

(19) HU

MAGYAR
NÉPKÖZTÁRSASÁG



ORSZÁGOS
TALÁLMÁNYI
HIVATAL

SZABADALMI LEÍRÁS

(11)

(13)

197868 B

(22) A bejelentés napja: 85.10.16. (21) 4006/85

(33) GB:

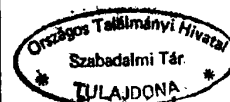
(32) 84.10.19.

85.05.23.

(31) 8426472

8513105

(51) Int.Cl.
C 07 C 51/00;
A 01 N 37/06;
C 07 C 69/734.



(41) (42) A közzététel napja: 1986.07.28.

(45) Megjelent: 1990.01.29.

(72) Feltalálók:

CLOUGH John Martin, KAY Ian Trevor,
Bracknell, Berkshire, GB

(73) Szabadalmaz:

Imperial Chemical Industries PLC., London,
GE

(54) AKRILSAV-SZÁRMAZÉKOKAT TARTALMAZÓ FUNGICID KÉSZÍTMÉNYEK ÉS ELJÁRÁS A HATÓANYAGOK ELŐÁLLÍTÁSÁRA

(57) KIVONAT

A találmány szerinti fungicid készítmények hatóanyagokként (I) általános képletű vegyületeket vagy azok sztereoizomerjeit — a képletben

X: oxigénatomot jelent,

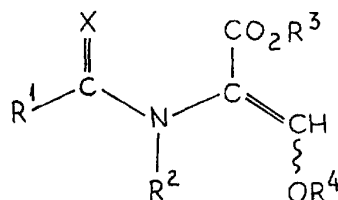
R¹ egy vagy két szén-szén kettős kötést tartalmazó és fenil-, monohalogén-fenil-, dihalogén-fenil- vagy tienil-szubsztituenszt hordozó egyenes vagy elágazó láncú 2—6 szénatomos alkenilcsoportot képvisel, vagy fenoxi-(1—4 szénatomos alkil)- vagy fenil-(1—6 szénatomos alkil)-csoportot jelent,

R² 1—4 szénatomos alkilcsoportot jelent,

R³ 1—4 szénatomos alkil- vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoportot jelent, és

R⁴ 1—8 szénatomos alkil- vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoportot jelent —

tartalmazzák 0,002—60 tömeg% mennyiségben, szilárd vagy folyékony hordozó- vagy hígítóanyagokkal és adott esetben ionos vagy nemionos felületaktív anyagokkal együtt.



(1)

A találmány hatóanyagokként akrilsav-származékokat tartalmazó fungicid készítményekre vonatkozik, amelyek elsősorban a növények gombafertőzéseinek megelőzésére és kezelésére alkalmazhatók. A találmány tárgya továbbá eljárás a hatóanyagok előállítására.

A találmány szerinti készítmények hatóanyagokként (I) általános képletű vegyületeket vagy azok sztereoizomerjeit — a kép-

letben

X oxigénatomot jelent,

R¹ egy vagy két szén-szén kettős kötést tartalmazó és fenil-, monohalogén-fenil-, dihalogén-fenil- vagy tienil-szubsztituenst hordozó egyenes vagy elágazó láncú 2—6 szénatomos alkenilcsoportot képvisel, vagy fenoxi-(1—4 szénatomos alkil)- vagy fenil-(1—6 szénatomos alkil)-csoportot jelent,

R² 1—4 szénatomos alkilcsoportot jelent,

R³ 1—4 szénatomos alkil- vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoportot jelent, és

R⁴ 1—8 szénatomos alkil- vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoportot jelent —

tartalmazza 0,002—60 tömeg% mennyiségben, szilárd vagy folyékony hordozó- vagy hígítóanyagokkal, előnyösen agyagásványokkal, talkummal, szilícium-dioxiddal, nátrium-acetáttal, aromás szénhidrogénekkel, klórozott szénhidrogénekkel vagy vízzel, és adott esetben ionos vagy nemionos felületaktív anyagokkal, előnyösen aromás szulfonsav- vagy

szulfonsavészter-sókkal vagy etilén-oxid vagy naftalin-oxid alkil-fenollokkal képezett kondenzátumaival együtt.

Az (I) általános képletű vegyületek legalább egy szén-szén kettős kötést tartalmaznak, ennek megfelelően geometriai izomerek elegyeiként képződhetnek. Az izomerelegyekből ismert módszerekkel különíthetjük el az egyedi izomereket. A találmány szerinti készítmények az (I) általános képletű vegyületek összes lehetséges izomerjét vagy izomerelegyét tartalmazhatják.

Az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú csoportok lehetnek, amelyek közül példaként a metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, szek-butil-, izobutil- és terc-butil-csoportokat említjük meg.

Az (I) általános képletű vegyületek előnyös képviselői azok a származékok, amelyekben R², R³ és R⁴ egyaránt metilcsoportot jelent, és R¹ E-R⁵-CH=CH- általános képletű csoportot képvisel, amelyben R⁵ fenil-, monohalogén-fenil-, dihalogén-fenil- vagy tienilcsoportot jelent.

Az (I) általános képletű vegyületek egyes képviselőit az I. táblázatban soroljuk fel. Az I. táblázatban felsorolt valamennyi vegyület egyedi geometriai izomer; a vegyületek térbeli szerkezete feltevésünk szerint az (IA) általános képletben bemutatottaknak felel meg.

Az I. táblázatban említett I. sz. vegyület esetén az (IA) általános képletnek megfelelő térbeli konfigurációt igazoló adatokat az I. példában soroljuk fel.

I. táblázat

(I) általános képletű vegyületek

A vegyület sorszáma	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Op. °C
1.	O	E-C ₆ H ₅ -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	ola j
2.	O	E-C ₆ H ₅ -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ CH ₂ -	CH ₃ CH ₂ -	ola j
3.	O	E-C ₆ H ₅ -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ CH ₂ -	ola j
4.	O	E-C ₆ H ₅ -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	99-100
5.	O	E-C ₆ H ₅ -CH=CH-	CH ₃ -	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	ola j
6.	O	E-C ₆ H ₅ -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ (CH ₂) ₃ -	ola j
7.	O	E-C ₆ H ₅ -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ (CH ₂) ₃ -	CH ₃ (CH ₂) ₃ -	ola j
8.	O	E-C ₆ H ₅ -CH=CH-	CH ₃ -	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	CH ₃ (CH ₂) ₃ -	ola j
9.	O	E-4-Cl-C ₆ H ₄ -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	106-108
10.	O	C ₆ H ₅ -CH ₂ CH ₂ -	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	ola j
11.	O	4-Cl-C ₆ H ₄ -	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	72-73
12.	O	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄ -	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	ola j
13.	S	E-C ₆ H ₅ -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	
14.	O	C ₆ H ₅ -C=C-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	
15.	O	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	
16.	O	C ₆ H ₅ O-CH ₂ -	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	52-53
17.	O	E-C ₆ H ₅ -CH=CH-	H	CH ₃ -	CH ₃ -	43-45
18.	O	E-C ₆ H ₅ -CH=CH-	CH ₃ CH ₂ -	CH ₃ -	CH ₃ -	ola j
19.	O	E-C ₆ H ₅ -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ CH ₂ -	CH ₃ -	51-52
20.	O	naft-2-il-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	ola j

I. táblázat /folytatás/
(I) általános képletű vegyületek

A vegyület sorszáma	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Op. C
21.	O	E-C ₆ H ₅ -CH=CH-	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	CH ₃ -	CH ₃ -	81-82
22.	O	E-3-Cl-C ₆ H ₄ -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	102-104
23.	O	E-C ₆ H ₅ -CH=C(CH ₃)-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	79-80
24.	O	E,E-C ₆ H ₅ -CH=CHCH= =CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	113-144
25.	O	E,E-C ₆ H ₅ -CH=CHCH= =CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	107-108
26.	O	E-2-Cl-C ₆ H ₄ -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	120-121
27.	O	E-2-Cl-C ₆ H ₄ -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	C ₆ H ₅ CH ₂ -	103-104
28.	O	E-fur-2-il-eten- -2-il-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	üveg
29.	O	E-C ₆ H ₅ -CH=CH-	C ₆ H ₅ -	CH ₃ -	CH ₃ -	82-83
30.	O	E-tien-2-il-eten- -2-il-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	64-65
31.	O	E-pirid-3-il-eten- -2-il	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	
32.	O	H	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	51-53
33.	O	E-tien-3-il-eten- -2-il-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	
34.	O	E-pirid-2-il-eten- -2-il-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	
35.	O	E-pirid-4-il-eten- -2-il-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	
36.	O	E-2,6-di-Cl-C ₆ H ₃ - -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	olaj
37.	O	E-3,5-di-Cl-C ₆ H ₃ - -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	
38.	O	E-2,3-di-Cl-C ₆ H ₃ - -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	
39.	O	E-2,4-di-Cl-C ₆ H ₃ - -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	
40.	O	E-2,5-di-Cl-C ₆ H ₃ - -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	
41.	O	E-3,4-di-Cl-C ₆ H ₃ - -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	
42.	O	E-4-F-C ₆ H ₄ -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	
43.	O	E-3-F-C ₆ H ₄ -CH=CH-	CH ₃ -	CH ₃ -	CH ₃ -	

Az I. táblázatban felsorolt egyes (I) általános képletű vegyületek — elsősorban az olajos vagy üvegszerű anyagok — NMR-spektrumainak jellemző adatait a II. táblázatban foglaljuk össze. Az NMR-spektrumo-

55

kat deutero-kloroform oldószerben vettük fel, a kémiai eltolódás-értékeket (δ) ppm egységekben, tetrametil-szilán belső standardra vonatkoztatva közöljük.

II. táblázat

A vegyület NMR-spektrumok adatai
sorszáma

2.	1,26 és 1,31 (két átlapoló triplétt, $J=7$ Hz, összesen 6H), 3,12 (3H, s), 4,17 (két átlapoló kvartett centruma, összesen 4H), 6,60 (1H, d, $J=16$ Hz), 7,50 (1H, s), 7,66 (1H, d, $J=16$ Hz)
3.	1,31 (3H, t, $J=7$ Hz), 3,13 (3H, s), 3,77 (3H, s), 4,14 (2H, q, $J=7$ Hz), 6,60 (1H, d, $J=16$ Hz), 7,53 (1H, s), 7,68 (1H, d, $J=16$ Hz)
5.	3,12 (3H, s), 5,02 (2H, széles s), 5,18 (2H, s), 6,49 (1H, d, $J=16$ Hz), 7,2–7,35 (15H, m), 7,57 (1H, s), 7,62 (1H, d, $J=16$ Hz)
6.	0,81 (3H, t, $J=7$ Hz), 1,1–1,7 (4H, m), 3,12 (3H, s), 3,76 (3H, s), 4,07 (2H, t, $J=6$ Hz), 6,60 (1H, d, $J=16$ Hz), 7,35 (1H, s), 7,66 (1H, d, $J=16$ Hz)
7.	0,7–0,95 (6H, m), 1,1–1,8 (8H, m), 3,12 (3H, s), 4,08 és 4,17 (két átlapoló triplétt, összesen 4H), 6,61 (1H, d, $J=16$ Hz), 7,50 (1H, s), 7,67 (1H, d, $J=16$ Hz)
8.	0,83 (3H, t), 3,13 (3H, s), 5,22 (2H, s), 6,56 (1H, d, $J=15$ Hz), 7,53 (1H, s), 7,63 (1H, d, $J=15$ Hz)
10.	2,4 (2H, m), 2,9 (2H, m), 3,01 (3H, s), 3,72 (3H, s), 3,87 (3H, s), 7,34 (1H, s)
12.	3,12 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,78 (3H, s), 3,80 (3H, s), 6,77 (2H, széles d, $J=8$ Hz), 7,01 (1H, s), 7,37 (2H, széles d, $J=8$ Hz)
18.	1,14 (3H, t, $J=9$ Hz), 3,2–3,7 (2H, m), 3,78 (3H, s), 3,91 (3H, s), 6,58 (1H, d, $J=15$ Hz), 7,55 (1H, s), 7,68 (1H, d, $J=15$ Hz)
20.	3,19 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,74 (3H, s), 6,99 (1H, s)
28.	3,07 (3H, s), 3,73 (3H, s), 3,89 (3H, s), 6,38–6,56 (3H, m), 7,32–7,50 (2H, m), 7,44 (1H, s)
36.	3,11 (3H, s), 3,74 (3H, s), 3,91 (3H, s), 6,73 (1H, d, $J=16$ Hz), 7,43 (1H, s), 7,66 (1H, d, $J=16$ Hz)

A találmány tárgya továbbá eljárás a korábbiakban ismertetett kompozíciók hatóanyagaiént részben felhasználható (I) általános képletű vegyületek és sztereoizomerjeik előállítására — a képletben

X oxigénatomot jelent,

R^1 jelentése hidrogénatom, egy vagy két szén-szén kettős kötést tartalmazó és fenil-, monohalogen-fenil-, dihalogen-fenil-, tienil- vagy furil-szubsztituens hordozó egyenes vagy elágazó láncú 2–6 szénatomos alkenilcsoportot, adott esetben halogénatommal vagy 1–4 szénatomos alkoxi-

csoporttal egyszeresen szubsztituált fenil- vagy naftilcsoport, fenoxi-(1–4 szénatomos alkil)-csoport vagy fenil-(1–6 szénatomos alkil)-csoport,

5 R^2 hidrogénatomot, 1–5 szénatomos alkilcsoportot, fenilcsoportot vagy fenil-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot jelent, és R^3 és R^4 egymástól függetlenül 1–8 szénatomos alkilcsoportot vagy fenil-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot képvisel,

10 azzal a feltétellel, hogy ha R^1 hidrogénatomot, R^3 etilcsoportot és ugyanakkor R^4 metilcsoportot jelent, R^2 csak fenilcsoporttól eltérő jelentésű lehet — oly módon, hogy a (III) általános képletű vegyületeket — a képletben R^1 , R^2 , R^3 és X jelentése a fenti — bázis jelenlétében $HCOOR^6$ általános képletű vegyületekkel reagáltatjuk — a képletben R^6 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelent —, és a kapott terméket bázis jelenlétében R^4 -Z általános képletű vegyületekkel reagáltatjuk — a képletben R^4 jelentése a fenti és Z kilépő csoportot, előnyösen halogénatomot vagy szulfenilcsoportot képvisel.

25 Az (I) általános képletű vegyületek előállítás módját az (A) reakcióvázlaton szemlélítjük.

A (II) általános képletű kiindulási anyagokat úgy állíthatjuk elő, hogy az (V) általános képletű aminosavakat vagy azok reakcióképes származékait (IV) általános képletű vegyületekkel — a képletben X oxigénatomot jelent — acilezzük. A reakciót adott esetben bázis jelenlétében, oldószeres közegben véghez-
30 zük. A reakcióelegyhez rendszerint akkor adunk bázist, ha Z helyén halogénatomot (például klóratomot vagy brómatomot) tartalmazó (IV) általános képletű acilezőszereket használunk fel.

40 A (III) általános képletű kiindulási anyagokat úgy is előállíthatjuk, hogy az (V) általános képletű aminosavakat vagy azok reakcióképes származékait megfelelő vízelvonószert vagy vízelvonószerelegyet jelenlétében R^1COOH általános képletű karbonsavakkal kondenzáljuk.

A (IV) és (V) általános képletű vegyületeket ismert módszerekkel állíthatjuk elő.

50 Az (I) általános képletű vegyületek például a következő, növényeken elősködő gombakártevők irtására alkalmasak: rizs *Pyricularia oryzae*-fertőzései;

55 búza *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis* és egyéb rozsdagomba-fertőzései, árpa *Puccinia hordei*, *Puccinia striiformis* és egyéb rozsdagomba-fertőzései, más gazdanövények (például kávé, körte, alma, földimogyoró, zöldségfélék és dísznövények) rozsdagomba-fertőzései;

60 árpa és búza *Erysiphe graminis* (lisztharmat)-fertőzései, és egyéb gazdanövények lisztharmat-fertőzései, így komló *Sphaerotheca macularis*-fertőzései;

65 tökfélék (például uborka) *Sphaerotheca fuliginea*-fertőzései; alma *Podosphaera leucot-*

richa-fertőzései és szőlő *Uncinula necator*-fertőzései;
gombafélék *Helminthosporium* spp., *Rhynchosporium* spp., *Septoria* spp., *Pseudocercospora* *herpotrichoides*- és *Gauomannomyces graminis*-fertőzései;
földimogyoró *Cercospora arachidicola*- és *Cercosporium personata*-fertőzései, egyéb gazdanövények, például cukorrépa, banán, szójabab és rizs *Cercospora*-fertőzései;
paradicsom, eper, zöldségfélék, szőlő és egyéb gazdanövények *Botrytis cinerea*- (zöld penész) fertőzései;
zöldségfélék (például uborka), olajrepce, alma, paradicsom és egyéb gazdanövények *Alternaria*-fertőzései;
alma *Venturia inaequalis*-fertőzései;
szőlő *Plasmopara viticola*-fertőzései;
egyéb penészgomba-fertőzések, így saláta *Bremia lactucae*-fertőzései, szójabab *Peronospora* spp.-fertőzései, dohány, hagyma és más gazdanövények *Peronospora* spp.-fertőzései, komló *Pseudoperonospora humuli*-fertőzései és tök *Pseudoperonospora cubensis*-fertőzései;
burgonya és paradicsom *Phytophthora infestans*-fertőzései, zöldségfélék, eper, avokádó, bors, dísznövények, dohány, kakaócserje és egyéb gazdanövények *Phytophthora* spp.-fertőzései;
rizs *Thanatephorus cucumeris*-fertőzései, és egyéb gazdanövények, így buza, árpa, zöldségfélék, gyapot és pázsítfű *Rhizoctonia*-fertőzései.

Az (I) általános képletű vegyületek egyes képviselői *in vitro* körülmények között és a gombakártevők széles skálájával szemben hatások. Ezek a vegyületek a betakarított gyümölcsökön élősködő gombafajták (például narancs *Penicillium digitatum*-, *Penicillium italicum*- és *Trichoderma viridis*-fertőzései, banán *Gloeosporium musarum*-fertőzései) ellen is hatások.

Az (I) általános képletű vegyületek egyes képviselői magcsávázószerként is felhasználhatók gabonamagvak védelmére a talajban élősködő gombafajokkal szemben (például gabonafélék *Fusarium* spp., *Septoria* spp., *Tilletia* spp., *Ustilago* spp., *Helminthosporium* spp.-fertőzéseinek, gyapotmagvak *Rhizoctonia solani*-fertőzéseinek és rizs *Piricularia oryzae*-fertőzéseinek megelőzésére).

Az (I) általános képletű vegyületek akropetálisan (a csúcs felé irányulva) vándorolhatnak a növényi szövetekben. Egyes (I) általános képletű vegyületek kellően illékonyak ahhoz, hogy gőzfázisban is megfelelő gombaírtó hatást fejtsenek ki.

Az (I) általános képletű vegyületeket ipari fungicid készítmények hatóanyagaiként is felhasználhatjuk például fa, szőrme, bőr és első sorban festékfilmek gombásodásának megelőzésére.

Az (I) általános képletű vegyületeket megfelelő hígító-, hordozó- és/vagy segédanyagok felhasználásával fungicid készítményekké alakíthatjuk. Ezeket a fungicid készítményeket a védendő növényre, a növény magvaira, vagy a növények, vagy magvak környezetébe juttatjuk.

Az (I) általános képletű vegyületeket tartalmazó fungicid készítményeket igen sokféle módon vihetjük fel a kezelendő területre. Így például a készítményeket közvetlenül a növények leveleire permetezhetjük, a készítményekkel bokrokat vagy fákat permetezhetünk, a készítményeket a magvakra vihetjük fel, vagy a készítményeket a védendő növények növekedésének helyére (így a vetésterületre) vihetjük fel. A felsorolt célokra permetleveket, beporzószereket, gőzfázisú készítményeket, kenőcs- vagy krémszerű készítményeket vagy a hatóanyagot lassan leadó granulátumokat használhatunk. A készítményeket a növények, bokrok és fák bármely részére (például a levelekre, a szárakra, az ágakra és a gyökerekre), továbbá a gyökereket körülvevő talajra vagy az elvetendő magra vihetjük fel. A készítményeket a talajba vagy az öntözővízbe is bekeverhetjük, illetve a hidropóniás kultúrák termesztőközegeihez adhatjuk. A készítményeket injektálással, elektrodinamikus permetezéssel vagy egyéb kis térfogatú anyagot alkalmazó módszerrel is felvihetjük.

A „növény” megjelölésen a leírásban a palántákat, bokrokat és fákat is értjük. A találmány szerinti fungicid készítményeket megelőző, védő vagy gombaírtó kezeléshez egyaránt felhasználhatjuk.

A találmány szerinti fungicid készítményeket például szilárd kompozíciók, így beporzószerek vagy granulátumok lehetnek, amelyek a hatóanyagon kívül szilárd hordozó- vagy hígítóanyagot, például töltőanyagokat, így kaolint, bantonitot, szilikagélt, dolomitot, kalcium-karbonátot, talkumot, porított magnézium-oxidot, fullerföldet, gipszet, hewitt-földet, diatómaföldet és/vagy porcelánföldet tartalmaznak. A granulátumokat közvetlenül a talajra kiszórható formában is kialakíthatjuk. A granulátumok előállítása során szemcsés töltőanyagot impregnálunk a hatóanyaggal, vagy a hatóanyag és a porított töltőanyag keverékét alakítjuk szemcsékké. A magcsávázásra alkalmas szilárd kompozíciók a tapadást fokozó anyagot (például ásványolajat) is tartalmazhatnak; magcsávázásra azonban folyékony kompozíciókat, például szerves oldószereket (így N-metil-pirrolidont vagy dimetil-formamidot) tartalmazó készítményeket is felhasználhatunk.

A szilárd készítmények továbbá diszpergálható porok, granulátumok vagy szemcsék lehetnek, amelyek a hatóanyagon és a hordozóanyagon kívül a készítmény folyadékokban való diszpergálódását elősegítő nedvesítőszereket és adott esetben szuszpendálószerket is tartalmaznak.

A folyékony készítmények például vizes diszperziók vagy emulziók lehetnek. Ezeket a készítményeket úgy állíthatjuk elő, hogy a hatóanyag(oka)t adott esetben nedvesítő-, diszpergáló- vagy emulgeálószerrel is tartalmazó szerves oldószerben oldjuk, és a kapott oldatot vízhez adjuk; ebben az esetben a víz is tartalmazhat nedvesítő-, diszpergáló- vagy emulgeálószerrel. Szerves oldószerként például etilén-dikloridot, izopropanolt, propilén-glikolt, diacetone-alkoholt, toluolt, kerozint, metil-naftalint, xilolokat, triklór-etilént, furfuril-alkoholt, tetrahidro-furfuril-alkoholt és glikol-étereket (így 2-etoxi-etanol és 2-butoxi-etanol) használhatunk.

A permetezéssel felviendő készítményeket aeroszolok formájában is kikészíthetjük; ezek a készítmények a hatóanyagon kívül hajtógázt, például fluor-triklór-metánt vagy diklór-difluor-metánt tartalmaznak.

A száraz hatóanyagokból pirotechnikai készítményeket is kialakíthatunk, amelyek zárt térben füstölőszerként használhatók fel.

A hatóanyagokból mikrokapszulás készítményeket is kialakíthatunk. A hatóanyagokat biológiailag lebontható polimerekbe is beágyazhatjuk; ekkor olyan készítményekhez jutunk, amelyekből a hatóanyag lassú, szabályozott ütemben szabadul fel.

A készítményekhez a felhasználási célnak megfelelő adalékanyagokat, például szétesést fokozó, tapadást fokozó, időjárásállóságot fokozó anyagokat és hasonlók is adhatunk.

A hatóanyagokat műtrágyákkal (így nitrogén-, kálium- vagy foszfortartalmú műtrágyákkal) egyesített formában is kikészíthetjük. Különösen előnyösek azok a készítmények, amelyek szemcsés műtrágyából és a műtrágyába felvitt vagy abba beágyazott hatóanyagból állnak. Az ilyen granulátumok célszerűen legfőljebb 25 tömeg% hatóanyagot tartalmaznak. A találmány szerinti készítmények tehát olyan műtrágya-kompozíciók is lehetnek, amelyek egy (I) általános képletű vegyületet vagy ennek fémkomplexét tartalmaznak.

A folyékony kompozíciók továbbá elárasztásra vagy permetezésre alkalmas készítmények is lehetnek. Ezek a készítmények rendszerint vizes diszperziók vagy emulziók, amelyek a hatóanyagon és a hordozóanyagon kívül egy vagy több felületaktív anyagot, például nedvesítőszerrel, diszpergálószerrel, emulgeálószerrel vagy szuszpendálószerrel is tartalmaznak. A permetlevelek előnyös csoportját alkotják az elektrodinamikus permetezéssel felvihető készítmények.

A felületaktív anyagok kationos, anionos és nemionos anyagok egyaránt lehetnek. A kationos felületaktív anyagok közül példaként a kvaterner ammóniumvegyületeket, így a cetil-trimetil-ammónium-bromidot említjük meg.

Az anionos felületaktív anyagok például a következők lehetnek: szappanok, alifás kén-sav-monoészter-sók (például nátrium-lauril-

-szulfát), szulfonált aromás vegyületek sói (például nátrium-dodecil-benzol-szulfonát, nátrium-, kalcium- vagy ammónium-lignin-szulfonát, butil-naftalin-szulfonát és nátrium-di- és -tri-izopropil-naftalin-szulfonátok elegye).

A nemionos felületaktív anyagok közül példaként a következőket soroljuk fel: etilén-oxid zsíralkoholokkal, így oleil- vagy cetil-alkohollal, vagy alkil-fenollokkal, így oktil- vagy nonil-fenollal vagy oktil-krezollal képezett kondenzációs termékei, hosszú szénláncú zsírsavakból és hexit-anhidridekből képezett részletes észterek, az utóbbi részleges észterek etilén-oxiddal képezett kondenzációs termékei és a lecitinek.

Szuszpendálószerként például hidrofíll kolloidokat (így poli(vinil-pirrolidon)-t vagy nátrium-karboxi-metil-cellulózt) és növényi gumikat (így akáciagumit vagy tragakantagumit) használhatunk.

A vizes diszperziók vagy emulziók formájában felhasználandó készítményeket rendszerint nagy hatóanyagtartalmú koncentrátumok formájában hozzuk forgalomba, amelyeket a felhasználás előtt vízzel a kívánt hatóanyag-tartalomig hígítunk. A koncentrátumokkal szemben gyakran támasztott követelmény az, hogy hosszú időn át változás nélkül tárolhatóak legyenek, és tárolás után vízzel hígítva megfelelően hosszú ideig homogén, hagyományos és elektrodinamikus permetezőberendezésekkel egyaránt felvihető elegyeket alkossanak. A koncentrátumok legfőljebb 60 tömeg%, előnyösen 10–60 tömeg% hatóanyagot tartalmaznak. A koncentrátumok előnyösen szerves savakat (például alkaril- vagy aril-szulfonsavakat, így xilol-szulfonsavat vagy dodecil-benzol-szulfonsavat) is tartalmaznak, ugyanis ezek a szerves savak fokozhatják a hatóanyagok poláros oldószerben való oldalékonyosságát. A koncentrátumok hígítószerként gyakran tartalmaznak poláros oldószerrel. A koncentrátumok előnyösen nagy mennyiségű felületaktív anyagot is tartalmaznak annak érdekében, hogy vízzel hígítva megfelelően stabil emulziókat képezzenek. A koncentrátumok vizes hígításával kapott, használatra kész híg készítmények hatóanyag-tartalma a felhasználás céljától függően viszonylag széles határok között változhat, ezek a vizes készítmények azonban rendszerint 0,002–10 tömeg%, például 0,01–10 tömeg% hatóanyagot tartalmaznak.

A találmány szerinti készítményekhez az (I) általános képletű vegyületeken kívül adott esetben egyéb biológiailag aktív anyagok például az (II) általános vegyületekhez hasonló vagy azok aktivitását kiegészítő fungicid hatóanyagokkal, továbbá növényi növekedést szabályozó, herbicid vagy inszekticid anyagokkal is keverhetők.

A további fungicid hatóanyag például a gabonafélék (így búza) kalászáin élősködő gombafajokkal (például Septoria, Gibberella és Helminthosporium-fajokkal), magvakon

és talajon élősködő gombafajokkal, peronoszpórával, szőlő-lisztgombával, alma-lisztgombával és alma-varasodással szemben hatásos anyag lehet. A több fungicid hatóanyagot tartalmazó készítmények hatásspektroma szélesebb lehet a kizárólag az (I) általános képletű vegyületeket tartalmazó készítményekénél. A további fungicid hatóanyagok közül példaként a következőket soroljuk fel: carbendazim, benomyl, tio fanát-, metil-, tiabendazol, fuberidazol, etridazol, diklofluanid, cimoxanil, oxadixil, ofurace, metalaxyl furaxyl, benalaxyl, fosetyl-alumínium, fenarimol, iprodion, procimidion, vinclozolin, penconazol, myclobutanil, RO-151297, S3308, pirazophos, ethirimol, ditalimfos, tridemorf, triforin, nuarimol, triazbutil, guazatin, propiconazol, prokloraz, flutriafol, klórtrifol (azaz 1-(1,2,4-triazol-1-il)-2-(2,4-diklórfenil)-hexan-2-ol), DPX H65731 (azaz 1-/-bisz-4-fluor-fenil/-metil-szilil/-metil/-1H-1,2,4-triazol), triadimefon, triadimenol, diklobutrazol, fenpropimorf, fenpropidin, triademorf, imazalil, fenfuram, karboxin, oxikarboxin, metfluroxam, dodemorf, BAS 454, blaszticidin S kasugamicin, edifenphos, kitazin P, ftalidin, probenazol, izoprothiolán, triciklázol, piroquilan, klórbenztiazon, neoasozin, polioxin D, validamicin A, repronil, flutolanil, pencykuron, diclomezin, fenazin-oxid, nikkel-dimetil-ditiokarbamat, tekloftalam, bitertanol, bupirimát, etakonazol, sztreptomycin, cipofuram, biloxazol, quinometionát, dimetirimol, fenapanil, tolclofos-metil, piroxifur, poliram, maneb, mancozeb, kaptafol, klórtalanil, anilazin, tiram, kaptan, folpet, zineb, propioneb, kén, dinocap, binapakril, nitrotal-izopropil, dodine, ditianon, fentin-hidroxid, fentin-acetát, teknazen, quintozen, dikloran, réztartalmú vegyületek, így réz-oxi-klorid, réz-szulfát és bordói lé, továbbá szerves higanyvegyületek, így 1-(2-ciano-2-metoxi-imino-acetil)-3-etil-karbamid.

Az (I) általános képletű vegyületeket tartalmazó készítményeket a talajban vagy magvakon élősködő gombákkal szembeni védelem biztosítása céljából talajba, tőzegbe vagy egyéb termesztőközegbe keverhetjük.

Inszekticid hatóanyagokként például a következőket használhatjuk: pirimicarb, dime-toát, demeton-s-metil, formotion, karbaril, izoprokarb, XMC, BPMC, karbofuran, karbo-szulfan, diazinon, fention, fenitroton, fentoát, klórpyrifos, izoxation, propaphos, monocrotophas, buprofezin, etoproxifen és cikloprotrin.

Növényi növekedést szabályozó hatóanyagokként például gyomirtókat, illetve a kevésbé kívánt növények (például fűfélék) növekedését szelektíven szabályozó szereket használhatunk.

A növényi növekedést szabályozó hatóanyagok közül példaként a következőket soroljuk fel: gibberellinek (így GA₃, GA₄ vagy GA₇), auxinok (így indolecetsav, indol-vajsav, naftoxi-ecetsav vagy naftalin-ecetsav), cito-

kininek (így kinetin, difenil-karbamid, benzimidazol, benzil-adenin és benzil-amino-purin) fenoxi-ecetsavak (így 2,4-D vagy MCPA), szubsztituált benzoésav-származékok (így trijód-benzoésav), morfaktinok (így klórfluorekol), maleinsav-hidrazid, glüfozát, glüfozin, hosszú szénláncú zsírsavak és zsírsavak, dikegulac, paklobutrazol, flurprimidol, fluoridamid, mefluidid, szubsztituált kvaterner ammónium- és foszfóniumvegyületek (így klórmequat, klórfonium vagy mepiquat-klorid), etefon, karbetamid, metil-3,6-diklóranizát, daminozid, asulam, abszcizinsav, izopirimol, 1-(4-klór-fenil)-4,6-dimetil-2-oxo-1,2-dihidro-piridin-3-karbonsav, hidroxiben-zotriplek (így bromoxinil), difenzoquat, benzoilprop-etil, 3,6-diklór-pikolinsav, paklobutrazol, fenpentezol, inabenfid, triapentenol és teknazen.

A találmányt az oltalmi kör korlátozása nélkül az alábbi példákban részletesen ismertetjük. Valamennyi példában magnézium-szulfátot használtunk az oldatok szárítására, és a vízre érzékeny közbenső termékek képződéséhez vezető reakciókat nitrogén-atmoszférában végeztük.

1. példa

30 N-Cinnamoil-N-metil-2-amino-3-metoxi-propén-karbonsav-metil-észter (1. sz. vegyület) előállítása

15,21 g szarkozin és 17,1 g nátrium-hidroxid 300 ml vízzel készített oldatához keverés közben 34,25 g E-cinnamoil-kloridot adunk. Amikor a hőfejlődés alábbhagy, az elegyet 4 órán át szobahőmérsékleten keverjük, majd több részletben diklór-metánnal mossuk. Az elegyet tömény vizes sósavoldattal megsavanyítjuk, a kivált szilárd csapadékot leszűrjük, éterral alaposan mossuk, majd szárítjuk. Törtfehér, szilárd anyagként 28,91 g (77%) E-N-cinnamoil-szarkozint kapunk; op.: 177–179°C. A termék analitikai célokra diklór-metán és benzin elegyből kristályosított mintája 180–181°C-on olvad.

A kapott E-N-cinnamoil-szarkozint néhány csepp tömény kénsavat tartalmazó, vízmentes metanolban visszafolyatás közben forraljuk, és így 82%-os hozammal a megfelelő metil-észterre alakítjuk. A terméket benzinnel eldörzsöljük. A tört fehér, nem tapadó szilárd anyag 56–58°C-on olvad. A termék analitikai célokra etil-acetátból és benzinnel átkristályosított mintája 57–58°C-on olvad.

2,03 g E-N-cinnamoil-szarkozin-metil-észtert és körülbelül 11 ml metil-formiátot 15 ml vízmentes dimetil-formamidban oldunk, és az oldatot keverés közben 0,42 g nátrium-hidrid 20 ml vízmentes dimetil-formamiddal készített szuszpenziójához adjuk. Kezdetben csak enyhe habzás áll be, 40 perc elteltével azonban a habzás hevesebbé válik (ekkor az elegyhez további 3 ml metil-formiátot adunk), majd 15 perc elteltével a habzás alábbhagy, és ismét enyhébbé válik. 7,5 óra elteltével a reakcióelegyet óvatosan adagolt vizes nátrium-karbonát-ol-

dattal hígítjuk, majd éterrel extraháljuk. Az extraktumokat egyesítjük, vizes nátrium-karbonát-oldattal és vízzel mossuk, szárítjuk, majd csökkentett nyomáson bepároljuk. 0,975 g reagálatlan E-N-cinnamoil-szarkozin-metil-észtert különítünk el. A vizes lugos fázist tömény vizes sósavoldattal megsavanyítjuk, és éterrel extraháljuk. Az extraktumokat egyesítjük, vízzel mossuk, szárítjuk, majd csökkentett nyomáson bepároljuk. 1,108 g N-cinnamoil-N-metil-2-amino-3-hidroxi-propén-karbonsav-metil-észtert kapunk (hozam: 49%, illetve a regenerált kiindulási anyag figyelembevételével 94%) halványpiros, üvegszerű anyagként. Ezt a terméket további tisztítás nélkül használjuk fel a következő lépésben.

A termék deuterokloroformban felvett NMR-spektrumában néhány vonal megkettőződik, ami feltehetően az amidkötés körüli korlátozott rotáció eredménye. A hexadeutero-dimetil-szulfoxidban felvett NMR-spektrumában azonban a vonalak nem kettőződnek meg, és a következő jellemző vonalak észlelhetők: $\delta=2,91$ (s, 3H), 3,61 (s, 3H), 6,64 (d, J=17 Hz 1H), 7,3–7,7 (m, 8H) ppm.

204 mg nátrium-hidrid 15 ml vízmentes dimetil-formamiddal készített szuszpenziójába keverés közben 1,108 g N-cinnamoil-N-metil-2-amino-3-hidroxi-propén-karbonsav-metil-észter 10 ml vízmentes dimetil-formamiddal készített oldatát csepegtetjük. Amikor az elegy habzása alábbhagy (körülbelül 10 perc elteltével) a reakcióelegyhez 2,65 ml metil-jodidot adunk, és az elegyet 1,5 órán át szobahőmérsékleten keverjük. Ezután az elegyet óvatosan vízzel hígítjuk, majd éterrel extraháljuk. Az extraktumokat egyesítjük, vizes nátrium-karbonát-oldattal és vízzel mossuk, szárítjuk, csökkentett nyomáson bepároljuk, és a maradékot szilikagél-oszlopon kromatografáljuk. Eluálószerként étert használunk. 0,755 g (65%) cím szerinti vegyületet kapunk viszkozus, színtelen olaj formájában, amely gázkromatográfiás elemzés alapján 99%-osnál tisztább.

IR spektrum (film): ν 1712, 1655, 1618 és 1584 (gyenge) cm^{-1} .

NMR-spektrum vonalai (CDCl_3): $\delta=3,11$ (s, 3H), 3,76 (s, 3H), 3,91 (s, 3H), 6,58 (d, J=16 Hz, 1H), 7,3–7,6 (m, 5H), 7,46 (s, 1H), 7,64 (d, J=16 Hz, 1H) ppm.

^{13}C -NMR-spektrum vonalai (CDCl_3): $\delta=34,1$, 51,2, 62,0, 113,2, 117,1, 127,2, 128,2, 129,0, 134,6, 141,3, 158,1, 164,9, 166,2 ppm.

A spektroszkópiai adatok szerint a termék egyetlen geometriai izomerből áll. A cinnamoil-csoport olefinkötése kétséget kizáróan E-konfigurációjú, az E-cinnamoil-kloriddal összehasonlítva.

A propenoát-csoporton lévő olefin-proton kémiai eltolódásának ($\delta=7,46$ ppm) értéke, valamint az észter-karbonilcsoport szénatomja és a propenoát-csoporton lévő olefin-proton közötti csatolási állandó (kb. 1,5 Hz) azt jelzi, hogy a propenoát-csoport Z-konfigurációjú, és a termék szerkezete az (IB) képleten bemutatottnak felel meg.

ciójú, és a termék szerkezete az (IB) képleten bemutatottnak felel meg.

2. példa

N-(o-Klór-cinnamoil)-N-metil-2-amino-3-metoxi-propén-karbonsav-metil-észter (26. sz. vegyület) előállítása

6,00 g o-klór-fahéjsav és körülbelül 25 ml tionil-klorid elegyét 2 órán át visszafolyatás közben forraljuk, majd a tionil-klorid fölségét és az egyéb illékony anyagokat csökkentett nyomáson lepároljuk. A kapott nyers, kristályos savkloridot 100 ml vízmentes diklór-metánban oldjuk, és ezt az oldatot 4,59 g szarkozin-metil-észter-hidroklorid és 10,1 ml trietil-amin 100 ml vízmentes diklór-metánnal készített oldatába csepegtetjük. A reagens beadagolása során az elegyet keverjük. Exoterm reakció indul be, és a reakcióelegy megfűtődik. Az elegyet 4 órán át szobahőmérsékleten keverjük, majd szűrjük, és a szűrletet híg vizes sósavoldattal, vizes nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal, végül vízzel mossuk. A szűrletet szárítjuk és bepároljuk. 8,31 g viszkozus, olajos N-(o-klór-cinnamoil)-szarkozin-metil-észtert kapunk; gázkromatográfiás elemzés alapján a termék 94%-os tisztaságú.

6,99 g nyers N-(o-klór-cinnamoil)-szarkozin-metil-észtert az 1. példában leírtakhoz hasonlóan 30 ml metil-formiáttal és 2,35 g nátrium-hidriddel reagáltatunk. Törtfehér, szilárd anyagként 4,56 g N-(o-klór-cinnamoil)-N-metil-2-amino-3-hidroxi-propén-karbonsav-metil-észtert kapunk; op.: 129–130°C.

3,35 g N-(o-klór-cinnamoil)-N-metil-2-amino-3-hidroxi-propén-karbonsav-metil-észter 25 ml vízmentes dimetil-formamiddal készített oldatához keverés közben 3,44 g kálium-karbonátot, majd 1,05 ml dimetil-szulfátot adunk. 2 óra elteltével a reakcióelegyet vizes nátrium-hidrogén-karbonát-oldatba öntjük, és a kapott elegyet éterrel extraháljuk. Az extraktumokat egyesítjük, vizes nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal és vízzel mossuk, majd szárítjuk, betöményítjük, és a maradékot szilikagél-oszlopon kromatografáljuk. Eluálószerként étert használunk. 2,40 g (40% az o-klór-fahéjsavra vonatkoztatva) cím szerinti terméket kapunk 120–121°C-on olvadó, törtfehér szilárd anyagként.

NMR-spektrum vonalai (CDCl_3): $\delta=3,10$ (3H, s), 3,76 (3H, s), 3,91 α -3H, s), 6,57 (1H, d, J=17 Hz), 7,44 (1H, s), 7,98 (1H, d, J=17 Hz) ppm.

3. példa

Az alábbiakban felsorolt komponenseket összekeverjük, és az elegyet homogén oldat képződéséig keverjük. Emulgeálható koncentrációt kapunk, amelynek összetétele a következő:

1. sz. vegyület	10%
Etilén-diklorid	40%
Kalcium-dodecil-benzol-szulfát	5%
Lubrol L	10%
Aromasol H	35%

4. példa

Az alábbi összetételű, folyadékokban (például vízben) könnyen diszpergálható granulátumot állítjuk elő:

1. sz. vegyület	50%
Dispersol T	25%
Lubrol APN5	1,5%
Nátrium-acetát	23,5%

Az első három komponenst víz jelenlétében összekeverjük, majd bekeverjük a nátrium-acetátot. A kapott masszát szárítjuk, és 0,42–0,149 mm száltávolságú szitán granuláljuk.

5. példa

Az alább felsorolt komponensek összeőrlésével folyadékokban könnyen diszpergálható porkészítményt állítunk elő:

1. sz. vegyület	45%
Dispersol T	5%
Lissapol NX	0,5%
Cellofas B600	2%
Nátrium-acetát	47,5%

6. példa

A hatóanyagot oldószerben oldjuk, és a kapott oldatot porcelánföld-granulátumra permetezzük. Ezután az oldószert elpárologtatjuk. A következő összetételű granulátus készítményt kapjuk:

1. sz. vegyület	5%
Porcelánföld	95%

7. példa

A komponensek összekeverésével állítjuk elő az alábbi összetételű magcsávázószert:

1. sz. vegyület	50%
Ásványolaj	2%
Porcelánföld	48%

8. példa

A komponensek összeőrlésével állítjuk elő az alábbi összetételű, beporzásra alkalmas porkészítményt:

1. sz. vegyület	5%
Talkum	95%

9. példa

Az első három komponenst golyós malomban összeőröljük, és az őrleményt vízben szuszpendáljuk. A következő összetételű koloid szuszpenziót kapjuk:

1. sz. vegyület	40%
Dispersol T	10%
Lubrol APN5	1%
Víz	49%

10. példa

Az alább felsorolt komponenseket összekeverjük, és a keveréket őrléssel homogenizáljuk. A következő összetételű diszpergálható porkészítményt kapjuk:

1. sz. vegyület	25%
Aerosol OT/B	2%
Dispersol AC	5%
Porcelánföld	28%
Szilícium-dioxid	40%

11. példa

Az alább felsorolt komponenseket összekeverjük, és a keveréket őrléssel homogenizáljuk. A következő összetételű diszpergálható porkészítményt kapjuk:

1. sz. vegyület	25%
Permal BX	1%
Dispersol T	5%
Poli-(vinil-pirrolidon)	10%
Szilícium-dioxid	25%
Porcelánföld	34%

12. példa

Az alább felsorolt komponenseket összekeverjük, és a keveréket őrléssel homogenizáljuk. A következő összetételű diszpergálható porkészítményt kapjuk:

1. sz. vegyület	25%
Aerosol OT/B	2%
Dispersol A	5%
Porcelánföld	68%

A 3–12. példában megadott százalékos értékek tömeg%-ok.

A 3–12. példában közöltek szerint formálhatjuk az I. táblázatban felsorolt további vegyületeket is.

A 3–12. példában kereskedelmi névvel megjelölt anyagok kémiai összetétele a következő:

30	Lubrol L:	nonil-fenol és etilén-oxid 1:13 molarányú kondenzátuma
	Aromasol H:	alkil-benzolokból álló oldószer-elegy
35	Dispersol T és AC:	formaldehid/nátrium-naftalin-szulfonát kondenzátum és nátrium-szulfát elegy
	Lubrol APN5:	nonil-fenol naftalin-oxiddal képezett 1:5,5 molarányú kondenzátuma
40	Cellofas B600:	nátrium-karboxi-metil-cellulóz alapú sűrítőszer
	Lissapol NX:	nonil-fenol etilén-oxiddal képezett 1:8 molarányú kondenzátuma
45	Aerosol OT/B:	dioktil-nátrium-szulfó-szukcinát
	Permal BX:	nátrium-alkil-naftalin-szulfonát

13. példa

Ebben a példában a hatóanyagok növények levelein élősködő gombakártevőkkel szemben kifejtett aktivitását vizsgáljuk.

55	A vizsgálandó növényeket 4 cm átmérőjű apró cserepekben, John Innes Potting Compost (1 vagy 2) termesztőközegeen termesztették. A hatóanyagokból permetleveket készítettünk (a hatóanyag és vizes Dispersol T oldat elegyét golyós malomban őrlöttük, vagy a hatóanyagot acetonnal vagy acetonnal és etanol elegyében oldottuk), és a kapott permetleveket vízzel a kívánt koncentrációra hígítottuk. A permetleveket 100 ppm (=0,01 tömeg%) hatóanyagot tartalmaztak.
60	
65	

Leveleken élősködő gombakártevőkkel szembeni hatás vizsgálatakor a permetlevelet a növények leveleire permeteztük, és a talajon keresztül juttattuk a növények gyökereire. A permetezést maximális retencióig végeztük. A gyökerekhez a száraz talaj mennyiségére vonatkoztatva 40 ppm hatóanyagot juttattunk. Gabonafélék permetezése esetén a permetléhez 0,05% (végső koncentráció) Tween 20-at (polioxietilén-szorbitán-monodekanoát) is adtunk.

A legtöbb esetben a növények leveleit és a talajt bepermeteztük a vizsgálandó hatóanyagot tartalmazó permetlével, és 1 vagy 2 nap elteltével megfertőztük a növényeket. Kivételt képeztek az Erysiphe graminis-szal végzett kísérletek, amikor a növényeket 24 órával a permetezés előtt fertőztük meg. A gombakártevőket spóraszuszpenzió formájában, permetezéssel vittük fel a növények leveleire. A megfertőzött növényeket a fertőzés kifejlő-

désének kedvező környezetbe helyeztük, és a fertőzés kialakulásáig itt tartottuk. A megfertőzés és az értékelés között eltelt idő a gomba fajtájától és a környezet jellegétől függően 4–14 nap volt.

Az észlelt eredményeket a III. táblázatban közöljük. A táblázatban megadott számadatok jelentése a következő:

- 5 4: fertőzés nem észlelhető
 10 3: a kezeletlen növényekhez viszonyítva nyomnyi 5%-os fertőzés
 2: a kezeletlen növényekhez viszonyítva 6–25%-os fertőzés
 15 1: a kezeletlen növényekhez viszonyítva 26–59%-os fertőzés
 0: a kezeletlen növényekhez viszonyítva 60–100%-os fertőzés

20 A III. táblázatban feltüntetett vízszintes vonalak azt jelzik, hogy nem végeztünk kísérletet.

III. táblázat

A vegyület sor-száma	Puccinia recondita (buzan)	Erysiphe graminis (arpan)	Venturia inaequalis (alman)	Pyricularia oryzae (rizsen)	Cercospora arachidi-cola (földi-mogyoron)	Plasmodiopsis para viticola (szőlőn)
1.	4	4	4	3	4	4
4.	4	4	3	0	4	0
5.	3	3	0	0	4	0
6.	0	0	0	0	3	0
9.	2	4	2	1	4	4
10.	0	–	0	0	4	0
16.	0	0	0	0	2	3
18.	0	3	0	0	3*	0
22.	4	4	4	3	4	4
23.	0	0	3	0	0	0
24.	0	0	3	0	0	4
26.	4	4	4	4	2	4
30.	3	4	4	0	–	4
36.	0	2	0	0	0	2

* 25 ppm (= 0,0025 tömeg%) hatóanyagot tartalmazó permetlé

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Fungicid készítmények, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagokként (I) általános képletű vegyületeket vagy azok sztereoizomereit — a képletben

X oxigénatomot jelent,

R¹ egy vagy két szén-szén kettős kötést tartalmazó és fenil-, monohalogen-fenil-, dihalogen-fenil- vagy tienil-szubsztituenst hordozó egyenes vagy elágazó láncú 2–6 szénatomos alkenilcsoportot képvisel, vagy fenoxi-(1–4 szénatomos alkil)- vagy fenil-(1–6 szénatomos alkil)-csoportot jelent.

10

R² 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelent,
 R³ 1–4 szénatomos alkil- vagy fenil-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot jelent, és
 55 R⁴ 1–8 szénatomos alkil- vagy fenil-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot jelent — tartalmazza 0,002–60 tömeg% mennyiségben, szilárd vagy folyékony hordozó- vagy hígítóanyagokkal, előnyösen agyagásványokkal, talkummal, szilícium-dioxiddal, nátrium-acetáttal, aromás szénhidrogénnel, klórozott szénhidrogénnel vagy vízzel, és adott esetben ionos vagy nemionos felületaktív anyagokkal, előnyösen aromás szulfonsav- vagy szulfonsavészter-sókkal vagy etilén-oxid vagy naftalin-oxid alkil-fenollokkal képezett kon-

denzátumaival együtt. (Elsőbbsége: 1985. 10.16.)

2. Fungicid készítmények, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagokként (I) általános képletű vegyületeket vagy azok sztereoizomerjeit — a képletben

X oxigénatomot jelent,

R¹ egy vagy két szén-szén kettős kötést tartalmazó és fenil-, monohalogén-fenil- vagy tienil-szubsztituens hordozó egyenes vagy elágazó láncú 2—6 szénatomos alkenilcsoportot képvisel, vagy fenoxi-(1—4 szénatomos alkil)- vagy fenil-(1—6 szénatomos alkil)-csoportot jelent,

R² 1—4 szénatomos alkilcsoportot jelent,

R³ 1—4 szénatomos alkil- vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoportot jelent, és

R⁴ 1—8 szénatomos alkil- vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoportot jelent — tartalmazzák 0,002—60 tömeg% mennyiségben, szilárd vagy folyékony hordozó- vagy hígítóanyagokkal, előnyösen agyagásványokkal, talkummal, szilícium-dioxiddal, nátrium-acetáttal, aromás szénhidrogénekkel, klórozott szénhidrogénekkel vagy vízzel, és adott esetben ionos vagy nemionos felületaktív anyagokkal, előnyösen aromás szulfonsav- vagy szulfonsavészter-sókkal vagy etilén-oxid vagy naftalin-oxid-alkil-1-fenolokkal képezett kondenzátumaival együtt. (Elsőbbsége: 1985. 05.23.)

3. Fungicid készítmények, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagokként (I) általános képletű vegyületeket vagy azok sztereoizomerjeit — a képletben

X oxigénatomot jelent,

R¹ egy szén-szén kettős kötést tartalmazó és fenil- vagy monohalogén-fenil-szubsztituens hordozó egyenes vagy elágazó láncú 2—6 szénatomos alkenilcsoportot képvisel, vagy fenoxi-(1—4 szénatomos alkil)- vagy fenil-(1—6 szénatomos alkil)-csoportot jelent,

R² 1—4 szénatomos alkilcsoportot jelent,

R³ 1—4 szénatomos alkil- vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoportot jelent, és

R⁴ 1—8 szénatomos alkil- vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoportot jelent —

tartalmazzák 0,002—60 tömeg% mennyiségben, szilárd vagy folyékony hordozó- vagy hígítóanyagokkal, előnyösen agyagásványokkal, talkummal, szilícium-dioxiddal, nátrium-acetáttal, aromás szénhidrogénekkel, klórozott szénhidrogénekkel vagy vízzel, és adott esetben ionos vagy nemionos felületaktív anyagokkal, előnyösen aromás szulfonsav- vagy szulfonsavészter-sókkal vagy etilén-oxid vagy naftalin-oxid alkil-fenolokkal képezett kondenzátumaival együtt. (Elsőbbsége: 1984.10.19.)

4. Eljárás (I) általános képletű vegyületek és sztereoizomerjeik előállítására — a képletben

X oxigénatomot jelent,

R¹ jelentése hidrogénatom, egy vagy két szén-szén kettős kötést tartalmazó és fenil-, mo-

nohalogén-fenil-, dihalogén-fenil-, tienil- vagy furil-szubsztituens hordozó egyenes vagy elágazó láncú 2—6 szénatomos alkenilcsoport, adott esetben halogénatommal vagy 1—4 szénatomos alkoxicsoporthal egyszeresen szubsztituált fenil- vagy naftilcsoport, fenoxi-(1—4 szénatomos alkil)-csoport vagy fenil-(1—6 szénatomos alkil)-csoport,

10 R² hidrogénatomot, 1—5 szénatomos alkilcsoportot, fenilcsoportot vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoportot jelent, és

R³ és R⁴ egymástól függetlenül 1—8 szénatomos alkilcsoportot vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoportot képvisel,

15 azzal a feltétellel, hogy ha R¹ hidrogénatomot, R³ etilcsoportot és ugyanakkor R⁴ metilcsoportot jelent, R² csak fenilcsoporttól eltérő jelentésű lehet —, *azzal jellemezve*, hogy (III)

20 általános képletű vegyületeket — a képletben R¹, R², R³ és X jelentése a tárgyi kör szerinti — bázis jelenlétében HCOOR⁶ általános képletű vegyületekkel reagáltatunk — a képletben R⁶ 1—4 szénatomos alkilcsoportot jelent —, és a kapott terméket bázis jelenlétében

25 R⁴-Z általános képletű vegyületekkel reagáltatjuk — a képletben R⁴ jelentése a tárgyi kör szerinti és Z kilépő csoportot, előnyösen halogénatomot vagy szulfonilcsoportot képvisel. (Elsőbbsége: 1985.10.16.)

30 5. Eljárás (I) általános képletű vegyületek és sztereoizomerjeik előállítására — a képletben

35 X oxigénatomot jelent,

R¹ jelentése hidrogénatom, egy vagy két szén-szén kettős kötést tartalmazó és fenil-, monohalogén-fenil-, tienil- vagy furil-szubsztituens hordozó egyenes vagy elágazó láncú 2—6 szénatomos alkenilcsoportot, adott esetben halogénatommal vagy 1—4 szénatomos alkoxicsoporthal egyszeresen szubsztituált fenil- vagy naftilcsoport, fenoxi-(1—4 szénatomos alkil)-csoport vagy fenil-(1—6 szénatomos alkil)-csoport,

45 R² hidrogénatomot, 1—5 szénatomos alkilcsoportot, fenilcsoportot vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoportot jelent, és

50 R³ és R⁴ egymástól függetlenül 1—8 szénatomos alkilcsoportot vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoportot képvisel,

azzal a feltétellel, hogy ha R¹ hidrogénatomot,

55 R³ etilcsoportot és ugyanakkor R⁴ metilcsoportot jelent, R² csak fenilcsoporttól eltérő jelentésű lehet —, *azzal jellemezve*, hogy (III)

60 általános képletű vegyületeket — a képletben R¹, R², R³ és X jelentése a tárgyi kör szerinti — bázis jelenlétében HCOOR⁶ általános képletű vegyületekkel reagáltatunk — a képletben R⁶ 1—4 szénatomos alkilcsoportot jelent —, és a kapott terméket bázis jelenlétében

65 R⁴-Z általános képletű vegyületekkel reagáltatjuk — a képletben R⁴ jelentése a tárgyi kör szerinti és Z kilépő csoportot, előnyösen

halogénatomot vagy szulfonilcsoportot képvisel. (Elsőbbsége: 1985.05.23.)

6. Eljárás (I) általános képletű vegyületek és sztereoizomerjeik előállítására — a képletben

X oxigénatomot jelent,

R¹ jelentése hidrogénatom, egy szén-szén kettős kötést tartalmazó és fenil- vagy monohalogén-fenil-szubsztituens hordozó egyenes vagy elágazó láncú 2—6 szénatomos alkenilcsoport, adott esetben halogénatommal vagy 1—4 szénatomos alkoxycsoporttal egyszeresen szubsztituált fenil- vagy naftilcsoport, fenoxi-(1—4 szénatomos alkil)-csoport vagy fenil-(1—6 szénatomos alkil)-csoport,

R² hidrogénatomot vagy 1—5 szénatomos alkilcsoportot jelent, és

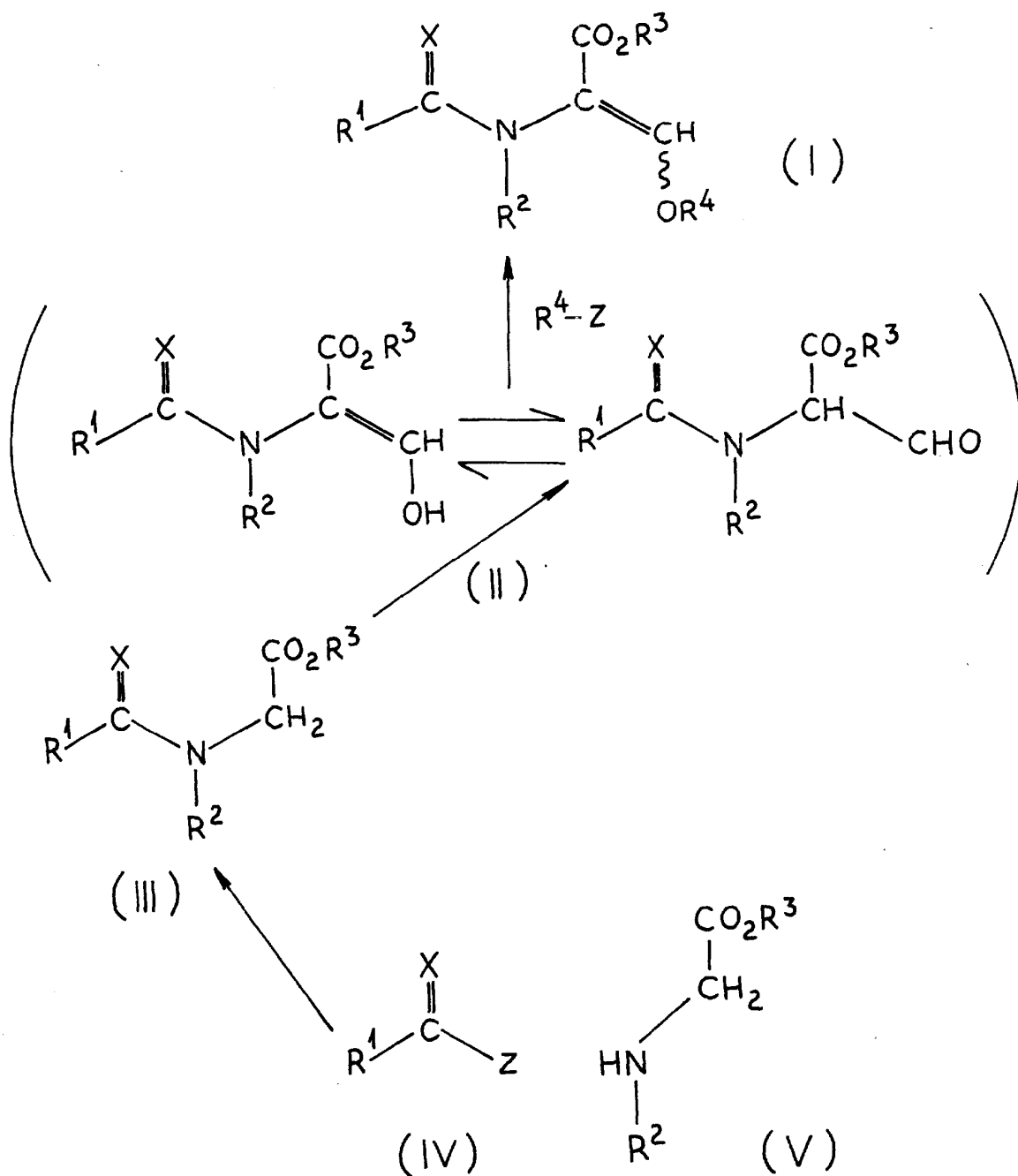
R³ és R⁴ egymástól függetlenül 1—8 szénatomos alkilcsoportot vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoportot képvisel—,

5 *azzal jellemezve, hogy (III) általános képletű vegyületeket — a képletben R¹, R², R³ és X jelentése a tárgyi kör szerinti — bázis jelenlétében HCOOR⁶ általános képletű vegyületekkel reagáltatunk — a képletben R⁶ 1—4 szénatomos alkilcsoportot jelent —, és a kapott terméket bázis jelenlétében R⁴-Z általános képletű vegyületekkel reagáltatjuk — a képletben R⁴ jelentése a tárgyi kör szerinti és Z*

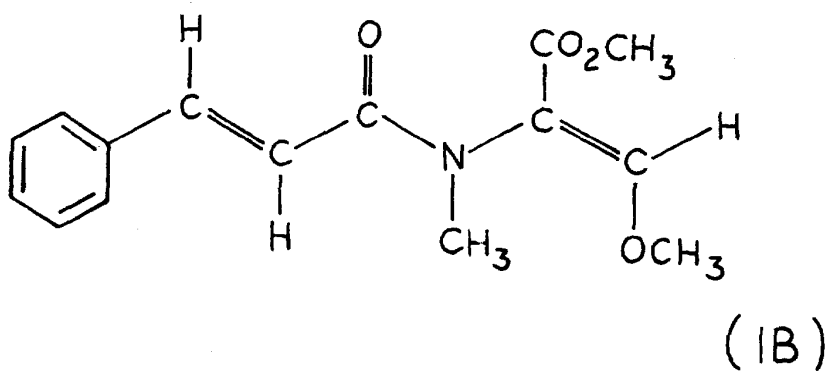
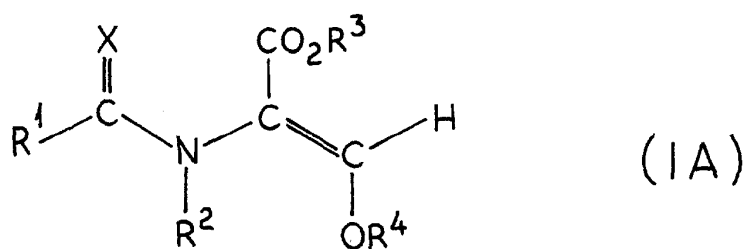
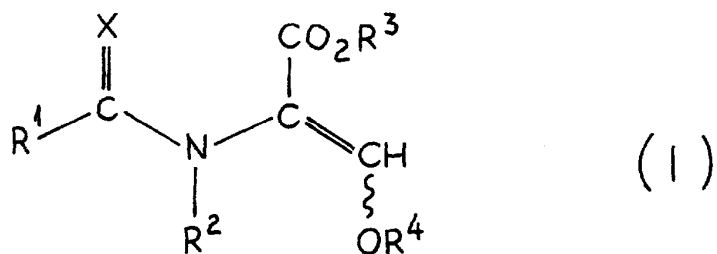
15 *kilépő csoportot, előnyösen halogénatomot vagy szulfonilcsoportot képvisel. (Elsőbbsége: 1984.10.19.)*

2 lap rajz képletekkel

(A) reakcióvázlat



Int.Cl. C 07 C 51/00; A 01 N 37/06;
C 07 C 69/734



Kiadja: Országos Találmányi Hivatal, Budapest
A kiadásért felel: Hime Zoltán osztályvezető

№ 8233. Nyomdaipari vállalat, Ungvár