, kétszeresen vagy háromszorosan szubsztituált az alábbi csoportok bármelyikével: halogénatommal, ciano-, nitro-, 1-4 szénatomos alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, halogénezett 1-3 szénatomos alkoxi- vagy trifluor-metilcsoporttal;

- B $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{R}^2)-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}=\text{C}(\text{R}^2)-\text{CH}_2-$ vagy $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{R}^2)=\text{CH}-$
általános képletű csoport lehet;
- R^1 halogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, vagy 1-4 szénatomos
alkoxicsoport lehet;
- n lehet 0, 1 vagy 2;
- m lehet 0 vagy 1;
- R^2 hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport lehet;
- R^3 hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport lehet;
- R^4 hidrogénatom, hidroxil-, 1-3 szénatomos alkoxi- vagy 1-4
szénatomos alkilcsoport lehet; az utóbbi lehet szubsztit-
tuálatlan vagy hidroxil- vagy 1-3 szénatomos alkoxics-
oporttal szubsztituált;
- Z oxigénatom, kénatom vagy metincsoport lehet.
- Az (I) általános képlet magába foglalja a találmány szerinti
vegyületek savaddíciós sóit is.

Az (I) általános képletben felsorolt csoportokra példa-
ként említjük az alábbiakat:

-- az alkilcsoportok -- akár önállóan, akár más csopor-
tok (például alkoxi- vagy halogénezett alkoxicsoportok) ré-
szeként fordulnak elő -- a megadott szénatomszámon belül le-
hetnek egyenes vagy elágazó szénláncúak; ilyenek például a
metil-, etil-, propil- vagy butilcsoport, illetve ezek izo-
mérjei, például az izopropil-, izobutil- vagy terc-butil-
csoport;

-- a halogénatomok lehetnek fluor-, klór-, bróm- vagy jódatomok;

-- a halogénezett alkoxicsoportok lehetnek az egyszerűstől a perhalogénezettig bármilyen mértékig halogénatommal szubsztituáltak; ilyenek például a diklór-metoxi-, fluor-metoxi-, triklór-metoxi-, klór-metoxi-, difluor-metoxi-, 1-fluor-etoxi-, 2-bróm-etoxi-, pentaklór-etoxi-, bróm-metoxi vagy bróm-klór-metoxicsoport;

-- a 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport ciklopropil-, ciklobutil-, ciklopentil- vagy ciklohexilcsoport lehet;

-- a három egyforma vagy különböző heteroatomot (nitrogén-, oxigén- vagy kénatomot) tartalmazó öt- vagy hattagú heterociklus például piridin-, pirimidin-, pirazin-, piridazin-, triazin-, tiazol-, oxazol-, tia-diazol-, oxa-tiazol-, triazol-, pirán- vagy tetrahidrofurángyűrű lehet.

A savaddíciós sók képzésében szervetlen savak (például hidrogén-fluorid, -klorid, -bromid vagy -jodid, kénsav, foszforsav, metafoszforsav vagy salétromsav) vagy szerves savak (például ecetsav, trifluor-ecetsav, triklór-ecetsav, propionsav, borkősav, glikolsav, tiociánsav, tejsav, borostyánkősav, citromsav, benzoésav, fahéjsav, oxálsav, hangyasav, benzol-szulfonsav, p-toluol-szulfonsav, metán-szulfonsav, szalicilsav, 2-fenoxi-benzoésav vagy 2-acetoxi-benzoésav) vehetnek részt. A fenti savakkal ismert módon állíthatók elő a szabad

(I) általános képletű vegyületek addíciós sói.

Az (I) általános képletű vegyületek szobahőmérsékleten stabilak. A növénykórokozó mikroorganizmusok ellen a mezőgazdaságban és a rokon területeken mind a fertőzések megelőzésére (preventív módon), mind a megbetegedések leküzdésére (kuratív módon) felhasználhatók. Az (I) általános képletű vegyületek gombaellenes hatása széles alkalmazási koncentráció-határok között igen jó és alkalmazásuk sem jár nehézségekkel.

Az (I) általános képletű vegyületek közül mikrobicid hatásuk alapján az alábbi csoportokba tartozó vegyületeket tartjuk előnyösekknek:

1a alcsoport: azon (I) általános képletű vegyületek, amelyekben Het legalább egy nitrogénatomot tartalmazó, öt- vagy hattagú heterociklus, R^1 halogénatom, metil- vagy metoxicsoport, n értéke 0 vagy 1, m értéke 0, R^2 és R^3 pedig egymástól függetlenül hidrogénatom vagy metilcsoport.

1aa alcsoport: azon, az 1a alcsoportba tartozó, különösen előnyös vegyületek, amelyekben X jelentése oxigénatom, R^4 jelentése pedig hidrogénatom, hidroxil-, metil-, metoxi-, hidroxil-metil-, hidroxil-etil-, metoxi-metil- vagy metoxi-etylcsoport;

1b alcsoport: az 1aa alcsoporton belül azon fontos vegyületek, amelyek esetében Het jelentése helyettesítetlen

vagy helyettesített piridilcsoport;

1bb alcsoport: az 1b alcsoport azon vegyületei, amelyek esetében B jelentése 2-metil-propilén- vagy 2-metil-propeniléncsoport, a piridilcsoport pedig helyettesítetlen vagy legfeljebb kétszeresen, azonos vagy különböző csoportokkal helyettesített, és szubsztituenseit az alábbi csoportok adják: halogénatom, nitro-, difluor-metoxi- vagy trifluor-metilcsoport; ezen belül különösen fontosak azok a vegyületek, amelyekben Z oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek;

1c alcsoport: az 1aa alcsoporton belül azon fontos vegyületek, amelyek esetében Het jelentése helyettesítetlen vagy helyettesített pirimidinilcsoport;

1cc alcsoport: az 1c alcsoport azon vegyületei, amelyek esetében B jelentése 2-metil-propilén- vagy 2-metil-propeniléncsoport, a pirimidinilcsoport pedig helyettesítetlen vagy egyszerestől háromszorosig azonos vagy különböző csoportokkal helyettesített és szubsztituenseit az alábbi csoportok adják: halogénatom, 1-4 szénatomos alkil- vagy ciklopropilcsoport; ezen belül különösen fontosak azok a vegyületek, amelyekben Z oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak, és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek;

1d alcsoport: az 1aa alcsoporton belül azon fontos vegyületek, amelyek esetében Het jelentése helyettesítetlen vagy helyettesített pirazinilcsoport;

idd alcsoport: az 1d alcsoport azon vegyületei, amelyek esetében B jelentése 2-metil-propilén- vagy 2-metil-propenilén-csoport, a pirazinilcsoport pedig helyettesítetlen vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy halogénatommal legfeljebb kétszeresen helyettesített; ezen belül különösen fontosak azok a vegyületek, amelyekben Z oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek;

1e alcsoport: az 1aa alcsoporton belül azon fontos vegyületek, amelyek esetében Het jelentése helyettesítetlen vagy helyettesített 1,3,5-triazinilcsoport;

1ee alcsoport: az 1e alcsoport azon vegyületei, amelyek esetében B jelentése 2-metil-propilén- vagy 2-metil-propenilén-csoport, az 1,3,5-triazinilcsoport pedig helyettesítetlen vagy alkilcsoporttal és/vagy halogénatommal helyettesített; ezen belül különösen fontosak azok a vegyületek, amelyekben Z oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek;

1f alcsoport: az 1aa alcsoporton belül azon fontos vegyületek, amelyek esetében Het jelentése helyettesítetlen

vagy helyettesített tiazolilcsoport;

1ff alcsoport: az 1f alcsoport azon vegyületei, amelyek esetében B jelentése 2-metil-propilén- vagy 2-metil-propenilcsoport, a tiazolilcsoport pedig helyettesítetlen vagy nitrátcsoporttal vagy halogénatommal egyszeresen helyettesített; ezen belül különösen fontosak azok a vegyületek, amelyekben Z oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek;

1g alcsoport: az 1aa alcsoporton belül azon fontos vegyületek, amelyek esetében Het jelentése oxazolilcsoport; mindenek előtt azok, amelyekben Z oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek;

1h alcsoport: az 1aa alcsoporton belül azon fontos vegyületek, amelyek esetében Het jelentése helyettesítetlen vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített 1,2,4-triazolilcsoport; mindenek előtt azok, amelyekben Z oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek;

1i alcsoport: az 1aa alcsoporton belül azon fontos vegyületek, amelyek esetében Het jelentése helyettesítetlen vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített 1,2,4-imidazolilcsoport; mindenek előtt azok, amelyekben Z oxigén-

atom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek;

1j alcsoport: az 1aa alcsoporton belül azon fontos vegyületek, amelyek esetében Het jelentése oxa-diazolilcsoport; mindenek előtt azok, amelyekben Z oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek;

1k alcsoport: az 1aa alcsoporton belül azon fontos vegyületek, amelyek esetében Het jelentése tia-diazolilcsoport; mindenek előtt azok, amelyekben Z oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek;

1m alcsoport: azon (I) általános képletű vegyületek fontos alcsoportja, amelyekben Het jelentése helyettesítetlen vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy halogénatommal legfeljebb kétszeresen helyettesített tienilcsoport;

1mm alcsoport: azon, az 1m alcsoportba tartozó, különösen előnyös vegyületek, amelyekben X jelentése oxigénatom, n értéke 0 vagy 1, m értéke 0, R^1 halogénatom, metil- vagy metoxicsoport, R^2 hidrogénatom vagy metilcsoport, R^3 hidrogénatom vagy metilcsoport, R^4 pedig hidrogénatom, metil-, hidroxil-, metoxi-, hidroxil-metil- vagy metoxi-metilcsoport; ezen belül különösen fontosak azok a vegyületek, amelyekben Z oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel

szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek.

Azokat az (I) általános képletű vegyületeket, amelyek esetében m értéke 0, úgy állíthatjuk elő, hogy

a) egy (II) általános képletű aminszármazékot egy (III) általános képletű heterociklusos vegyülettel reagáltatunk, vagy

b) egy (IV) általános képletű heterociklusos difenil-
-éterszármazékot (ahol C egy nukleofil lelépőcsoportot je-
lent) egy (V) általános képletű aminszármazékkal kondenzál-
tatunk.

A (II) és (III) általános képletekben A^1 és A^2 egyike egy nukleofil lelépőcsoportot, másika egy $-XMe$ általános ké-
pletű csoportot jelent, ahol Me hidrogénatom, vagy előnyösen
fémion lehet.

Előnyös, ha A^1 jelentése $-XMe$; a fémion lehet például
alkálifém- (lítium-, nátrium- vagy kálium-) vagy alkáliföld-
fém- (magnézium-, kalcium-, stroncium- vagy bárium-) -ion.

A nukleofil lelépőcsoport például egy reakcióképes, ész-
teresített hidroxilcsoport lehet. Az észteresítő sav lehet
egy hidrogén-halogenid (például hidrogén-fluorid, -klorid,
-bromid vagy -jodid), egy rövid szénláncú alkánszulfonsav
vagy egy adott esetben szubsztituált benzol- vagy halogén-
szulfonsav (például metán-, etán-, benzol-, p-toluol- vagy

fluorszulfonsav).

Azok a (II) általános képletű vegyületek, amelyek esetében A^1 jelentése hidroxil- vagy merkaptocsoport, részben ismertek vagy ismert eljárásokkal (például az EP-A 262870 szabadalmi leírás nyomán) előállíthatók.

R^1 , R^3 , R^4 , B, X és Z jelentései, valamint n értékei megegyeznek az (I) általános képletben megadottakkal.

Az a) reakciót előnyösen egy mérsékelten poláros, de a reakció szempontjából inert szerves oldószerben (például dimetil-formamidban, N,N-dimetil-acetamidban, acetonitrilben, benzonitrilben vagy hasonló oldószerben), esetleg az előbbiek és más inert oldószeres, például alifás vagy aromás szénhidrogének (benzol, toluol, xilol, hexán, petroléter, klór-benzol, nitro-benzol vagy hasonló vegyületek keverékében hajtjuk végre. A reakció hőmérséklete 0 - 220 °C között, előnyösen 120 - 170 °C között lehet; célszerű a reakcióelegy visszafolyatós hűtő alatt történő forralása.

A b) reakciót 0 - 120 °C közötti hőmérsékleten, oldószer nélkül vagy oldószerben végezhetjük. Oldószerként használhatunk étereket (például dietil-étert, tetrahidrofuránt vagy dioxánt), alkoholokat (például etilén-glikolt, metanolt vagy etanolt), dimetil-formamidot, dimetil-acetamidot, dimetil-szulfoxidot vagy hasonló vegyületeket, de oldószer lehet az (V) általános képletű aminszármazék feleslege is.

Azokat az (I) általános képletű vegyületeket, amelyek esetében m értéke 0, B jelentése pedig $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{R}^2)=\text{CH}-$ vagy $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{R}^2)-\text{CH}_2-$ általános képletű csoport, úgy állíthatjuk elő, hogy

c) egy (VI) általános képletű aldehidszármazékot egy (V) általános képletű aminszármazékkal egy (VII) általános képletű vegyületté reagáltatunk, majd az utóbbi kettős kötését hidrogénezzve kapjuk a megfelelő (I) általános képletű vegyületet.

Az aldehid és amin reakcióját $-25 - 300\text{ }^{\circ}\text{C}$, előnyösen $10 - 200\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti hőmérsékleten, célszerűen egy inert oldószerben végezhetjük. Oldószerként alifás vagy aromás, adott esetben klórozott szénhidrogéneket (például petrolétert, hexánt, toluolt, xilolt, benzolt, klór-benzolt, metilén-dikloridot, kloroformot, etilén-dikloridot vagy etilén-dibromidot), étereket (például dietil-étert, metil-terc-butil-étert, dioxánt vagy tetrahidrofuránt), alkoholokat (metanolt, etanolt, etilén-glikolt vagy glicerint) vagy észtereket (metil- vagy etil-acetátot) használhatunk. Előnyös egy víz-elvonószer jelenléte a reakcióelegyben, ami lehet például vízmentes nátrium-szulfát, magnézium-szulfát, kalcium-klorid, alumínium(III)-oxid, szilikagél vagy molekulaszűrő dextrán-származék. Savak (például hidrogén-klorid, hidrogén-bromid, kénsav, salétromsav, ecetsav, benzol-szulfonsav,

p-toluol-szulfonsav, metán-szulfonsav vagy hasonló savak) katalitikusan gyorsíthatják a reakciót.

Ha egy (VII) általános képletű telítetlen enaminszármazékot a találmány oltalmi körébe tartozó (I) általános képletű vegyületté alakítunk át, a hidrogénezéshez fém-hidrideket [például nátrium-, kálium- vagy lítium-(tetrahydrido-borát)-ot] használhatunk redukálószerként. A redukció oldószerben vagy oldószer-keverékben végezhető el, ami a fent felsorolt alkoholok, éterek, észterek és szénhidrogének mellett ecetsav vagy víz is lehet. Redukálószerként szerepelhetnek -[tetrahydrido-aluminát(III)] származékok, így lítium- vagy diizobutil-[tetrahydrido-aluminát(III)] is; ebben az esetben a felsorolt étereket vagy szénhidrogéneket, illetve azok keverékeit használhatjuk. A reakció hőmérséklete $-60 - 200\text{ }^{\circ}\text{C}$, előnyösen $-20 - 120\text{ }^{\circ}\text{C}$ között lehet.

Redukálószerként hangyasavat is használhatunk, amikor a reakciót előnyösen oldószer nélkül végezzük. A hangyasavat $0 - 100\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti hőmérsékleten a redukálandó enaminszármazékhoz csepegtetjük, szükség esetén hűtést alkalmazunk.

A (VII) általános képletű vegyületek katalitikus úton is hidrogénezhetők. A katalizátorok nemesfémek (platina, palládium) lehetnek, előnyösen faszénre felhordva, de lehet Raney-nikkel is. Előnyös a faszénre felhordott palládium használata. A reakciót $0 - 50\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti hőmérsékleten,

szénhidrogénekben (benzol, toluol vagy xilol) vagy alkoholokban (metanol vagy etanol), előnyösen szobahőmérsékleten toluolban végezhetjük el.

Az a), b) vagy c) pontokban leírt módon előállított (I) általános képletű vegyületek ($m = 0$) a megfelelő N-oxidokká ($m = 0$) alakíthatók át. Oxidálószerként hidrogénperoxidot, perbenzoesavat vagy 4-klór-perbenzoesavat használhatunk; a reakciót $-20 - 200\text{ }^{\circ}\text{C}$, előnyösen $0 - 120\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti hőmérsékleten, egy inert oldószerben végezhetjük el. Oldószerként klórozott szénhidrogéneket (például kloroformot, metilén-dikloridot vagy etilén-dikloridot), alkoholokat (például metanolt, etanolt vagy etilén-glikolt), étereket (például dietil-étert, tetrahidrofuránt vagy dioxánt), dimetil-formamidot, dimetil-acetamidot vagy dimetil-szulfoxidot használhatunk önmagukban vagy keverékekben.

Az a), b) és c) pontokban leírt eljárások az összes lehetséges változataikkal együtt, valamint adott esetben az N-oxidok előállítására szolgáló reakciólépés egyaránt a találmány oltalmi körébe tartozik.

A (IV) és (VI) általános képletű vegyületek újak, de a preparatív szerves kémia megfelelő módszereivel (például a DE-OS 2752135 szabadalmi leírásban megadott eljárással analóg módon) egyszerűen előállíthatók.

Azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek

esetében B jelentése a $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{R}^2)-\text{CH}_2-$ (propilén-) csoport és R^2 jelentése alkilcsoport, egy aszimmetriacentrumot tartalmaznak és így két enantiomérjük van. Az előállítás során rendszerint az enantiomerek elegye keletkezik, amelyeket megfelelő módszerekkel (például optikailag aktív erős savakkal képzett sóik frakcionált kristályosításával) elválaszthatunk egymástól. Az enantiomerek biológiai aktivitása különböző lehet.

Azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek esetében B jelentése $-\text{CH}_2=\text{C}(\text{R}^2)\text{CH}-$ (propenilén-) csoport, a kettős kötés miatt cisz-transz izomériát mutatnak. A diasztereomerek biológiai aktivitása között is lehetnek különbségek.

Mind a tiszta enantiomerek és diasztereomerek, mind keverékeik a találmány oltalmi körébe tartoznak.

Meglepetéssel tapasztaltuk, hogy az (I) általános képletű vegyületeknek a gyakorlati igényeket kielégítő antimikrobiális spektruma van baktériumok és gombák ellen. Igen előnyös kuratív, preventív és szisztémikus hatásuk következtében kultúrnövények védelmére használhatók fel, melynek során teljes növényeket vagy növényi részeket (gyümölcsök, virágok, lomboszat, szár, gumók, gyökérzet stb.) kezelünk velük a mikroorganizmusok okozta fertőzések fellépésének meggátolása vagy visszaszorítása érdekében, hogy a később fejlődő növényi részek a kórokozóktól mentesek legyenek.

A találmány oltalmi körébe tartozó hatóanyagok az alábbi növénykórokozó gombák ellen hatásosak:

Tömlősgombák (Ascomycetes): lisztharmatok (*Erysiphe*, *Podosphaera*, *Uncinula*), *Monilia*, *Pyrenophora*, *Venturia*;

Bazídiumos gombák (Basidiomycetes): rozsdagombák (*Puccinia*), *Hemileia*, *Rhizoctonia*;

Fungi imperfecti: *Alternaria*, *Botrytis*, *Cercospora*, *Colletotrichum*, *Fusarium*, *Helminthosporium*, *Pseudocercospora*, *Rhynchosporium*, *Septoria*.

A felsorolt nemzetségekbe tartozó gombafajok ellen az (I) általános képletű vegyületek szisztemikusan is hatásosak, de alkalmazhatók csávázószerként szaporítóanyagok (magvak, gumók, egyéb termések) vagy palánták kezelésére is a talajból eredő gombafertőzések leküzdésére. A találmány oltalmi körébe tartozó hatóanyagok növénykárosító mellékhatása különösen csekély.

A találmány tárgyához tartoznak tehát az (I) általános képletű vegyületeket hatóanyagként tartalmazó mikrobicid készítmények, valamint ezek felhasználása kórokozó mikroorganizmusok, különösen növénykórokozó gombák elleni védekezésre vagy a növények fertőződésének megelőzésére.

A fent meghatározott felhasználási területen belül például a következő kultúrnövényeket említhetjük meg: gabonafélék: búza, árpa, rozs, zab, rizs, köles stb.;

répafélék: cukor- és takarmányrépa;

gyümölcsfák és bogyósgyümölcsűek: alma, körte, szilva,

őszibarack, mandula, cseresznye, meggy, szamóca,

ribiszke, málna stb;

hüvelyesek: bab, borsó, lencse, szója;

olajnövények: repce, mák, mustár, olajfa, napraforgó, kókusz-

pálma, ricinus, kakaó, földimogyoró;

kabakosok: tök, uborka, dinnyék;

rostnövények: gyapot, len, kender, juta;

zöldségfélék: paraj, saláta, spárga, káposztafélék, sárga-

répa, hagymák, paprika, paradicsom, burgonya;

fűszernövények: avokádó, fahéjfa, kámforfa;

vagy más kultúrnövények: kukorica, dohány, mogyoró, dió, tea,

cukornád, szőlő, komló, banán, kaucsukfa;

illetve dísznövények: virágok, díszcserjék, levélzöldek, tű-

levelűek; a felsorolás nem kizárólagos.

Az (I) általános képletű hatóanyagok kombinációkban is használhatók, amikor más hatóanyagokkal együtt, egyidőben vagy egymás után juttatjuk ki azokat a kezelendő felületre vagy növényekre. A kombinációkban szereplő más hatóanyagok lehetnek műtrágyák, nyomelem-keverékek vagy más, a növények növekedését és fejlődését befolyásoló anyagok, de lehetnek növényvédőszeresek, így szelektív gyomirtószeresek, fungicidek, baktericidek, nematicidek vagy csigaölőszeresek, illetve ezek

keverékei is. A kombinált készítmények a formálás-technika ismert hordozóanyagait, tenzidjeit és más, az alkalmazást elősegítő anyagokat is tartalmazhatnak.

A hordozók és adalékok lehetnek szilárdak vagy folyékonnyak, de különösen a formálás-technikából ismert, természetes vagy átalakított ásványi anyagok, oldó-, diszpergáló-, nedvesítő-, tapadás-fokozó-, terület-fokozó szerek vagy kötőanyagok lehetnek.

Az (I) általános képletű vegyületekből --előnyösen a formálás-technikából ismert adalékanyagok segítségével-- kijuttatásra alkalmas készítmények, például emulgeálható koncentrátumok, ecsetelhető kenőcsök, közvetlenül permetezhető vagy higitandó oldatok, híg emulziók, nedvesíthető vagy oldható porkészítmények, porozószerke, granulátumok vagy mikrokapszulázott (például műanyagokba) készítmények állíthatók elő ismert eljárásokkal. Az alkalmazott mennyiség az adott szertől, az alkalmazás céljától és körülményeitől függ: mezőgazdasági alkalmazás esetén a megfelelő mennyiség általában 50 g - 5 kg hatóanyag/ha, előnyösen 100 g - 2 kg /ha, különösen 150 g - 800 g /ha.

Oldószerként aromás szénhidrogének, előnyösen a 8 - 12 szénatomos származékok (például xilol-keverékek vagy szubsztituált naftalinszármazékok), ftálsavszármazékok (például dibutil- vagy dioktil-ftalát), alifás szénhidrogének (például

ciklohexán vagy paraffinok), alkoholok, glikolok, éterek vagy észterek (például etanol, etilén-glikol, etilén-glikol-monometil- vagy monoetil-éter), ketonok (például ciklohexanon), erősen poláros oldószerek (például N-metil-2-pirrolidon, dimetil-szulfoxid vagy dimetil-formamid), adott esetben epoxidált kókusz- vagy szójaolaj) vagy víz jöhetnek számításba. Az alkalmazást elősegítő adalékanyagok közül különösen előnyös a természetes (állati vagy növényi) vagy szintetikus, kefalín- és lecitin-típusú foszfolipidek (például foszfatidil-etanol-amin, foszfatidil-szerin, foszfatidil-glicerin vagy lizolecitin) használata, mert segítségükkel a kijuttatandó hatóanyag mennyisége jelentősen csökkenthető.

Az (I) általános képletű vegyületek formálásához a felületaktív anyagok közül azok a nem-ionos, kationos és/vagy anionos tenzidek jöhetnek számításba, amelyek emulgeáló-, diszpergáló- vagy nedvesítőképessege megfelel az adott hatóanyag fizikai tulajdonságainak. Az ilyen anyagokat kézikönyvek [McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual (BC Publishing Corp., Rindwood, N. J., 1981); H. Stache: Tensid-Taschenbuch (Carl Hauser Verlag, München/Wien, 1981); M. és J. Ash: Encyclopedia of Surfactants, Vol. I.-III. (Chemical Publishing Co., New York, 1980-81)] ismertetik kimerítően.

A mezőgazdaság számára készült készítmények általában 0,1 - 99 tömeg%, különösen 0,2 - 95 tömeg% (I) általános

képletű vegyületet (mint hatóanyagot), valamint általában 99,9 - 1 tömeg%, különösen 99,8 - 5 tömeg% szilárd vagy folyékony hordozóanyagot és ezen belül általában 0 - 25 tömeg%, különösen 0,1 - 25 tömeg% tenzide(ke)t tartalmaznak. Mivel kereskedelmi termékként a magas hatóanyag-tartalmú készítmények az előnyösebbek, a felhasználó általában hígított készítményeket alkalmaz.

A találmány tárgyát képező vegyületek és köztitermékeik előállítását példákon mutatjuk be; a találmány oltalmi köre nem korlátozódik a példákban leírtakra. A példákban megadott (százalékos) arányok tömegre vonatkoznak.

1. példa. 4-{3-[3-(5-(Trifluor-metil)-2-piridil-oxi)-fenil]-2-metil-propil}-2,6-dimetil-morfolin [(1) képletű vegyület] előállítása

3,6 g 4-[3-(3-hidroxi-fenil)-2-metil-propil]-2,6-dimetil-morfolint feloldunk 40 ml vízmentes metanolban, majd szobahőmérsékleten 2,7 g 30 %-os nátrium-metilát oldatot adunk hozzá. Az elegyet 30 percen át forraljuk visszafolyatós hűtő alatt, majd a metanolt vákuumban elpárologtatjuk és a visszamaradó, kristályos nátrium-sót 50 ml vízmentes dimetil-formamidban feloldjuk. Az oldathoz 2,0 g 2-klór-5-(trifluor-metil)-piridint és katalizátorként 0,3 g kálium-jodidot adunk, 18 órán át 100 °C hőmérsékleten keverjük, majd lehűtjük,

150 ml vizet adunk hozzá és háromszor extraháljuk 50 - 50 ml etil-acetáttal. Az egyesített szerves fázist kétszer 100 ml vízzel mossuk, nátrium-szulfáttal vízmentesítjük, szűrjük és az oldószert ledesztilláljuk. A barna, olajos nyersterméket oszlopkromatográfiával (szilikagélen, hexán : etil-acetát = 2 : 1 oldószer-eleggyel) megtisztítva kapjuk a kívánt vegyületet sárgás olaj formájában, amelynek törésmutatója

n_D^{23} : 1,5012.

2. példa. 4-[3-[3-(2,5-Diklór-3-piridil-oxi)-fenil]-2-metil-propil]-2,6-dimetil-morfolin [(2) képletű vegyület] előállítása

3,6 g 4-[3-(3-hidroxi-fenil)-2-metil-propil]-2,6-dimetil-morfolint feloldunk 40 ml vízmentes metanolban, majd szobahőmérsékleten 0,8 g szilárd nátrium-metilátot adunk hozzá. Az elegyet 30 percen át forraljuk visszafolyató hűtő alatt, majd a metanolt vákuumban elpárologtatjuk és a visszamaradó, kristályos nátrium-sót 50 ml vízmentes dimetil-acetamidban feloldjuk. Az oldathoz 2,5 g 2,5-diklór-3-fluor-piridint és katalizátorként 0,3 g kálium-jodidot adunk, 20 órán át 120 °C hőmérsékleten keverjük, majd lehűtjük, 250 ml vizet adunk hozzá és háromszor extraháljuk 100 - 100 ml etil-acetáttal. Az egyesített szerves fázist kétszer 150 ml vízzel mossuk, nátrium-szulfáttal vízmentesítjük, szűrjük és az oldószert

ledesztilláljuk. A sötét, olajos nyersterméket oszlopkromatográfiával (szilikagélen, hexán : etil-acetát = 2 : 1 oldószer-eleggyel) megtisztítva kapjuk a kívánt vegyületet sárgás olaj formájában, amelynek törésmutatója n_D^{23} : 1,5508.

3. példa. 3-(3-Benzil-oxi-fenil)-2-metakrolein [(3) képletű vegyület] előállítása

31,8 g benzil-oxi-benzaldehydet 200 ml metanolban feloldunk, 0,5 g porított kálium-hidroxidot adunk hozzá és az oldatot 45 °C -ra melegítjük. Ezen a hőmérsékleten (± 5 °C) egy óra alatt 26,0 g propionaldehydet csepegtetünk hozzá, majd az elegyet további 4 órán át keverjük 40 - 45 °C -on. A reakció végén az oldószert vákuumban ledesztilláljuk, az olajos maradékot 500 ml vízzel felvesszük és háromszor extraháljuk 150 - 150 ml dietil-éterrel. Az egyesített szerves fázist kétszer 200 ml vízzel mossuk, nátrium-szulfáttal vízmentesítjük, szűrjük és bekonzentráljuk. A kívánt vegyület sárgás olaj, amelynek törésmutatója n_D^{20} : 1,6217.

4. példa. 3-(3-Benzil-oxi-fenil)-2-metil-propanol [(4) képletű vegyület] előállítása

350 ml vízmentes tetrahidrofuránban feloldott 10 g lítium-[tetrahidrido-aluminát(III)] -ot áramló nitrogéngáz és visszafolyató hűtő alatt felforralunk, majd két óra alatt

hozzacsepegtetünk 70 ml vízmentes tetrahidrofuránban feloldott 44,2 g 3-(3-benzil-oxi-fenil)-2-metil-akroleint [(3) képletű vegyületet]. 3 óra forralás után a reakcióelegyet szobahőmérsékletűre hűtjük, majd hűtés közben, óvatosan 250 ml jeges vizet csepegtetünk hozzá. Az elegyet összerázzuk 300 ml dietil-éterrel, diatómaföld- (Hyflo-) rétegen megszűrjük, a szerves fázist elkülönítjük, a vizes fázist még kétszer 250 ml dietil-éterrel extraháljuk. Az egyesített szerves fázist háromszor 250 ml vízzel mossuk, nátrium-szulfáttal vízmentesítjük, szűrjük és az oldószert vákuumban ledesztilláljuk. Az olajos maradékot oszlopkromatográfiával (szilikagél, hexán : etil-acetát = 3 : 1) megtisztítva és az oldószert ledesztillálva sárgás olajat kapunk, aminek törésmutatója $n_D^{22} : 1,5624$.

5. példa. 1-[(p-Toluolszulfonil)-oxi]-2-metil-3-(benzil-oxi-fenil)-propán [(5) képletű vegyület] előállítás

21,0 g 3-(3-benzil-oxi-fenil)-2-metil-propanolt 80 ml piridinben feloldunk, majd a -5 °C -ra hűtött oldathoz folyamatos hűtés közben, egy órán belül 17,2 g p-toluolszulfonil-kloridot adagolunk. Az elegyet 0 °C hőmérsékleten keverjük 4 órán át, majd 300 ml jeges vízbe öntjük és háromszor 200 ml dietil-éterrel extraháljuk. Az egyesített szerves

fázist kétszer 150 ml 2 n sósav-oldattal és háromszor 200 ml vízzel mossuk, nátrium-szulfáttal vízmentesítjük, szűrjük és az oldószert vákuumban ledesztilláljuk. Az olajos maradékot oszlopkromatográfiával (szilikagél, hexán : etil-acetát = 1 : 1) megtisztítva és az oldószert ledesztillálva sárgás olajat kapunk, aminek törésmutatója n_D^{22} : 1,5667.

6. példa. 4-[3-(3-Benzil-oxi-fenil)-2-metil-propil]-2,6-dimetil-morfolin [(6) képletű vegyület] előállítása

8,7 g 1-[(p-toluolszulfonil)-oxi]-2-metil-3-(benzil-oxi-fenil)-propánt [(5) képletű vegyületet] és 5,6 g dimetil-morfolint 100 °C hőmérsékleten keverünk másfél órán át, majd a szobahőmérsékletre lehűtött elegyhez 50 ml vizet és 50 ml etil-acetátot adunk. A szerves fázist elválasztjuk, a vizes fázist kétszer 50 ml etil-acetáttal extraháljuk, az egyesített szerves fázist háromszor 150 ml vízzel mossuk, nátrium-szulfáttal vízmentesítjük, szűrjük és bekonzentráljuk. Az olajos maradékot oszlopkromatográfiával (szilikagél, hexán : etil-acetát = 2 : 1) megtisztítva és az oldószert ledesztillálva sárgás olajat kapunk, aminek törésmutatója n_D^{22} : 1,5381.

7. példa. 4-[3-(3-Hidroxi-fenil]-2-metil-propil]-2,6-dimetil-morfolin [(7) képletű vegyület] előállítás

10,0 g 4-[3-(3-benzil-oxi-fenil]-2-metil-propil]-2,6-dimetil-morfolint [(6) képletű vegyületet] 70 ml etil-acetátban, 1,0 g (5 %) palládium-szén katalizátor jelenlétében hidrogénezünk 19 órán át, szobahőmérsékleten. A reakció végén a katalizátort szűrőssel eltávolítjuk és az oldószert vákuumban ledesztilláljuk. A kívánt termék sárgás színű, viszkózus olaj, aminek törésmutatója n_D^{55} : 1,5109.

A példákban bemutatott módon előállított vegyületeket az 1. - 3. táblázatokban soroljuk fel. A táblázatokban használt rövidítések jelentése a következő:

MOR:	morfolinocsoport	[(a) ált. képlet]
PIP:	piperidinocsoport	[(b) ált. képlet]
DMMOR:	dimetil-morfolinocsoport	[(c) ált. képlet]
DMPIP:	dimetil-piperidinocsoport	[(d) ált. képlet]
cisz-DMMOR:	cisz-dimetil-morfolinocsop.	[(f) á. képl.]
transz-DMMOR:	transz-dimetil-morfolinocsop.	[(g) á. képl.]
cisz-DMPIP:	cisz-dimetil-piperidinocsop.	[(e) á. képl.]
transz-DMPIP:	transz-dimetil-piperidinocs.	[(h) á. képl.]

1. táblázat. Az (Ia) általános képletű vegyületek

Vegyület száma	Q	A	X	Fizikai jellemző
1. 1.	5-(trifluor-metil)-2-piridil-	DMMOR	O	n_D^{23} : 1,5012
1. 2. a	3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil-	cisz-DMPiP	O	n_D^{39} : 1,5083
1. 2. b	3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil-	transz-DMPiP	O	n_D^{39} : 1,5088
1. 3.	2,5-diklór-3-piridil-	PIP	S	
1. 4.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	PIP	O	
1. 5.	2-tienil-	MOR	O	
1. 6.	2-piridil-	DMMOR	O	
1. 7.	5-(trifluor-metil)-2-piridil-	tioMOR	O	
1. 8.	2-pirimidinil-	3-Me-PIP	O	
1. 9.	2-tiazolil-	PIP	O	
1. 10.	4-ciklopropil-6-metil-2-pirimidinil-	DMMOR	O	
1. 11.	3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil-	MOR	O	
1. 12.	5-terc-butil-2-tienil-	DMMOR	O	
1. 13.	2-pirazinil-	PIP	O	
1. 14.	5-(trifluor-metil)-2-piridil-	cisz-DMMOR	O	n_D^{25} : 1,5066
1. 15.	5-(trifluor-metil)-2-piridil-	transz-DMMOR	O	
1. 16.	2,5-diklór-3-piridil-	PIP	O	
1. 17.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	MOR	S	
1. 18.	2-piridil-	PIP	O	
1. 19.	2-tienil-	DMMOR	O	
1. 20.	3,5-diklór-2-piridil-	DMMOR	S	

Vegyület száma	Q	A	X	Fizikai jellemző
1. 21.	5-nitro-2-tiazolil-	PIP	O	
1. 22.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	DMMOR	O	n_D^{25} : 1,5352
1. 23.	5-klór-2-piridil-	PIP	O	
1. 24.	4,6-diklór-2-sz-triazinil-	DMMOR	O	
1. 25.	5-(trifluor-metil)-2-piridil-	PIP	S	
1. 26.	2-pirimidinil-	DMMOR	O	
1. 27.	5-bróm-2-piridil-	PIP	O	
1. 28.	3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil-	cisz-DMMOR	O	n_D^{40} : 1,5090 [nitrát op. 148 °C]
1. 29.	2-tienil-	PIP	O	
1. 30.	3-klór-2-piridil-	3-Me-PIP	O	
1. 31.	3,5-dimetil-2-pirimidinil-	PIP	O	
1. 32.	6-etil-5-klór-4-pirimidinil-	DMMOR	O	
1. 33.	2-tiazolil-	DMMOR	O	
1. 34.	5-(trifluor-metil)-2-piridil-	DMPiP	O	
1. 35.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	transz-DMMOR	O	
1. 36.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	cisz-DMMOR	O	n_D^{40} : 1,5314 [nitrát op. 128 °C]
1. 37.	2-pirimidinil-	PIP	O	
1. 38.	3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil-	tioMOR	S	
1. 39.	2,5-diklór-3-piridil-	DMMOR	O	n_D^{25} : 1,5508
1. 40.	2-piridil-	MOR	O	
1. 41.	3,5-diklór-2-piridil-	PIP	O	

Vegyület száma	Q	A	X	Fizikai jellemző
1. 42.	5-terc-butil-2-tienil-	PIP	O	
1. 43.	5-klór-2-piridil-	tioMOR	O	
1. 44.	3-klór-2-piridil-	MOR	O	
1. 45.	2, 5-diklór-3-piridil-	DMPiP	O	
1. 46.	2-pirazinil-	DMMOR	S	
1. 47.	5-(trifluor-metil)-2-piridil-	3-(OH-Me)-PIP	O	
1. 48.	2-tienil-	cisz-DMMOR	O	
1. 49.	2-tienil-	transz-DMMOR	O	
1. 50.	3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil-	DMMOR	O	
1. 51.	5-bróm-2-piridil-	DMMOR	O	n_D^{42} : 1,5483
1. 52.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	MOR	O	
1. 53.	6-etil-5-klór-4-pirimidinil-	PIP	O	
1. 54.	2-piridil-	DMMOR	S	
1. 55.	5-klór-2-piridil-	3-Me-PIP	O	
1. 56.	4-pirimidinil-	DMMOR	O	
1. 57.	5-(trifluor-metil)-2-piridil-	cisz-DMPiP	O	
1. 58.	2-pirimidinil-	MOR	O	
1. 59.	2, 5-diklór-3-piridil-	MOR	O	
1. 60.	3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil-	4-Me-PIP	O	
1. 61.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	DMPiP	O	n_D^{35} : 1,5320
1. 62.	2-tienil-	DMMOR	S	
1. 63.	3, 5-diklór-2-piridil-	DMPiP	O	
1. 64.	3-klór-2-piridil-	DMMOR	O	

Vegyület száma	Q	A	X	Fizikai jellemző
1. 65.	5-klór-2-tienil-	PIP	O	
1. 66.	2-pirazinil-	DMMOR	O	
1. 67.	5-klór-2-piridil-	DMPiP	O	
1. 68.	3-tienil-	PIP	O	
1. 69.	5-(trifluor-metil)-2-piridil-	MOR	O	
1. 70.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	3-Me-PIP	O	
1. 71.	3,5-diklór-2-piridil-	MOR	O	
1. 72.	5-(trifluor-metil)-2-piridil-	PIP	O	
1. 73.	2,5-diklór-3-piridil-	cisz-DMMOR	O	n_D^{45} : 1,5428
1. 74.	2,5-diklór-3-piridil-	transz-DMMOR	O	
1. 75.	3,5-dimetil-2-pirazinil-	PIP	O	
1. 76.	4,6-dimetil-2-pirimidinil-	cisz-DMMOR	O	n_D^{34} : 1,5288
1. 77.	2-tienil-	3-MeO-PIP	O	
1. 78.	2-pirimidinil-	cisz-DMMOR	O	
1. 79.	5-(trifluor-metil)-2-piridil-	DMMOR	S	
1. 80.	5-bróm-2-piridil-	DMPiP	O	
1. 81.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	3-(MeO-Me)-PIP	O	
1. 82.	3,5-diklór-2-piridil-	DMMOR	O	n_D^{40} : 1,5458
1. 83.	2,5-diklór-3-piridil-	3-(OH-Me)-PIP	O	
1. 84.	5-klór-2-piridil-	DMMOR	S	
1. 85.	5-klór-2-tienil-	3-(MeO-Me)-PIP	O	
1. 86.	3-klór-2-piridil-	DMPiP	O	
1. 87.	4-ciklopropil-6-metil-2-pirimidinil-	PIP	O	

Vegyület száma	Q	A	X	Fizikai jellemző
1. 88.	6-etil-5-klór-4-pirimidinil-	DMPiP	O	
1. 89.	6-metoxi-2-piridil-	PIP	O	
1. 90.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	cisz-DMPiP	O	
1. 91.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	transz-DMMOR	O	
1. 92.	3-nitro-2-piridil-	PIP	O	
1. 93.	5-terc-butil-2-tienil-	DMMOR	S	
1. 94.	5-nitro-2-piridil-	PIP	O	
1. 95.	3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil-	PIP	O	
1. 96.	5-klór-2-tienil-	DMMOR	O	
1. 97.	5-bróm-2-piridil-	transz-DMMOR	O	
1. 98.	4-pirimidinil-	PIP	O	
1. 99.	5-nitro-2-tiazolil-	DMMOR	O	
1. 100.	4-piridil-	PIP	O	
1. 101.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	3-OH-PIP	O	
1. 102.	5-klór-2-piridil-	MOR	O	
1. 103.	2-pirazinil-	DMPiP	O	
1. 104.	3, 5-diklór-2-piridil-	transz-DMMOR	O	
1. 105.	3, 5-diklór-2-piridil-	cisz-DMMOR	O	n_D^{39} : 1, 5454 [nitrát op. 146 °C]
1. 106.	5-klór-2-tienil-	DMPiP	O	
1. 107.	3-tienil-	DMMOR	O	
1. 108.	3-klór-2-piridil-	PIP	O	
1. 109.	5-nitro-2-piridil-	DMMOR	O	

Vegyület száma	Q	A	X	Fizikai jellemző
1.110.	4,6-diklór-2-sz-triazinil-	PIP	O	
1.111.	3-piridil-	DMMOR	O	
1.112.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	DMMOR	S	
1.113.	6-etil-5-klór-4-pirimidinil-	cisz-DMMOR	O	
1.114.	5-klór-2-piridil-	DMMOR	O	
1.115.	4-metil-2-piridil-	PIP	O	
1.116.	4-ciklopropil-6-metil-2-pirimidinil-	tioMOR	O	
1.117.	5-klór-2-tienil-	MOR	O	
1.118.	5-bróm-2-piridil-	4-Me-PIP	O	
1.119.	6-etil-5-klór-4-pirimidinil-	cisz-DMPIP	O	
1.120.	3,5-dimetil-2-pirazinil-	DMMOR	O	
1.121.	4-piridil-	DMMOR	O	
1.122.	3,5-diklór-2-piridil-	3-(MeO-Me)-PIP	O	
1.123.	4-metil-2-piridil-	DMMOR	O	
1.124.	5-terc-butil-2-tienil-	cisz-DMMOR	O	
1.125.	5-terc-butil-2-tienil-	transz-DMMOR	O	
1.126.	5-klór-6-metil-4-piperidinil-	PIP	O	
1.127.	5-klór-2-tienil-	cisz-DMPIP	O	
1.128.	5-pirimidinil-	DMMOR	O	
1.129.	3,5-diklór-2-piridil-	3-Me-PIP	O	
1.130.	5-pirimidinil-	PIP	O	
1.131.	4-pirimidinil-	DMPIP	O	
1.132.	5-terc-butil-2-tienil-	3-Me-PIP	O	

Vegyület száma	Q	A	X	Fizikai jellemző
1.133.	3-klór-2-piridil-	DMMOR	S	
1.134.	3-nitro-2-piridil-	DMMOR	O	
1.135.	3,5-diklór-2-piridil-	cisz-DMPiP	O	
1.136.	5-klór-2-tienil-	DMMOR	S	
1.137.	5-klór-2-piridil-	cisz-DMMOR	O	n_D^{47} : 1,5375
1.138.	5-klór-2-piridil-	transz-DMMOR	O	
1.139.	5-klór-6-metil-4-pirimidinil-	DMMOR	O	
1.140.	5-(difluor-metoxi)-2-piridil-	PIP	O	
1.141.	6-metoxi-2-piridil-	DMMOR	O	
1.142.	5-(difluor-metoxi)-2-piridil-	DMMOR	O	
1.143.	3-piridil-	PIP	O	
1.144.	5-klór-2-piridil-	3-(OH-Me)-PIP	O	
1.145.	5-klór-2-tienil-	transz-DMMOR	O	
1.146.	5-klór-2-tienil-	cisz-DMMOR	O	
1.147.	5-bróm-2-piridil-	3-Me-PIP	O	
1.148.	4-piridil-	DMPiP	O	
1.149.	6-etil-5-klór-4-pirimidinil-	transz-DMMOR	O	
1.150.	5-klór-2-piridil-	3-(MeO-Me)-PIP	O	
1.151.	3-klór-2-piridil-	cisz-DMMOR	O	
1.152.	4-metil-2-oxazolil-	DMMOR	O	
1.153.	5-(trifluor-metil)-2-(1,3,4-oxa-diazolil)-	DMMOR	O	
1.154.	5-metil-2-(1,3,4-oxa-diazolil)-	PIP	O	
1.155.	1-metil-5-(1,2,4-triazolil)-	DMMOR	O	

Vegyület száma	Q	A	X	Fizikai jellemző
1.156. 5-metil-2-oxazolil-		DMMOR	O	
1.157. 5-metil-2-(1,3,4-oxa-diazolil)-		DMMOR	O	
1.158. 1-metil-3-(trifluor-metil)-5-(1,2,4-triazolil)-		DMMOR	O	
1.159. 3-(trifluor-metil)-5-(1H-1,2,4-triazolil)-		DMMOR	O	
1.160. 5-(trifluor-metil)-2-(1,3,4-oxa-diazolil)-		PIP	O	
1.161. 5-izotiazolil-		DMMOR	O	
1.162. 1,2-dimetil-4-imidazolil-		DMMOR	O	
1.163. 1-metil-4-imidazolil-		DMMOR	O	
1.164. 1-metil-3-metoxi-5-(1,2,4-triazolil)-		DMMOR	O	
1.165. 4-metil-5-(trifluor-metil)-2-(1,2,4-triazolil)-		DMMOR	O	
1.166. 4,5-dimetil-2-(1,2,4-triazolil)-		DMMOR	O	
1.167. 5-izoxazolil-		DMMOR	O	
1.168. 3-(fluor-klór-metoxi)-5-klór-2-piridil-		cisz-DMMOR	O	n_D^{40} : 1,5245
1.169. 5-nitro-2-tienil-		cisz-DMMOR	O	n_D^{40} : 1,5632
1.170. 2,5-dietyl-6-klór-4-pirimidinil-		cisz-DMMOR	O	n_D^{40} : 1,5318

2. táblázat. Az (Ib) általános képletű vegyületek

Vegyület száma	--X--Q	T	A
2. 1.	4-[5-(trifluor-metil)-2-piridil-oxi]-	-	DMMOR
2. 2.	4-[3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil-oxi]-	-	MOR
2. 3.	3-(3-fluor-5-klór-2-piridil-oxi)	4-fluor	DMMOR
2. 4.	2-(5-klór-2-piridil-oxi)-	-	PIP
2. 5.	3-(5-klór-3-piridil-oxi)-	-	DMPIP
2. 6.	3-[5-(trifluor-metil)-2-piridil-oxi]-	4-klór	PIP
2. 7.	4-(6-etil-5-klór-4-pirimidinil-oxi)-	-	DMMOR
2. 8.	3-(2-klór-3-piridil-oxi)-	-	PIP
2. 9.	4-(2-tienil-oxi)-	-	DMMOR
2. 10.	3-(3-fluor-5-klór-2-piridil-oxi)-	2-klór	PIP
2. 11.	3-[5-(trifluor-metil)-2-piridil-oxi]-	4-klór	DMMOR
2. 12.	3-(2-klór-3-piridil-tio)-	-	DMMOR
2. 13.	4-[5-(trifluor-metil)-2-piridil-oxi]-	-	PIP
2. 14.	3-(5-klór-2-tienil-oxi)-	4-klór	DMMOR
2. 15.	4-[3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil-oxi]-	-	DMMOR
2. 16.	3-(5-klór-3-piridil-oxi)-	-	PIP
2. 17.	4-(5-klór-2-tienil-oxi)-	-	DMMOR
2. 18.	3-(2,5-diklór-3-piridil-oxi)-	4-fluor	PIP
2. 19.	4-(5-klór-2-piridil-oxi)-	-	DMMOR
2. 20.	4-(3-fluor-5-klór-2-piridil-oxi)-	2-klór	DMMOR
2. 21.	4-(2,5-diklór-3-piridil-oxi)-	-	PIP

Vegyület száma	--X--Q	T	A
2.22.	3-(2-klór-3-piridil-oxi)-	-	DMPIP
2.23.	2-(2-pirimidinil-oxi)-	-	DMMOR
2.24.	3-(3-fluor-5-klór-2-piridil-oxi)-	4-metil	PIP
2.25.	4-(4,6-dimetil-2-pirimidinil-oxi)-	-	DMMOR
2.26.	4-(6-etil-5-klór-3-pirimidinil-oxi)-	-	PIP
2.27.	3-(5-klór-3-piridil-oxi)-	-	DMMOR
2.28.	4-(3-fluor-5-klór-2-piridil-oxi)-	-	PIP
2.29.	3-(5-klór-2-tienil-oxi)-	4-klór	PIP
2.30.	3-(2-klór-3-piridil-oxi)-	-	transz-DMMOR
2.31.	3-(2-klór-3-piridil-oxi)-	-	cisz-DMMOR
2.32.	3-(2,5-diklór-3-piridil-oxi)-	4-fluor	DMMOR
2.33.	4-[3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil-oxi]-	-	PIP
2.34.	3-(2,6-dimetil-4-piridil-oxi)-	-	DMMOR
2.35.	3-(3,5-diklór-2-piridil-oxi)-	4-klór	PIP
2.36.	4-(5-terc-butil-2-tienil-oxi)-	-	PIP
2.37.	2-(5-klór-2-piridil-oxi)-	-	DMMOR
2.38.	3-(3-fluor-5-klór-2-piridil-oxi)-	4-fluor	PIP
2.39.	4-(4-piridil-tio)-	-	DMMOR
2.40.	4-(5-klór-2-piridil-oxi)-	-	PIP
2.41.	3-[5-(trifluor-metil)-2-piridil-oxi]-	4-metoxi	DMMOR
2.42.	4-(2-tienil-oxi)-	-	PIP
2.43.	4-(3-fluor-5-klór-2-piridil-oxi)-	-	DMMOR
2.44.	4-(3-tienil-oxi)-	-	DMMOR

Vegyület száma	--X--Q	T	A
2. 45.	4-(2-pirazinil-oxi)-	-	PIP
2. 46.	3-(3-fluor-5-klór-2-piridil-oxi)-	4-metil	DMMOR
2. 47.	4-(6-etil-5-klór-4-pirimidinil-tio)-	-	DMMOR
2. 48.	3-(5-klór-3-piridil-oxi)-	-	cisz-DMMOR
2. 49.	3-(5-klór-3-piridil-oxi)-	-	transz-DMMOR
2. 50.	3-[3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil-tio]-	4-klór	PIP
2. 51.	4-(4, 6-diklór-2-sz-triazinil-oxi)-	-	DMMOR
2. 52.	3-(2, 6-dimetil-4-piridil-oxi)-	-	PIP
2. 53.	3-[2-(1, 3, 4-tia-diazolil-oxi)-	-	DMMOR
2. 54.	4-(2-pirazinil-oxi)-	-	DMMOR
2. 55.	4-(5-klór-2-tienil-oxi)-	-	PIP
2. 56.	3-(3, 5-diklór-2-piridil-oxi)-	4-klór	DMMOR
2. 57.	3-(2-klór-3-piridil-oxi)-	-	DMMOR
2. 58.	4-(2, 5-diklór-3-piridil-oxi)-	-	DMMOR
2. 59.	4-(5-nitro-2-tiazolil-oxi)-	-	DMMOR
2. 60.	3-[5-(trifluor-metil)-2-piridil-oxi]-	4-metoxi	PIP
2. 61.	4-(3-fluor-5-klór-2-piridil-tio)-	-	DMMOR
2. 62.	4-(5-nitro-2-tiazolil-oxi)-	-	PIP
2. 63.	3-(5-klór-3-piridil-tio)-	-	DMMOR
2. 64.	4-(3-fluor-5-klór-2-piridil-oxi)-	-	transz-DMMOR
2. 65.	4-(3-fluor-5-klór-2-piridil-oxi)-	-	cisz-DMMOR
2. 66.	3-[3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil-tio]-	4-klór	DMMOR
2. 67.	2-(2-piridil-oxi)-	-	DMMOR

Vegyület száma	--X--Q	T	A
2.68.	4-(4-piridil-oxi)-	-	DMMOR
2.69.	3-(2,5-diklór-3-piridil-tio)-	-	DMMOR
2.70.	4-(3,5-dimetil-2-pirazinil-oxi)-	-	DMMOR
2.71.	4-(5-terc-butil-2-tienil-oxi)-	-	DMMOR
2.72.	3-(2-oxazolil-oxi)-	-	PIP
2.73.	3-[4-metil-3-(1,2,4-triazolil)-oxi]-	-	DMMOR

3. táblázat. Az (Ic) általános képletű vegyületek

Vegyület száma	Q	Y	A
3. 1.	4-(trifluor-metil)-2-piridil-	metilén	DMMOR
3. 2.	3-piridazinil-	metil-etilén	PIP
3. 3.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	metil-vinilén	DMMOR
3. 4.	2,5-diklór-3-piridil-	etil-etilén	PIP
3. 5.	4-(trifluor-metil)-2-piridil-	vinilén	DMMOR
3. 6.	5-terc-butil-2-tienil-	metil-vinilén	PIP
3. 7.	2-pirimidinil-	etilén	DMMOR
3. 8.	3,5-diklór-2-piridil-	metil-vinilén	MOR
3. 9.	3,5-diklór-2-piridil-	metil-vinilén	DMMOR
3. 10.	3-fluor-5-klór-2-piridil-	metil-vinilén	PIP
3. 11.	5-klór-2-tiazolil-	metil-vinilén	DMMOR
3. 12.	2,5-diklór-3-piridil-	etil-etilén	DMMOR
3. 13.	2-pirazinil-	metil-vinilén	DMMOR
3. 14.	5-terc-butil-2-tienil-	metil-vinilén	DMMOR
3. 15.	5-klór-2-piridil-	metil-vinilén	PIP
3. 16.	6-etil-5-klór-4-pirimidinil-	metil-vinilén	DMMOR
3. 17.	5-klór-2-piridil-	metil-vinilén	DMMOR
3. 18.	2-oxazolil-	metil-etilén	DMMOR
3. 19.	2-(1,3,4-oxa-diazolil)-	metil-etilén	DMMOR
3. 20.	1-metil-2-imidazolil-	metil-etilén	PIP
3. 21.	2-(1,3,4-oxa-diazolil)-	metil-etilén	PIP

Az (I) általános képletű vegyületeket hatóanyagként tartalmazó készítmények előállítására az alábbiakban mutatunk be példákat.

8. példa. Oldatok készítése

A példában négy különféle összetételű oldat alkotóinak arányát tüntetjük fel tömeg %-ban megadva. Az adott készítmények közvetlen kipermetezésre alkalmasak.

	a)	b)	c)	d)
hatóanyag	80 %	10 %	5 %	95 %
etilénglikol-monometil-éter	20 %	-	-	-
polietilénglikol (mt = 400)	-	70 %	-	-
N-metil-2-pirrolidon	-	20 %	-	-
epoxidált kókuszolaj	-	-	1 %	5 %
benzin (fp. 160 - 190 °C)	-	-	94 %	-

9. példa. Granulátumok készítése

A metilén-dikloridban oldott hatóanyagot a hordozóra permetezzük, majd az oldószert vákuumban elpárologtatjuk.

	a)	b)
hatóanyag	5 %	10 %
kaolin	94 %	-
szilikagél (porított)	1 %	-
attapulgit	-	90 %

10. példa. Porozószerék készítése

A hatóanyag és a hordozó alapos összekeverésével felhasználásra kész porozószeret kapunk.

	a)	b)
hatóanyag	2 %	5 %
szilikagél (porított)	1 %	5 %
talkum	97 %	-
kaolin	-	90 %

11. példa. Nedvesíthető por készítése

A hatóanyagot a hordozóval és segédanyagokkal gondosan összeőröljük; a kapott nedvesíthető porkészítményekből a felhasználás előtt vízzel tetszőleges koncentrációjú szuszpenziót (permetlevet) készítünk.

	a)	b)	c)
hatóanyag	25 %	50 %	75 %
nátrium-(lignin-szulfonát)	5 %	5 %	-
nátrium-(lauril-szulfát)	3 %	-	5 %
nátrium-(diizobutil-naftalin- -szulfonát)	-	6 %	10 %
oktil-fenol-polietilén-glikol- -éter (7-8 mol etilén-oxid)	-	2 %	-
szilikagél (porított)	5 %	10 %	10 %
kaolin	62 %	27 %	-

12. példa. Emulgeálható koncentrátumok készítése

A készítményből vízzel tetszőleges koncentrációjú emulziók (permetlevek) készíthetők.

hatóanyag	10 %
oktil-fenol-polietilén-glikol- -éter (4-5 mol etilén-oxid)	3 %
kalcium-(dodecil-benzolszulfonát)	3 %
ricinusolaj-poliglikol-éter (35 mol etilén-oxid)	4 %
ciklohexanon	30 %
xilol-keverék	50 %

13. példa. Tapadó por készítése

A finomra őrölt hatóanyagot polietilén-glikollal nedvesített kaolinnal alaposan összekeverjük.

hatóanyag	3 %
polietilén-glikol (mt = 200)	3 %
kaolin	94 %

Az (I) általános képletű vegyületek biológiai hatását az alábbi példákban mutatjuk be.

14. példa. Gabonarozsda (*Puccinia graminis*) elleni hatás
vizsgálata búzán

A) Protektív hatás vizsgálata

Hat napos búza-csiranövényeket nedvesíthető porkészítményből készült, 0,02 tömeg % hatóanyagot tartalmazó permetlével kezelünk, majd 24 óra múlva a kezelt növényeket a gomba uredospóráinak vizes szuszpenziójával fertőzzük. 48 órás inkubáció (20 °C, 95 - 100 % relatív páratartalom) után a növényeket üvegházban (22 °C) neveljük tovább. Az értékelés a 12. napon, a rozsda-pusztulák megszámlálásával történik.

B) Szisztémikus hatás vizsgálata

Öt napos búza-csiranövények talaját nedvesíthető porkészítményből készült vizes szuszpenzióval öntözzük be úgy, hogy a talaj térfogatára vonatkoztatott hatóanyag-arány 0,006 % legyen. A fertőzést 48 óra múlva végezzük; a továbbiakban az A) pontban megadott módon járunk el.

A rozsdaferdőzés mértéke a kezeletlen növényeken 100 % volt. Az 1. - 3. táblázatokban felsorolt (I) általános képletű vegyületek a fertőzés mértékét általában 5 - 20 %-ra csökkentették. Különösen jó (0 - 5 % fertőzöttség) hatást mutattak az alábbi vegyületek: 1.1., 1.2a., 1.2b., 1.10., 1.13., 1.14., 1.28., 1.29., 1.31., 1.36., 1.39., 1.42., 1.51., 1.61., 1.75., 1.87., 1.91., 1.105., 1.168. és 1.170.

15. példa. Földimogyoró-levélragya (*Cercospora arachidicola*)
elleni hatás vizsgálata

A) Protektív hatás vizsgálata

10 - 15 cm magasságú földimogyoró-növényeket nedvesíthető porkészítményből készült, 0,02 tömeg % hatóanyagot tartalmazó permetlével kezelünk, majd 48 óra múlva a kezelt növényeket a gomba konídiumainak vizes szuszpenziójával fertőzzük. 72 órás inkubáció (21 °C, magas páratartalom) után a növényeket üvegházban neveljük tovább. Az értékelés a 12. napon, a ragyafoltok számának és méretének meghatározásával történik.

B) Szisztémikus hatás vizsgálata

10 - 15 cm magasságú földimogyoró-növények talaját nedvesíthető porkészítményből készült vizes szuszpenzióval öntözzük be úgy, hogy a talaj térfogatára vonatkoztatott hatóanyag-arány 0,06 % legyen. A fertőzést 48 óra múlva végezzük; a továbbiakban az A) pontban megadott módon járunk el azzal az eltéréssel, hogy az értékelést a 11. napon végezzük.

A kezeletlen növényeken megfigyelhető fertőzéshez (100 %) képest az 1. - 3. táblázatokban felsorolt (I) általános képletű vegyületek erősen csökkentették a levélragya-fertőzés mértékét. Különösen jó (0 - 5 % fertőzöttség) hatást mutattak az alábbi vegyületek: 1.1., 1.6., 1.10., 1.12., 1.13., 1.14., 1.22., 1.24., 1.28., 1.29., 1.31., 1.32., 1.33., 1.36.,

1.39., 1.40., 1.42., 1.43., 1.51., 1.57., 1.58., 1.65.,
 1.75., 1.82., 1.87., 1.91., 1.105., 1.113., 1.124., 1.126.,
 1.140., 1.143., 1.151., 1.168., 1.169., 1.170., 2.1., 2.2.,
 2.17., 2.62., 2.70., 2.71. és 3.2.

16. példa. Gabonalisztharmat (*Erysiphe graminis*) elleni hatás
 vizsgálata árpán

A) Protektív hatás vizsgálata

Mintegy 8 cm magasságú árpanövényeket nedvesíthető por-
 készítményből készült, 0,02 tömeg % hatóanyagot tartalmazó
 permetlével kezelünk, majd 3 - 4 óra múlva a kezelt növénye-
 ket a gomba konídiumaival behintjük. A fertőzött növényeket
 üvegházban (22 °C) neveljük tovább; az értékelés a 10. napon
 történik.

B) Szisztémikus hatás vizsgálata

Mintegy 8 cm magasságú árpanövények talaját nedvesíthe-
 tő porkészítményből készült vizes szuszpenzióval öntözzük be
 úgy, hogy a talaj térfogatára vonatkoztatott hatóanyag-arány
 0,006 % legyen, ügyelve arra, hogy a permetlé ne kerüljön
 érintkezésbe a növények föld feletti részével. A fertőzést 48
 óra múlva végezzük; a továbbiakban az A) pontban megadott
 módon járunk el.

A kezeletlen növényeken a lisztharmat-fertőzés mértéke
 100 % volt. Az (I) általános képletű vegyületek általában jó

hatást mutattak a gabonalisztharmat ellen; különösen jó hatást (0 - 5 % fertőzöttség) mutattak az alábbi vegyületek: 1.1., 1.2a., 1.2b., 1.6., 1.14., 1.20., 1.24., 1.27., 1.28., 1.29., 1.36., 1.40., 1.43., 1.46., 1.61., 1.168., 1.169., 1.170., 2.5., 2.13., 2.14., 2.15., 2.20., 2.24., 2.41., 2.42., 3.1., 3.2. és 3.19.

17. példa. Gyümölcsvarasodás (*Venturia inaequalis*) elleni protektív hatás vizsgálata

10 - 20 cm hosszúságú friss hajtásokat hordozó almafa-dugványokat nedvesíthető porkészítményből készült, 0,06 tömeg % hatóanyagot tartalmazó permetlével kezelünk, majd 24 óra múlva a kezelt növényeket a gomba konídiumainak vizes szuszpenziójával fertőzzük. 5 napos inkubáció (90 - 100 % relatív páratartalom) után a növényeket üvegházban (20 - 24 °C) neveljük tovább. Az értékelés a 15. napon történik.

Az 1. - 3. táblázatokban felsorolt (I) általános képletű vegyületek jól megfigyelhető gátló hatást mutattak a gyümölcsvarasodás ellen. A kezeletlen hajtásokon megfigyelhető fertőzéshez (100 %) képest különösen jó hatást (0 - 5 % fertőzöttség) mutattak az alábbi vegyületek: 1.1., 1.2a., 1.2b., 1.24., 1.28., 1.40., 1.43., 1.168., 1.170., 2.15., 2.20., 2.24. és 3.2.

18. példa. Szürkepenész (*Botrytis cinerea*) elleni protektív
hatás vizsgálata

Mintegy 10 cm magasságú babnövényeket nedvesíthető por-
készítményből készült, 0,02 tömeg % hatóanyagot tartalmazó
permetlével kezelünk, majd 48 óra múlva a kezelt növényeket a
gomba konídiumainak vizes szuszpenziójával fertőzzük. Az ér-
tékelés 3 napos inkubáció (21 °C, 90 - 100 % relatív pára-
tartalom) után történik.

A kezeletlen növényeken fellépő fertőzéshez (100 %) ké-
pest az (I) általános képletű vegyületek többsége számottevő-
en (20 %-nál kisebb mértékűre) csökkentette a fertőzést.

Különösen jó hatást (0 - 5 % fertőzöttség) mutattak az alábbi
vegyületek: 1.1., 1.2., 1.10., 1.14., 1.19., 1.22., 1.24.,
1.26., 1.28., 1.32., 1.39., 1.51., 1.66., 1.78., 1.82.,
1.93., 1.99., 1.120., 1.124., 1.152., 1.157., 1.158., 1.163.,
1.165., 1.168., 1.170., 2.1., 2.9., 2.14., 2.25., 2.53.,
2.59., 3.3 és 3.14.

19. példa. Gyökérpenész (*Rhizoctonia solani*) elleni hatás
vizsgálata

A) Protektív-lokális hatás vizsgálata talajkezeléssel

12 napos rizsnövények talaját formált készítményből
készült, 0,006 tömeg % hatóanyagot tartalmazó permetlével
locsoljuk be úgy, hogy a növények föld feletti részei ne

érintkezhessenek a szerrel, majd a talaj felszínére a gomba micéliumát és szkleróciumait tartalmazó szuszpenziót juttatunk. 6 napos inkubáció (27/23 °C, 100 % relatív páratartalom, klímakamra) után az értékelés a leveleken és a száron megfigyelhető tünetek alapján történik.

B) Protektív-lokális hatás vizsgálata lombkezeléssel

12 napos rizsnövényeket formált készítményből készült permetlével kezelünk, majd egy nap múlva a gomba micéliumát és szkleróciumait tartalmazó szuszpenzióval fertőzünk; a továbbiakban az A) pont szerint járunk el.

A Kezeletlen növényeken fellépő fertőzéshez (100 %) képest az 1. - 3. táblázatokban felsorolt (I) általános képletű vegyületek jó gátló hatást mutattak a gyökérpenész ellen. Különösen jó hatást (0 - 5 % fertőzöttség) mutattak az alábbi vegyületek: 1.1., 1.14., 1.16., 1.17., 1.22., 1.28., 1.39., 1.82., 1.168., 2.1., 2.3., 2.4., 2.14., 2.17., 3.1 és 3.3.

Igénypontok

1. Az (I) általános képletű fenil-éterszármazékok --
a képletben

X oxigén- vagy kénatom lehet;

Het öt- vagy hattagú heterociklus lehet, amely egy, kettő
vagy három egyforma vagy különböző heteroatomot (nit-
rogén-, oxigén- vagy kénatomot) tartalmazhat és lehet
szubsztituálatlan vagy egyszeresen, kétszeresen vagy
háromszorosan szubsztituált az alábbi csoportok bárme-
lyikével: halogénatommal, ciano-, nitro-, 1-4 szénato-
mos alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkil-, 1-4 szénatomos
alkoxi-, halogénezett 1-3 szénatomos alkoxi- vagy
trifluor-metilcsoporttal;

B $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{R}^2)-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}=\text{C}(\text{R}^2)-\text{CH}_2-$ vagy $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{R}^2)=\text{CH}-$
általános képletű csoport lehet;

R^1 halogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, vagy 1-4 szénatomos
alkoxicsoport lehet;

n lehet 0, 1 vagy 2;

m lehet 0 vagy 1;

R^2 hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport lehet;

R^3 hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport lehet;

R^4 hidrogénatom, hidroxil-, 1-3 szénatomos alkoxi- vagy

- 48 -

1-4 szénatomos alkilcsoport lehet; az utóbbi lehet szubsztituálatlan vagy hidroxil- vagy 1-3 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált;

Z oxigénatom, kénatom vagy metincsoport lehet -- és a fenti vegyületek savaddíciós sói.

2. Az 1. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Het jelentése legalább egy nitrogénatomot tartalmazó, öt- vagy hattagú heterociklus, R^1 halogénatom, metil- vagy metoxicsoport, n értéke 0 vagy 1, m értéke 0, R^2 és R^3 pedig egymástól függetlenül hidrogénatom vagy metilcsoport.

3. A 2. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy X jelentése oxigénatom, R^4 jelentése pedig hidrogénatom, hidroxil-, metil-, metoxi-, hidroximetil-, hidroxietil-, metoximetil- vagy metoxietilcsoport.

4. A 3. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Het jelentése helyettesítetlen vagy helyettesített piridilcsoport.

5. A 4. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy B jelentése 2-metil-propilén- vagy 2-metil-propenilcsoport, a piridilcsoport pedig helyettesítetlen vagy

legfeljebb kétszeresen, azonos vagy különböző csoportokkal helyettesített, és szubsztituenseit az alábbi csoportok adják: halogénatom, nitro-, difluor-metoxi- vagy trifluor-metilcsoport.

6. Az 5. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Z jelentése oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek.

7. A 3. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Het jelentése helyettesítetlen vagy helyettesített pirimidinilcsoport.

8. A 7. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy B jelentése 2-metil-propilén- vagy 2-metil-propenilcsoport, a pirimidinilcsoport pedig helyettesítetlen vagy egyszerestől háromszorosig azonos vagy különböző csoportokkal helyettesített és szubsztituenseit az alábbi csoportok adják: halogénatom, 1-4 szénatomos alkil- vagy ciklopropilcsoport.

9. A 8. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Z jelentése oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek.

10. A 3. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Het jelentése helyettesítetlen vagy helyettesített pirazinilcsoport.

11. A 10. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy B jelentése 2-metil-propilén- vagy 2-metil-propenilén-csoport, a pirazinilcsoport pedig helyettesítetlen vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy halogénatommal legfeljebb kétszeresen helyettesített.

12. A 11. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Z jelentése oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek.

13. A 3. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Het jelentése helyettesítetlen vagy helyettesített 1,3,5-triazinilcsoport.

14. A 13. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy B jelentése 2-metil-propilén- vagy 2-metil-propenilén-csoport, az 1,3,5-triazinilcsoport pedig helyettesítetlen vagy alkilcsoporttal és/vagy halogénatommal helyettesített.

15. A 14. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Z jelentése oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek.

16. A 3. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Het jelentése helyettesítetlen vagy helyettesített tiazolilcsoport.

17. A 16. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy B jelentése 2-metil-propilén- vagy 2-metil-propenilén-csoport, a tiazolilcsoport pedig helyettesítetlen vagy nitrátcsoporttal vagy halogénatommal egyszeresen helyettesített.

18. A 17. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Z jelentése oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek.

19. A 3. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Het jelentése oxazolilcsoport, Z jelentése oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek.

20. A 3. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Het jelentése helyettesítetlen vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített 1,2,4-triazolilcsoport, Z jelentése oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek.

21. A 3. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Het jelentése helyettesítetlen vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített 1,2,4-imidazolilcsoport, Z jelentése oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek.

22. A 3. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Het jelentése oxa-diazolilcsoport, Z jelentése oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek.

23. A 3. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Het jelentése tia-diazolilcsoport, Z jelentése oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek.

24. Az 1. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Het jelentése helyettesítetlen vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy halogénatommal legfeljebb kétszeresen helyettesített tienilcsoport.

25. A 24. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy X jelentése oxigénatom, n értéke 0 vagy 1, m értéke 0, R^1 halogénatom, metil- vagy metoxicsoport, R^2 hidrogénatom vagy metilcsoport, R^3 hidrogénatom vagy metilcsoport, R^4 pedig hidrogénatom, metil-, hidroxil-, metoxi-, hidroximetil- vagy metoximetilcsoport.

26. A 25. igénypont szerinti vegyületek, azzal jellemezve, hogy Z jelentése oxigénatom vagy metincsoport, R^3 és R^4 pedig Z-vel szomszédosak és egyformán hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelentenek.

27. Eljárás az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek előállítására, azzal jellemezve, hogy

a) egy (II) általános képletű aminszármazékot egy (III) általános képletű heterociklusos vegyülettel 0 - 220 °C közötti hőmérsékleten reagáltatunk --

a képletekben

A^1 és A^2 egyike egy nukleofil lelépőcsoportot, másika egy

-XMe általános képletű csoportot jelent, ahol

Me hidrogénatom vagy fémion lehet,

R^1 , R^3 , R^4 , B, X és Z jelentései, valamint n értékei meg-
egyeznek az 1. igénypontban megadottakkal;

b) egy (IV) általános képletű heterociklusos difenil-éter-
származékot (ahol C egy nukleofil belépőcsoportot jelent)

0 - 120 °C közötti hőmérsékleten egy (V) általános képletű
aminszármazékkal reagáltatunk --

a képletekben

R^1 , R^3 , R^4 , B, X és Z jelentései, valamint n értékei meg-
egyeznek az 1. igénypontban megadottakkal; vagy

c) ha B jelentése $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{R}^2)=\text{CH}-$ vagy $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{R}^2)-\text{CH}_2-$
általános képletű csoport, úgy egy (VI) általános képletű
aldehidszármazékot -25 - 300 °C közötti hőmérsékleten egy (V)
általános képletű aminszármazékkal egy (VII) általános
képletű vegyületté reagáltatunk, majd adott esetben annak
kettős kötését hidrogénezéssel telítjük --

a képletekben

R^1 , R^3 , R^4 , B, X és Z jelentései, valamint n értékei meg-
egyeznek az 1. igénypontban megadottakkal; továbbá, hogy
az így előállított (I) általános képletű vegyületeket, ame-
lyek esetében m értéke 0, a megfelelő N-oxidokká oxidáljuk,
amelyek esetében m értéke 1.

28. Mikrobicid készítmények, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként legalább egy (I) általános képletű vegyületet tartalmaznak a megfelelő hordozószerrek mellett.

29. A 28. igénypont szerinti mikrobicid készítmények, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként a 2. - 26. igénypontok bármelyike szerinti vegyületek legalább egyikét tartalmazzák.

30. Eljárás növénykórokozó mikroorganizmusok elleni védekezésre, azzal jellemezve, hogy az 1. - 26. igénypontok szerinti vegyületek bármelyikét használjuk.

31. Eljárás növénykórokozó mikroorganizmusok elleni védekezésre, azzal jellemezve, hogy az 1. - 26. igénypontok szerinti (I) általános képletű vegyületek bármelyikével növényeket, növényi részeket vagy növények termőhelyét kezeljük.

32. A 31. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy a kezelt növényi részek szaporítóanyagok.

A meghatalmazott

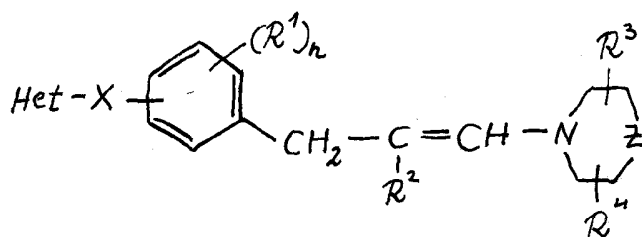
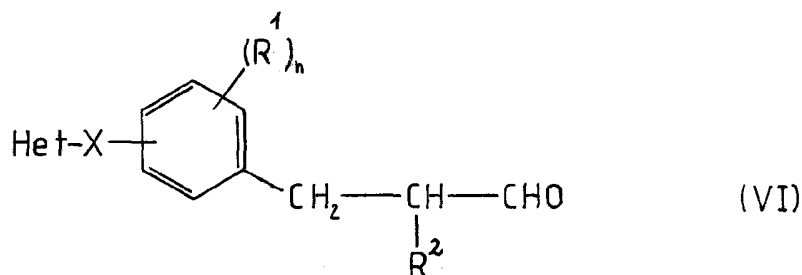
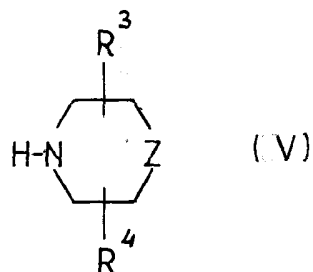
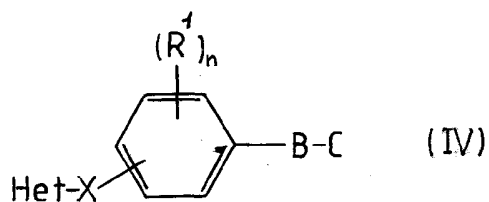
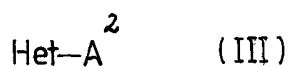
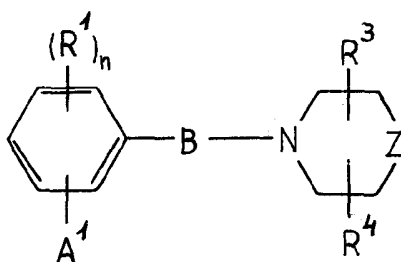
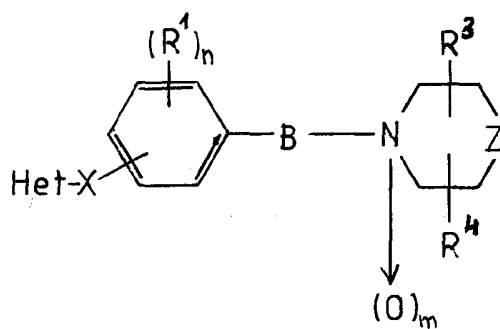
S.B.G. & K.
BUDAPESTI NEMZETKÖZI ÜGYVÉDI
ÉS SZABADALMI IRODA
1061 BUDAPEST, DALSZÍNHÁZ U. 10.
TELEFON: 153-3723

4008/90

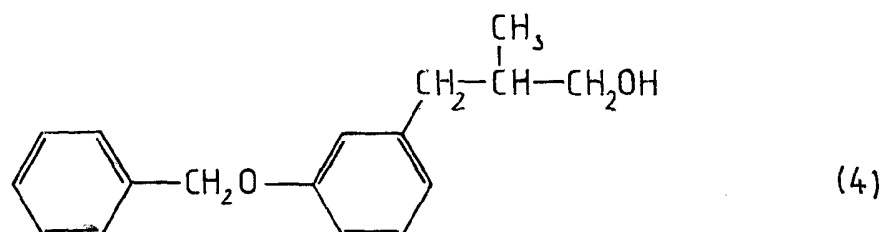
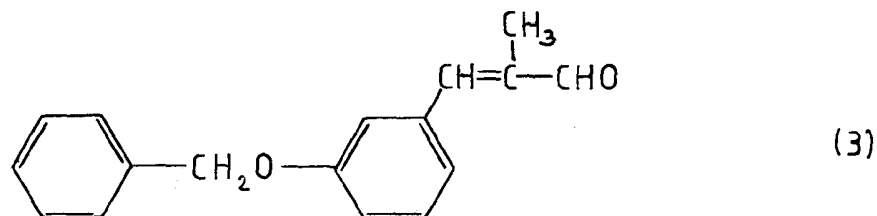
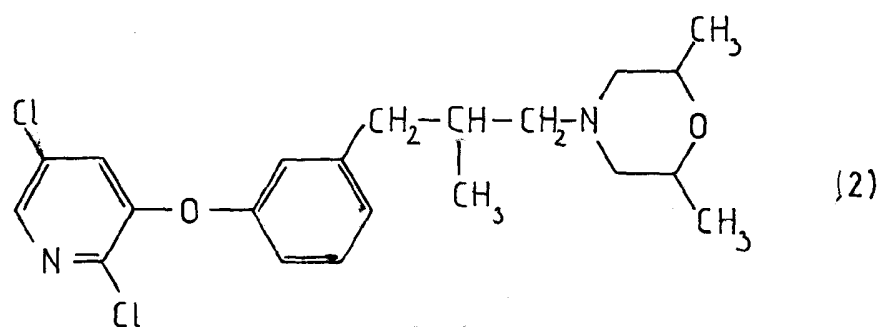
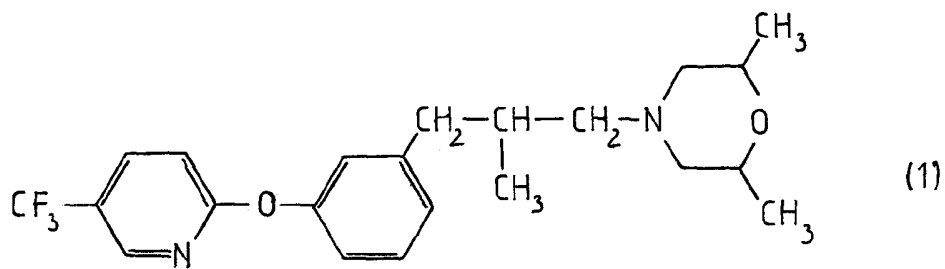
51900/126

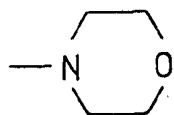
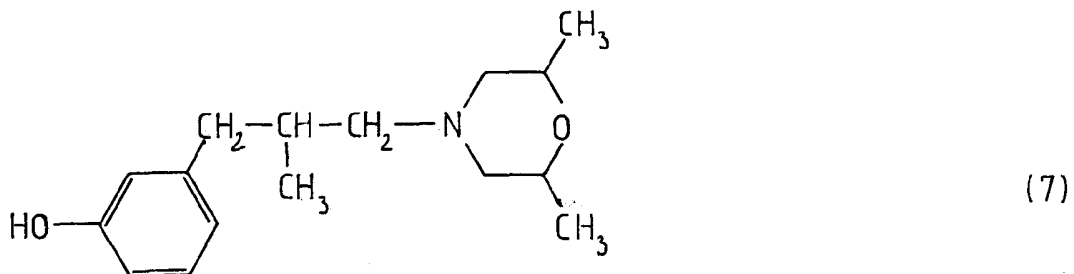
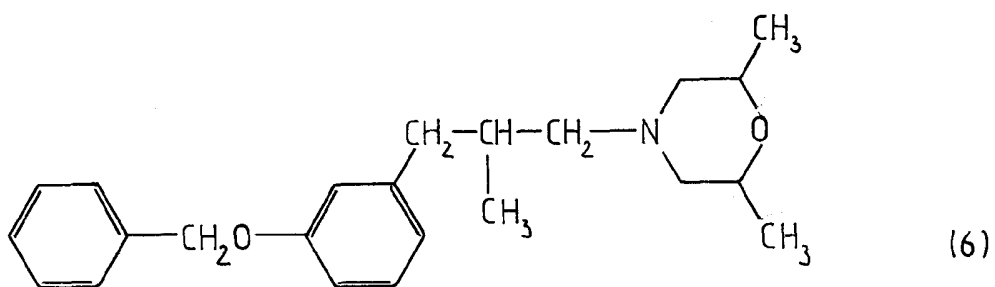
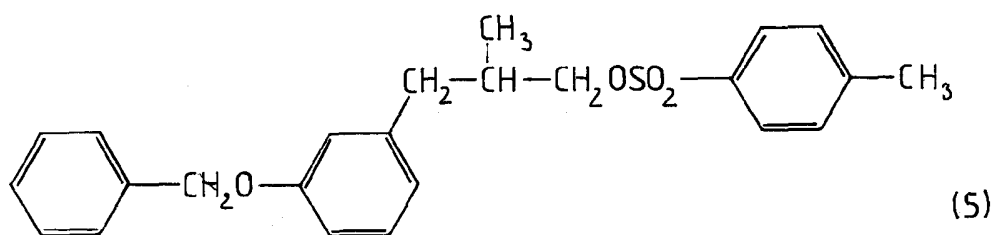
KÖZZÉTETELI PÉLDÁNY

-55010- 4/1

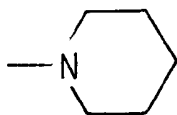


S.B.O. & K.
BUDAPESTI NEMZETKÖZI ÜGYVÉDI
ÉS SZABADALMI IRODA
1061 BUDAPEST, DALKISZTÁZ U. 10.
TELEFON: 153-3759

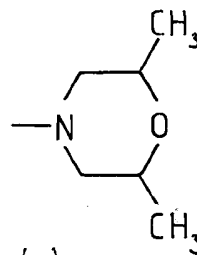




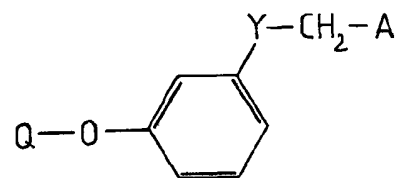
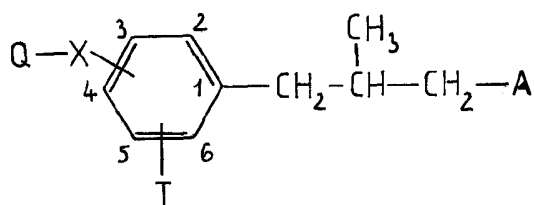
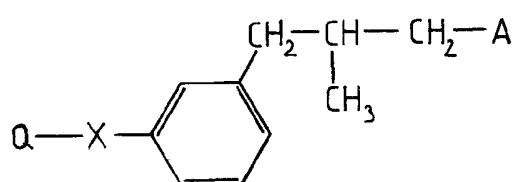
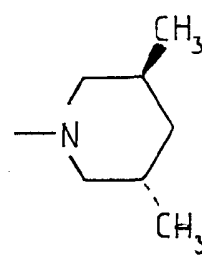
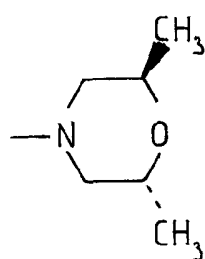
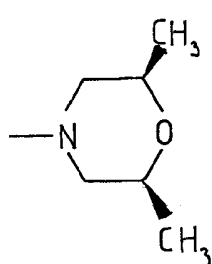
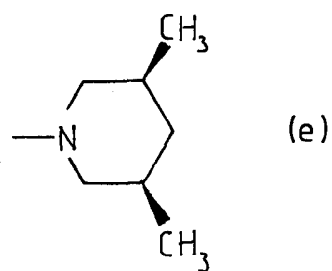
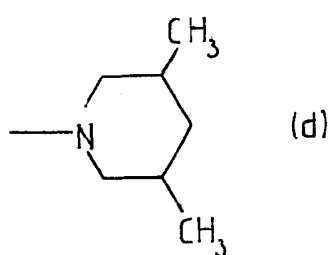
(a)



(b)



(c)



SECRET