



(12) Ausschließungspatent

(11) DD 299 027 A5

Erteilt gemäß § 17 Absatz 1
Patentgesetz der DDR
vom 27. 10. 1983
in Übereinstimmung mit den entsprechenden
Festlegungen im Einigungsvertrag

5(51) A 01 N 37/10

DEUTSCHES PATENTAMT

In der vom Anmelder eingereichten Fassung veröffentlicht

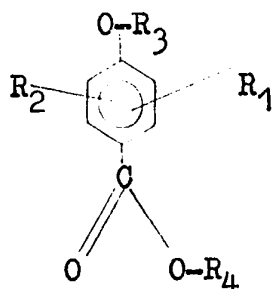
(21)	DD A 01 N / 323 797 8	(22)	23. 12. 88	(44)	26. 03. 92
(71)	siehe (73)				
(72)	Schöbel, Hans-Jürgen, Dipl.-Chem.; Gleitsmann, Roland, Dipl.-Chem.; Schmidt, Brigitte, Dipl.-Chem.; Arnold, Frank, Dipl.-Chem.; Bloedorn, Irmgard, Dipl.-Biol.; Rösler, Peter, Dipl.-Päd., DE				
(73)	BASF Schwarzheide GmbH, O - 7817 Schwarzheide, DE				
(54)	Bakterizide Mittel				

(55) bakterizide Mittel; sehr gute Wirkung; gegen sporulierende und nicht sporulierende Bakterien substituierbare Benzoessäureester; geringe Anwendungskonzentration; kombinierfähig mit anderen Pflanzenschutzmitteln

(57) Die Erfindung betrifft bakterizide Mittel, die im Pflanzen- und Vorratsschutz eingesetzt werden können. Ziel und Aufgabe der Erfindung besteht in der Erweiterung des Standes der Technik durch neue bakterizide Mittel, die bekannten in ihrer Wirkung überlegen sind und mit geringen Konzentrationen angewendet werden können. Erfindungsgemäß werden substituierte Benzoessäureester als Wirkstoffe eingesetzt. Diese sind besonders für Einsatzfälle geeignet, wo bereits Resistenzerscheinungen mit herkömmlichen Mitteln aufgetreten sind.

Patentanspruch:

1. Bakterizide Mittel, **gekennzeichnet dadurch**, daß sie als Wirkstoffe mindestens ein substituiertes Benzoessäureester der allgemeinen Formel I,



in der

R₁, R₂: H, Hal und/oder NO₂

R₃, R₄: H, Alkyl oder Aryl

bedeutet, neben gegebenenfalls Hilfs- und Trägerstoffen enthalten.

2. Mittel nach Punkt 1, **gekennzeichnet dadurch**, daß sie mindestens einen der folgenden substituierten Benzoessäureester
 3,5-Dibrom-4-hydroxybenzoessäureethylester
 3,5-Dinitro-4-hydroxybenzoessäuremethylester
 3-Nitro-4-hydroxybenzoessäureethylester
 3-Brom-5-nitro-4-hydroxybenzoessäuremethylester
 3-Brom-5-nitro-4-hydroxybenzoessäureethylester
 als Wirkstoff enthalten.

Anwendungsgebiet der Erfindung

Die vorliegende Erfindung betrifft bakterizide Mittel, die im Pflanzen- und Vorratsschutz eingesetzt werden können.

Charakteristik der bekannten technischen Lösungen

Zur Bekämpfung von Bakterien sind vielfältige Wirkstoffe und Handelspräparate bekannt.

Durch relativ schnelle Resistenzbildung der Bakterien ist ein häufiger Wirkstoffwechsel und die Anwendung von Wirkstoffgemischen notwendig.

Auf der Basis der Grundstruktur des Phenols sind eine Vielzahl von bakterizid wirksamen Verbindungen beschrieben, so z.B. in der DE-OS 1492726, wo p-Hydroxybenzoessäureester zum Haltbarmachen von Lebensmittelkonserven Verwendung finden. Diese Verbindungen besitzen die Nachteile einer zu hohen Anwendungskonzentration, eine zu geringe Langzeitwirkung und mangelnde Wirkungsbreite.

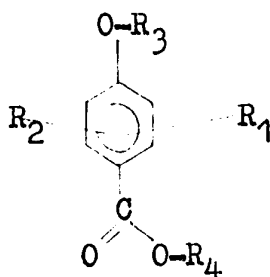
Ziel der Erfindung

Das Ziel der Erfindung ist die Erweiterung des Standes der Technik durch neue bakterizide Wirkstoffe für Einsatzfälle, wo bereits Resistenzerscheinungen aufgetreten sind.

Darlegung des Wesens der Erfindung

Die Aufgabe der Erfindung besteht in der Suche von substituierten Phenolen, die bisher bekannten Wirkstoffen in ihrer bakteriziden Wirkung überlegen sind und in geringen Anwendungskonzentrationen eine vergleichbar höhere Wirkung erreichen.

Gefunden wurden, daß Verbindungen des Typs der allgemeinen Formel ,



wobei

R₁, R₂: H, Hal und/oder NO₂

R₃, R₄: H, Alkyl oder Aryl bedeuten, gegen sporulierende und nicht sporulierende Bakterien sehr gute bakterizide Wirkungen besitzen, die vergleichbaren Wirkstoffen überlegen sind.

besonders geeignete Wirkstoffe haben sich

- 3,5-Dibrom-4-hydroxybenzoesäureethylester
- 3,5-Dinitro-4-hydroxybenzoesäuremethylester
- 3-Nitro-4-hydroxybenzoesäureethylester
- 3-Brom-5-nitro-4-hydroxybenzoesäuremethylester
- 3-Brom-5-nitro-4-hydroxybenzoesäureethylester

erwiesen.

Die Wirkstoffe können nach üblichen Methoden in anwendungsgerechte Formulierungen überführt werden, so z. B. in Form von Emulsionskonzentraten, Lösungen, Spritzpulvern usw. Dazu werden sie in bekannter Weise mit flüssigen oder festen Trägerstoffen versetzt und gegebenenfalls oberflächenaktive Verbindungen zugesetzt.

Die Applikation und die Aufwandmengen der Mittel richten sich nach dem jeweiligen Anwendungsgebiet, der Art der Formulierung und der gewünschten Breiten- und Tiefenwirkung.

Die Applikation erfolgt z. B. durch Zusatz, Gießen, Streichen, Spritzen oder Streuen.

Die erfindungsgemäßen Mittel können zur Erweiterung der Einsatzbreite mit anderen Wirkstoffen kombiniert werden und gemeinsam mit anderen Pflanzenschutzmitteln, Düngemitteln und Wachstumsregulatoren zur Anwendung gelangen. Die erfindungsgemäßen Mittel können auch als Mittel zum Schutz vor Bakterien und deren zerstörenden Wirkungen Farben, Kunststoffen, Kühlemulsionen usw. zugesetzt werden. Die nachstehenden Beispiele erläutern die gute Wirkung der erfindungsgemäßen Mittel.

Ausführungsbeispiele

Beispiel 1

Zusammensetzung eines Spritzpulvers

- 10% 3-Brom-5-nitro-4-hydroxybenzoesäureethylester
- 5% Na-arylalkylsulfonat
- 85% Kieselgur

Beispiel 2

Agar-Plattentest

Zur Stammerhaltung sowie zur Anzucht dient der Nähragar I (Immunpräparate Berlin) mit folgender Zusammensetzung:

Pankreatisches Pepton (Fleisch, Fisch)	20 g/l
Natriumchlorid	5 g/l
Agar für Kulturmedien	12 g/l
pH-Wert	7,2

Die Wirkstoffformulierungen werden dem flüssigen, sterilen Agar so zugemischt, daß die gewünschte Wirkstoffkonzentration im Medium erreicht wird.

Der wirkstoffhaltige Agar wird in Platten gegossen und nach dem Erkalten mit der entsprechenden Bakterienkultur im Streifenverfahren beimpft. Die Hemmung des Wachstums (Breite des Bakterienstreifens) ist in % der Kontrollkulturen ohne Wirkstoffzusatz ausgedrückt.

Agar-Plattentest mit *Staphylococcus aureus*

Verbindung	Wirkstoff- konzentration mg x l ⁻¹	Hemmung %
4-Hydroxybenzoesäure- ethylester (bekannt)	100	17
	250	20
	500	20
	1 000	100
3-Nitro-4-hydroxybenzoe- säureethylester	100	70
	250	100
3,5-Dinitro-4-hydroxyben- zoesäuremethylester	100	40
	250	80
	500	100
3-Brom-5-nitro-4-hydroxy- benzoesäuremethylester	100	100
3,5-Dibrom-4-hydroxybenzoe- säureethylester	100	17
	250	90
	500	100

Beispiel 3**Agar-Plattentest mit *Bacillus mycoides***

Verbindung	Wirkstoff- konzentration mg x l ⁻¹	Hemmung %
4-Hydroxybenzoesäure- ethylester (bekannt)	100	8
	250	13
	500	66
	1 000	100
3-Nitro-4-hydroxybenzoe- säureethylester	100	25
	250	37
	500	100
3,5-Dinitro-4-hydroxyben- zoesäuremethylester	100	44
	250	75
	500	100
3-Brom-5-nitro-4-hydroxy- benzoesäureethylester	100	33
	250	100
3,5-Dibrom-4-hydroxybenzoe- säureethylester	100	17
	250	90
	500	100