

Союз Советских
Социалистических
Республик



Государственный комитет
СССР
по делам изобретений
и открытий

О П И С А Н И Е ИЗОБРЕТЕНИЯ

К АВТОРСКОМУ СВИДЕТЕЛЬСТВУ

(11) 788643

(61) Дополнительное к авт. свид-ву —

(22) Заявлено 27.08.79 (21) 2813230/23-04

с присоединением заявки —

(23) Приоритет —

(43) Опубликовано 07.04.82. Бюллетень № 13

(45) Дата опубликования описания 07.04.82

(51) М.Кл.³ C 07 D 207/26,
C 07 C 143/78,
A 01 N 43/36

(53) УДК 547.745
(088.8)

(72) Авторы
изобретения

С. И. Фролов, С. С. Кукаленко, Е. И. Андреева
и Н. В. Маканцева

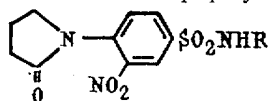
(71) Заявитель

(54) АЛКИЛАМИДЫ *n*-N-ПИРРОЛИДОН-2-ИЛ-*m*- НИТРОБЕНЗОЛСУЛЬФОКИСЛОТЫ, ОБЛАДАЮЩИЕ ФУНГИЦИДНОЙ АКТИВНОСТЬЮ

1

2

Изобретение относится к новым химическим соединениям, а именно к алкиламидам *n*-N-пирролидон-2-ил-*m*-нитробензолсульфонокислот общей формулы



где $RC(CH_3)_3$, $CH(CH_3)C_2H_5$,
обладающие фунгицидной активностью.

Ближайшими по структуре к названным соединениям являются алкиламидамы замещенных *n*-N - пирролидон-2-ил-арил-сульфонокислот, обладающие фармакологической активностью [1].

Кроме того, известны различные производные сульфаниламидов и бензолсульфаниламидов, проявляющие гербицидную и фунгицидную активность [2].

Целью изобретения является расширение арсенала химических средств защиты растений.

Поставленная цель достигается вышеуказанными соединениями общей формулы (1), обладающими фунгицидной активностью, в частности, против мучнистой росы, вызываемой грибом *Botrytis cinerea* Pers.

Алкиламидамы *n*-N - пирролидон-2-ил-*m*-нитробензолсульфонокислот получают вза-

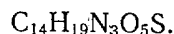
имодействием *n*-N-пирролидон-2-ил-*m*-нитробензолсульфохлорида с соответствующими алкиламинами.

Пример 1. N'-втор-бутиламид *n*-N-пирролидон - 2 - ил-*m*-нитробензолсульфонокислоты.

К раствору 7,47 мл (0,740 моль) втор-бутиламина в 20 мл диоксана при перемешивании прибавляют по каплям раствор 4,5 г (0,0148 моль) *n*-N-пирролидон-2-ил-*m*-нитробензолсульфохлорида в 50 мл диоксана. Температуру реакции поддерживают в интервале 7—9° С. Через 0,5 ч реакционную смесь нагревают до 20° С и при этой температуре перемешивают в течение 3 ч. Затем содержимое реактора выливают в 0,5 л холодной воды. Выпавшее желтое твердое вещество отфильтровывают, промывают водой и высушивают на воздухе. Получают 4,5 г (89,1%), считая на исходный сульфохлорид, неочищенного продукта реакции с т. пл. 147—150° С.

В результате кристаллизации из 22 мл спирта-ректификата выделяют 3,8 г (77,5%) желтого кристаллического N'-втор-бутиламида *n*-N-пирролидон-2-ил-*m*-нитробензолсульфонокислоты, $RCH(CH_3)C_2H_5$, т. пл. 150,5—151,5° С.

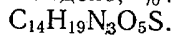
Найдено, %: С 49,36; Н 5,89; N 12,28.



Вычислено, %: С 49,27; Н 5,61; N 12,31.

Аналогично получают N'-трет-бутил-амид *n*-N-пирролидон-2-ил-*m*-нитробензол-сульфокислоты, $RC(CH_3)_3$ с выходом 75%, т. пл. 175°С, (с разложением).

Найдено, %: С 49,00; Н 5,71; N 12,43.



Вычислено, %: С 49,26; Н 5,61; N 12,31.

Оценка фунгицидной активности алкиламидов *n*-N-пирролидон-2-ил-*m*-нитробензолсульфокислоты проводится в сравнении с известным фунгицидом ТМТД на мицелии грибов *Botrytis cinerea* Pers.

Результаты испытаний показывают высокую фунгицидную активность заявляемых соединений в отношении возбудителя *Botrytis cinerea* Pers в концентрации 0,003%.

При определении фунгицидной активности соединений в отношении мицелия гриба *Botrytis cinerea* Pers препараты в концентрации 0,003%, растворенные в ацетоне, вводятся в расплавленную глюкозо-картофельную питательную среду и разливаются по чашкам Петри. Через сутки после разлива и застывания среды проводится инокуляция агаровой пластины мицелием гриба методом укола. Препарат инкубируется в термостате при 24°С в течение 4—5 суток. Далее измеряют диаметр колоний гриба и подсчитывают подавление развития мицелия гриба, % по формуле Эббота:

$$T = \frac{P_k - P_o}{P_k} \cdot 100\%,$$

где T — подавление развития мицелия гриба, %;

P_k — диаметр колоний гриба в контроле;

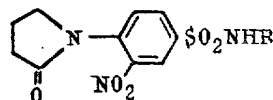
P_o — диаметр колоний гриба под действием препарата.

Результаты испытания соединений общей формулы (1) представлены в таблице.

Соединение, R	Подавление развития мицелия, %
$C(CH_3)_3$	88
$CH(CH_3)C_2H_5$	91
ТМТД (тетраметилтиурамдисульфид)	100

Формула изобретения

Алкиламиды *n*-N-пирролидон-2-ил-*m*-нитробензолсульфокислоты общей формулы



где R $C(CH_3)_3$, $CH(CH_3)C_2H_5$, обладающие фунгицидной активностью.

Источники информации, принятые во внимание при экспертизе:

1. Патент Швейцарии № 571489, кл. С 07 D 207/26, 1976.

2. Патент США № 3555055, кл. 260-397,7, 1971.

Составитель Т. Мамонтова

Редактор П. Горькова

Техред И. Заболотнова

Корректор С. Файн

Заказ 364/274

Изд. № 131

Тираж 448

Подписное

НПО «Поиск» Государственного комитета СССР по делам изобретений и открытий
113035, Москва, Ж-35, Раушская наб., д. 4/5

Тип. Харьк. фил. пред. «Патент»