

(19) Országkód:

**HU**



**MAGYAR  
KÖZTÁRSASÁG**

**MAGYAR  
SZABADALMI  
HIVATAL**

# SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám:

**213 177 B**

(21) A bejelentés ügyszáma: P 93 01887

(22) A bejelentés napja: 1993. 06. 28.

(30) Elsőbbségi adatok:  
92/08290 1992. 06. 30. FR

(51) Int. Cl.<sup>6</sup>

**A 01 N 37/18**

**C 07 C 233/65**

(40) A közzététel napja: 1993. 09. 28.

(45) A megadás meghirdetésének dátuma a Szabadalmi  
Közlönyben: 1997. 03. 28.

(72) Feltalálók:

Latorse, Marie-Pascale, Sourcieux les Mines (FR)  
Schmitz, Christian, Anse (FR)

(73) Szabadalmaz:

Rhone-Poulenc Agrochimie, Lyon (FR)

(74) Képviseelő:

S.B.G. & K. Budapesti Nemzetközi Szabadalmi  
Iroda, Budapest

(54) **Fenil-benzamid-származékot tartalmazó fungicid készítmény, eljárás a hatóanyagok előállítására és eljárás gombák elleni védekezésre**

(57) KIVONAT

A találmány tárgyát az (I) általános képletű vegyületeket – ahol

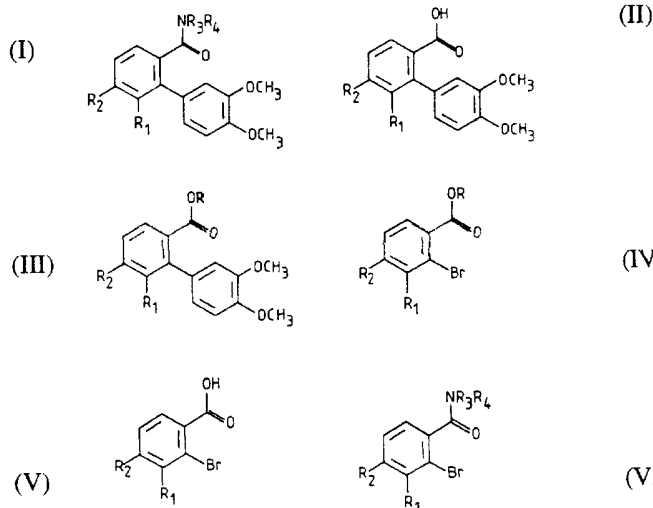
R<sub>1</sub> jelentése hidrogénatom vagy halogénatom,

R<sub>2</sub> jelentése halogénatom vagy 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoport, azzal a megkötéssel, hogy ha R<sub>2</sub> klór- vagy brómatom, akkor R<sub>1</sub> hidrogénatomtól eltérő jelentésű;

R<sub>3</sub> és R<sub>4</sub> jelentése, amelyek lehetnek azonosak vagy

különbözők, 1–4 szénatomos alkilcsoport, vagy a nitrogénatommal együtt, amelyhez kapcsolódnak, egy morfolinocsoportot alkothatnak –

hatóanyagként tartalmazó fungicid készítmények, és a készítményeknek növények gombás megbetegedések elleni védelmére szolgáló eljárás, valamint e vegyületek előállítása képezi.



A leírás terjedelme: 10 oldal (ezen belül 1 lap ábra)

**HU 213 177 B**

A találmány új fenil-benzamid-származékokat hatóanyagként tartalmazó fungicid készítményekre, a fenil-benzamid-származékok előállítására szolgáló eljárásra és növények gombás megbetegedések elleni védelmére szolgáló fungicid készítményekben való felhasználásukra irányul.

A O 360 701 számú nyilvánosságra hozott európai szabadalmi bejelentésben számos amidszármazékot, különösen fenil-benzamidokat írunk le, valamint azok hatóanyagként való használatát növények gombás megbetegedései ellen. A példák különösen azok megelőző hatásosságát mutatják, például penészgombás megbetegedések ellen.

Kutatásaink során azt találtuk, hogy e származékoknak egy szűk köre rendelkezik a már leírt tulajdonságokkal, de továbbá – és meglepő módon – ilyen aktivitással kiváló szinten, és emellett még jelentős kuratív hatással is rendelkezik.

Közelebbről, a találmány tárgyát az (I) általános képletű fenil-benzamid-származékokat – a képletben  $R_1$  jelentése hidrogénatom vagy halogénatom,  $R_2$  jelentése halogénatom vagy 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoport, azzal a megkötéssel, hogy ha  $R_2$  klór- vagy brómatom, akkor  $R_1$  hidrogénatomtól eltérő jelentésű,

$R_3$  és  $R_4$  jelentése, amelyek lehetnek azonosak vagy különbözők, 1–4 szénatomos alkilcsoport, vagy a nitrogénatommal együtt, amelyhez kapcsolódnak, egy morfolinocsoportot alkothatnak –

fenil-benzamid-származékokat tartalmazó fungicid készítmények és az előállításukra szolgáló eljárás képezik.

Ezeknek a vegyületeknek az előállítását végezhetjük a fent említett szabadalmi bejelentésben leírt eljárással.

Az előállítást végrehajthatjuk még két másik eljárással is:

Ezek közül az első szerint az (I) általános képletű vegyületeket az alább leírt (II) általános képletű vegyületekből állítjuk elő, a sav-funkciós csoportnak valamilyen aktiváló ágenssel, így előnyösen szulfínil-kloriddal, foszforil-kloriddal, foszfor-trikloriddal vagy foszfor-pentakloriddal, diciklohexil-karbodiimiddal, karbonil-diimidazollal, alkil-(klór-formiát)-okkal vagy trifluor-ecetsavanhidriddel végzett aktiválásával, majd valamilyen szerves vagy szervetlen bázis jelenlétében, valamilyen szerves oldószerben, előnyösen klórozott vagy aromás oldószerben, vagy valamilyen éterben, így tetrahydrofuranban reagáltatva a  $HNR_3R_4$  általános képletű aminnal.

A (II) általános képletű vegyületeket előállíthatjuk a (III) általános képletű vegyületek elszappanosításával, ahol R jelentése előnyösen egy alább leírt 1–4 szénatomos alkilcsoport. A reakciót valamilyen alkoholban, így etanolban hajtjuk végre, víz és valamilyen szervetlen bázis, így előnyösen kálium-hidroxid vagy nátrium-hidroxid jelenlétében, szobahőmérséklet és a reakcióelegy forráspontja közötti hőmérsékleten. A reakcióelegyhez ezután valamilyen szerves vagy szervetlen savat, így előnyösen sósavat adunk, hogy a (II) általános képletű vegyületet megkapjuk.

A (III) általános képletű vegyületek előállíthatók egy alább leírt (IV) általános képletű vegyületnek (3,4-dimetoxi-fenil)-bórsavval, katalizátor jelenlétében végzett arilkapcsolási reakciójával. A jó szelektivitás érdekében természetesen  $R_1$ -nek és  $R_2$ -nek bróm- vagy jódatomtól eltérő szubsztituensnek kell lenni.

A (3,4-dimetoxi-fenil)-bórsavat a szakirodalomban leírtakhoz [Organic Synthesis, Coll. Vol. 4, 68 vagy Journal of Organic Chemistry, 49, 5237–4243 (1984)] hasonló módon állítjuk elő.

A (IV) általános képletű észterek az alább leírt (V) általános képletű savak észterezésével nyerhetők. A reakciót valamilyen ROH általános képletű alifás alkoholban, ahol R jelentése előnyösen 1–4 szénatomos alkilcsoport, így metanolban vagy etanolban, valamilyen szervetlen sav, így gázalakú sósav vagy tömény kénsav 1% és 20% közötti változó mennyiségének jelenlétében, általában a reakcióelegy forráspontján hajtjuk végre. A terméket ezután vízben kicsapva vagy szerves oldószerrel extrahálva izoláljuk.

Az (V) általános képletű savakat az alább leírt (VI) általános képletű megfelelő antranilsavszármazékok ismert módszerekkel történő diazotálásával kapjuk.

A (VI) általános képletű antranilsavszármazékok előállítását a szakirodalom bőségesen tárgyalja.

Egy másik eljárásnál az (I) általános képletű vegyületeket az alább leírt (VII) általános képletű vegyületekből állítjuk elő

a (IV) általános képletű vegyületek (III) általános képletű vegyületekké való átalakításánál fent leírtakhoz mindenben hasonló módszerrel.

A (VII) általános képletű vegyületeket az (V) általános képletű vegyületekből állítjuk elő a (II) általános képletű vegyületeknek az (I) általános képletű vegyületekké való átalakításánál fent leírtakhoz mindenben hasonló módszerrel.

Az (V) általános képletű vegyületek (VI) általános képletű antranilsavszármazékokból való előállítását leírták a fentiekben az első eljárásnál.

#### 1. példa

N,N-Dietil-2-(3,4-dimetoxi-fenil)-4-(trifluor-metil)-benzamid. (1. számú vegyület). [Az (I) általános képletben  $R_1$  jelentése hidrogénatom,  $R_2$  jelentése trifluor-metil-csoport,  $R_3$  és  $R_4$  jelentése etilcsoport.]

Egy 1000 ml-es gömblombikba egymás után bemérünk 500 ml etilén-dikloridot, 60 g (0,184 mol) 2-(3,4-dimetoxi-fenil)-4-(trifluor-metil)-benzoesavat és 5 ml N,N-dimetil-formamidot. Ezután keverés közben a 0 °C-ra lehűtött elegyhez 20 ml (0,276 mol) szulfínil-kloridot csepegtetünk. Amikor az adagolás befejeződött, a reakcióelegyet 2 óra alatt fokozatosan felmelegítjük 55 °C-ra, majd szárazra pároljuk. A maradékot oldjuk 200 ml tetrahydrofuranban, majd ezt az oldatot 58 ml (0,55 mol) dietil-amin 200 ml tetrahydrofuranál készített és 10 °C alatti hőmérsékleten tartott oldatához csepegtetjük. Az adagolás befejeztével a reakcióelegyet szobahőmérsékleten egy órán keresztül keverjük, majd szárazra pároljuk. A maradékot oldjuk metiléndikloridban, és egymás után mossuk 1 M sósavval és

desztillált vízzel. Magnézium-szulfáton való szárítás után a szerves fázist vákuumban bepároljuk. Így fehér szilárd anyag alakjában 6,2,3 g N,N-dietil-3-(3,4-dimetoxi-fenil)-4-(trifluor-metil)-benzamidot kapunk.

Kitermelés 89%. Olvadáspont: 109–110 °C.

Hasonló módon állítjuk elő az alábbi két vegyületet:

60 g 2-(3,4-dimetoxi-fenil)-1-(morfolino-karbonil)-4-(trifluor-metil)-benzol. (2. számú vegyület). [Az (I) általános képletben R<sub>1</sub> jelentése hidrogénatom, R<sub>2</sub> jelentése trifluor-metil-csoport, R<sub>3</sub>+R<sub>4</sub> jelentése morfolinocsoport.]

Kitermelés 82,5%. Olvadáspont: 130 °C.

71,2 g N-etil-N-metil-2-(3,4-dimetoxi-fenil)-4-(trifluor-metil)-benzamid. (3. számú vegyület.) [Az (I) általános képletben R<sub>1</sub> jelentése hidrogénatom, R<sub>2</sub> jelentése trifluor-metil-csoport, R<sub>3</sub> jelentése metilcsoport, R<sub>4</sub> jelentése etilcsoport.]

Kitermelés 81%. Olvadáspont: 103–104 °C.

#### 2. példa

2-(3,4-Dimetoxi-fenil)-4-(trifluor-metil)-benzoesav. [A (II) általános képletben R<sub>1</sub> jelentése hidrogénatom, R<sub>2</sub> jelentése trifluor-metil-csoport.]

Egy 2 literes gömblombikba egymás után bemérünk 1000 ml vízmentes etanolt, 290 g (0,82 mol) 2-(3,4-dimetoxi-fenil)-4-(trifluor-metil)-benzoesav-etil-észtert és 170 ml (0,164 mol) 10 M nátrium-hidroxid oldatot. A reakcióelegyet visszafolyató hűtő alkalmazásával 2 órán keresztül forraljuk, majd vákuumban szárazra pároljuk. A maradékot oldjuk 2,5 liter vízben, és egymás után extraháljuk 500 ml etil-acetáttal és 500 ml pentánnal. A vizes fázishoz 500 g darabos jeget, majd főlegesen tömény sósavat adunk. Az ekkor keletkező csapadékot zsugorított üvegszűrőn szűrjük, majd levegőáramban megszáritjuk. Így világos nyersgyapjú színű szilárd anyag alakjában 240,5 g 2-(3,4-dimetoxi-fenil)-4-(trifluor-metil)-benzoesavat kapunk.

Kitermelés 90%. Olvadáspont: 194 °C.

#### 3. példa

2-(3,4-Dimetoxi-fenil)-4-(trifluor-metil)-benzoesav-etil-észter. [A (III) általános képletben R<sub>1</sub> jelentése hidrogénatom, R<sub>2</sub> jelentése trifluor-metil-csoport, R jelentése etil-csoport.]

Egy 4 literes gömblombikba inert atmoszférában egymás után beviszünk 263 g (0,885 mol) 2-bróm-4-(trifluor-metil)-benzoesav-etil-észtert, 750 ml 1,2-dimetoxi-etánt, 4 g tetrakisz(trifenil-foszfin)-palládiumot, 177 g (0,974 mol) 3,4-dimetoxi-fenil)-bórsavat és 1000 ml 2 M vizes nátrium-karbonát oldatot. A reakcióelegyet visszafolyató hűtő alkalmazásával tizen-négy órán keresztül forraljuk, majd vákuumban egy-harmad térfogatra bepároljuk. Ezt két liter vízhez öntjük; az ekkor kapott csapadékot zsugorított üvegszűrőn leszűrjük, vízzel mossuk, majd levegőáramban megszáritjuk. Így nyersgyapjú színű szilárd anyag alakjában 294 g 2-(3,4-dimetoxi-fenil)-4-(trifluor-metil)-benzoesav-etil-észtert kapunk.

Kitermelés 94%. Olvadáspont: 89 °C.

#### 4. példa

2-Bróm-4-(trifluor-metil)-benzoesav-metil-észter.

[A (IV) általános képletben R<sub>1</sub> jelentése hidrogénatom, R<sub>2</sub> jelentése trifluor-metil-csoport, R jelentése etilcsoport.]

Egy 2 literes gömblombikba egymás után beviszünk 238 g (0,885 mol) 2-bróm-4-(trifluor-metil)-benzoesavat, 1000 ml vízmentes etanolt és 100 ml tömény kénsavat. A reakcióelegyet visszafolyató hűtő alkalmazásával 6 órán keresztül forraljuk, majd lehűtés után 2,5 liter jég hideg vízhez öntjük; a képződött olajat etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist egymás után mossuk vízzel, 1 M nátrium-hidroxid oldattal és ismét vízzel. Magnézium-szulfáton végzett szárítás után az oldószert lepároljuk. Így sárga olaj formájában 263 g 2-bróm-4-(trifluor-metil)-benzoesav-etil-észtert kapunk.

Kitermelés 100%.

#### 5. példa

2-Bróm-4-(trifluor-metil)-benzoesav. [Az (V) általános képletben R<sub>1</sub> jelentése hidrogénatom, R<sub>2</sub> jelentése trifluor-metil-csoport.]

3 literes gömblombikba egymás után beviszünk 205 g (1 mol) 4-(trifluor-metil)-antrilsavat, 600 ml tömény ecetsavat és 400 ml 47 t%-os hidrogén-bromidot. A reaktánsok oldódása után a reakcióelegyet lehűtjük –10 °C-ra, hígítjuk 400 ml vízzel, majd a hőmérsékletet 0 °C alatt tartva 69 g (1 mol) nátrium-nitrit 200 ml vízzel készült oldatát csepegtetjük az elegyhez. Amikor az adagolás befejeződik, a reakcióelegyet 0 °C-on 2 órán át keverjük. Ezt az oldatot cseppenként adagoljuk egy 143,5 g (1 mol) réz(I)-bromid és 500 ml 47 t%-os hidrogén-bromid elegyét tartalmazó, 60 °C-on tartott 6 literes reaktorba. Az adagolás befejezése után a reakcióelegyet 60 °C-on egy órán keresztül keverjük, szobahőmérsékletűre hűtjük, és 2 liter jég hideg vízbe öntjük. A képződött csapadékot zsugorított üvegszűrőn szűrjük, vízzel mossuk és levegőáramban megszáritjuk. Így szilárd anyag alakjában 216 g 2-bróm-4-(trifluor-metil)-benzoesavat kapunk.

Kitermelés 80%. Olvadáspont: 118,5 °C.

Az ebben az 5. példában felhasznált 4-(trifluor-metil)-antrilsav [a (VI) általános képletben R<sub>1</sub> jelentése hidrogénatom, R<sub>2</sub> jelentése trifluor-metil-csoport] előállításának leírása megtalálható a szakirodalomban.

#### 6. példa

Második eljárás:

N-Etil-N-metil-2-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-diklór-benzamid. (4. számú vegyület). [Az (I) általános képletben R<sub>1</sub> és R<sub>2</sub> jelentése klóratom, R<sub>3</sub> jelentése metilcsoport, R<sub>4</sub> jelentése etilcsoport.]

Egy 500 ml-es gömblombikba inert atmoszférában egymás után beviszünk 12,4 g (0,040 mol) N-etil-N-metil-2-bróm-3,4-diklór-benzamidot, 100 ml 1,2-dimetoxi-etánt, 0,5 g tetrakisz(trifenil-foszfin) palládiumot, 8 g (0,044 mol) (3,4-dimetoxi-fenil)-bórsavat és 60 ml 2 M vizes nátrium-karbonát oldatot. A reakcióelegyet visszafolyató hűtő alkalmazásával 14 órán keresztül

forraljuk, majd vákuumban térfogatának harmadára bepároljuk. Ezt 2 liter vízbe öntjük, a képződött csapadékot üvegszűrőn szűrjük, vízzel öblítjük, és levegő-áramban megszáritjuk. Kromatográfiás úton végzett tisztítás után fehér szilárd anyag alakjában 10,3 g N-etil-N-metil-2-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-diklór-benzamidot kapunk.

Kitermelés 70%. Olvadáspont: 102 °C.

Hasonló módon állítunk elő 6,5 g-ot a következő vegyületből:

N,N-dietil-2-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-diklór-benzamid. (5. számú vegyület.) [Az (I) általános képletben R<sub>1</sub> és R<sub>2</sub> jelentése klóratom, R<sub>3</sub> és R<sub>4</sub> jelentése etilcsoport.]

Kitermelés 47,0%. Olvadáspont: 108 °C.

#### 7. példa

N-Etil-N-metil-2-bróm-3,4-diklór-benzamid. [A (VII) általános képletben R<sub>1</sub> és R<sub>2</sub> jelentése klóratom, R<sub>3</sub> jelentése metilcsoport, R<sub>4</sub> jelentése etilcsoport.]

Egy 500 ml-es gömblombikban egymás után beviszünk 200 ml etilén-dikloridot, 14 g (0,052 mol) 2-bróm-3,4-diklór-benzoosavat és 2 ml N,N-dimetil-formamidot. Ezután 0 °C-on, keverés közben 11,5 ml (0,078 mol) szulfinil-kloridot csepegtetünk az elegyhez. Az adagolás befejeztével a reakcióelegyet 2 óra alatt fokozatosan 55 °C-ra melegítjük, majd szárazra pároljuk. A maradékot oldjuk 50 ml tetrahydrofuranban, és ezt az oldatot 13 ml (0,15 mol) N-etil-N-metilamin 50 ml tetrahydrofuranal készített 10 °C alatti hőmérsékleten tartott oldatába csepegtetjük. Amikor az addíció befejeződött, a reakcióelegyet szobahőmérsékleten egy órán át keverjük, majd szárazra pároljuk. A maradékot metilén-dikloridban oldjuk, és ezt az oldatot mossuk egymás után 1 M sósavoldattal és desztillált vízzel. Magnézium-szulfáton végzett szárítás után a szerves fázist vákuumban lepároljuk. Így fehér szilárd anyag alakjában 12,4 g N-etil-N-metil-2-bróm-3,4-diklór-benzamidot kapunk.

Kitermelés 80%. Olvadáspont: 71 °C.

Hasonló módon állítunk elő 13,6 g-ot a következő vegyületből: N,N-dietil-2-bróm-3,4-diklór-benzamid. [A (VII) általános képletben R<sub>1</sub> és R<sub>2</sub> jelentése klóratom, R<sub>3</sub> és R<sub>4</sub> jelentése etilcsoport.]

Kitermelés 83,7%.

Az ebben a 7. példában kiindulási anyagként használt 2-bróm-3,4-diklór-benzoosavat [az (V) általános képletben R<sub>1</sub> és R<sub>2</sub> jelentése klóratom] úgy állítjuk elő, mint a fenti 5. példában: így nyersgyapjú színű por alakjában 63 g terméket kapunk.

Kitermelés 81%. Olvadáspont: 196 °C.

#### 8. példa

*Üvegházi in vivo kuratív teszt szőlő-perenoszpórán (Plasmopara viticola):*

Cserepekben Chardonnay-fajtájú szőlődugványokat (*Vitis vinifera*) termesztünk. Amikor ezek a csemeték 2 hónaposak (8–10 leveles fokozatúak, 20–30 cm magassággal), akkor a szőlő-perenoszpóra betegséget okozó *Plasmopara viticola* spóráinak vizes szuszpenzi-

ójával permetezve fertőzzük azokat, csemetéknél körülbelül  $1 \times 10^5$  spórával).

E fertőzés után a szőlőcsemetéket 18 °C hőmérsékleten, nedvességgel telített atmoszférában, két napig, majd 20 °C és 22 °C közötti hőmérsékleten, 90–100% relatív nedvességtartalomnál 5 napig inkubáljuk.

A fertőzött növényeket azután úgy kezeljük, hogy a vizsgálandó anyagot a kívánt koncentrációban és 20 molekula etilén-oxid szorbitán-monooleáttal képezett kondenzátumának a hatóanyag koncentrációjának feléig terjedő koncentrációját tartalmazó vizes szuszpenzióval vagy oldattal bepermetezzük. Minden egyes csemete 5 ml oldatot vagy diszperziót kap. A kezelést a hatóanyag minden egyes vizsgálandó koncentrációjával két csemetén végezzük. Kontrollként használt fertőzött csemetéket hatóanyagot nem, de etilén-oxid szorbitán-monooleáttal képezett kondenzátumát a főként azonos koncentrációban tartalmazó oldattal kezelünk.

24 órás szárítás után a vizsgálandó hatóanyaggal kezelt csemeték esetében kapott eredményeket összehasonlítjuk a kontrollként használt csemetéknél kapottakkal.

Ilyen körülmények között azt tapasztaljuk, hogy 110 ppm (= 0,11 g/liter) koncentrációban az 1–5. számú vegyületek a gomba kifejlődésének legalább 95%-os gátlását eredményezik, azaz azonos körülmények között az 1-[2-ciano-2-(metoxi-imino)-acetil]-3-etilkarbamid cimoxanil nemzetközi szabad nevű kereskedelmi referencia készítményével egyenértékű aktivitást mutatnak.

Ezek a példák jól mutatják a találmány szerinti vegyületek fungicid tulajdonságait.

Ez utóbbiak ténylegesen felhasználhatók fungicid hatóanyagok céljaira, különösen növények gombás, főleg a patogén gombák, különösen az Oomycetes családba tartozó *Phytophthora* species típusúak, így a *Phytophthora infestans* (burgonyavész vagy paradicsomvész), *Phytophthora citrophthora*, *Phytophthora capsici*, *Phytophthora cactorum*, *Phytophthora palmivora*, *Phytophthora cinnamomi*, *Phytophthora megasperma* vagy *Phytophthora parasitica*, a *Peronospora* species típusúak (különösen a dohányragya), a *Plasmopara* species típusúak, különösen a *Plasmopara viticola* (szőlő perenoszpóra) és *Plasmopara halstedei* (napraforgó üszög), a *Pseudoperonospora* species típusúak (különösen a tökfélék és a komló penészes megbetegedései) vagy a *Bremia lactucae* típusúak (salátapenész), valamint a talajgombák által okozott megbetegedései ellen.

A vegyületek előnyösen alkalmazhatók 0,01 kg/hektár és 5 kg/hektár közötti, speciálisabban 0,02 kg/hektár és 2 kg/hektár közötti adagolásban.

Gyakorlati felhasználásukban a találmány szerinti vegyületeket ritkán alkalmazzuk önmagukban. Legtöbbször készítmények alkotórészeiként szerepelnek. Ezek a készítmények, amelyeket felhasználhatunk növények gombás megbetegedések elleni védelmére vagy növényi növekedést szabályozó készítményekben, hatóanyagként legalább egy, a fentiekben leírt,

találmány szerinti vegyületet tartalmaznak a mezőgazdaságban elfogadható szilárd vagy folyékony inert hordozóanyagokkal és/vagy a hatóanyaggal kompatibilis és a mezőgazdaságban szintén elfogadható felületaktív anyagokkal kombinálva. Különösen a szokásos inert hordozóanyagok és a szokásos felületaktív ágensek használhatók.

A „hordozóanyag” kifejezés az itteni szóhasználatban olyan természetes vagy szintetikus, szerves vagy szervetlen anyagot jelen, amellyel a hatóanyagot kombináljuk, hogy a növényre, a magokra vagy a talajra való alkalmazását megkönnyítsük. Ez a hordozóanyag ezért általában inert és elfogadható kell hogy legyen a mezőgazdaságban, különösen a kezelt növény számára. A hordozóanyag lehet szilárd (agyagok, természetes vagy szintetikus szilikátok, szilikagél, gyanták viaszok, szilárd műtrágyák és hasonló) vagy folyékony (víz, alkoholok, ketonok, kőolaj-frakciók, aromás vagy paraffin szénhidrogének, klórozott szénhidrogének) vagy gázalakú.

A felületaktív ágens lehet ionos vagy nemionos típusú emulgeáló-, diszpergáló- vagy nedvesítőszer. Megemlíthetjük például a poliakrilsav sóit, a lignin-szulfonsavak sóit, a fenolszulfonsavas és naftalin-szulfonsavas sókat, az etilén-oxid zsíralkoholokkal, zsírsavakkal vagy zsírsav-amidokkal képezett polikondenzátumait, a szubsztituált fenolokat (különösen az alkil-fenolokat, vagy aril-fenolokat), a szulfo-borostyánkősav-észtereket, a taurinszármazékokat (különösen az alkil-taurinátokat) és az etilén-oxid alkohollokkal vagy fenollokkal képezett polikondenzátumainak foszforsavas észtereit. Legalább egy felületaktív anyag jelenléte általában nélkülözhetetlen olyan esetekben, amikor a hatóanyag és/vagy az inert hordozóanyag nem oldódik vízben, és amikor az alkalmazás vektor-ágense a víz.

A találmány alkalmazásánál felhasznált készítmények eléggé különböző, folyékony vagy szilárd formában lehetnek.

Folyékony vagy cseppfolyós készítményi formákként megemlíthetünk különösen emulgeálható koncentrátumokat, emulziókat, vizes szuszpenzió-koncentrátumokat, kenőcsöket, oldatokat, különösen vízdoldható koncentrátumokat, koncentrált oldatokat szerves közegben (ULV oldatokat) és aeroszolokat.

Az emulgeálható vagy oldható koncentrátumok a leggyakrabban 10 t% és 80 t% közötti, míg a használatra kész oldatok vagy emulziók 0,001 t% és 20 t% közötti mennyiségű hatóanyagot tartalmaznak. A hatóanyagon és oldószeren kívül az emulgeálható koncentrátumok tartalmazhatnak még szükség esetén egy megfelelő koszolvenst és 2 t% és 20 t% közötti mennyiségben megfelelő adalékanyagokat, így stabilizálószereket, az áthatolást biztosító szereket, korróziógátlókat, színezőanyagokat vagy tapadást biztosító anyagokat.

Ezeknek a koncentrátumoknak vízzel való hígításával bármily kívánt koncentrációjú emulziókat kaphatunk, amelyek különösen jól alkalmazhatók terményekre.

Példaként bemutatjuk néhány emulgeálható koncentrátum összetételét:

#### 9. példa

(Emulgeálható koncentrátum)

Hatóanyag (1. számú vegyület)	250 g/liter
Epoxilezett növényi olaj	25 g/liter
5 Alkilezett aril-szulfonát és poliglikol-zsíralkohol-éter elegy	100 g/liter
N,N-dimetil-formamid	50 g/liter
Xilol	575 g/liter

#### 10. példa

(Emulgeálható koncentrátum)

Hatóanyag (2. számú vegyület)	400 g/liter
Alkáli-fém-dodecil-benzolszulfonát	24 g/liter
10 mol etilén-oxid kondenzátum nonil-fenollal	16 g/liter
15 Ciklohexanon	200 g/liter
Aromás oldószerrel feltöltve	1 literre

Ezeknek a koncentrátumoknak vízzel való hígításával bármely kívánt koncentrációjú emulziót előállíthatunk, amely különösen jól alkalmazható levelekre.

A szuszpenzió-koncentrátumokat, amelyeket szintén alkalmazhatunk permetezéssel, úgy készítjük, hogy stabilis folyékony termékeket képezzenek, amelyek nem ülepednek ki. Ezek általában 10 t% és 75 t% közötti mennyiségben tartalmaznak hatóanyagot, 0,5 t% és 15 t% közötti mennyiségben felületaktív anyagot, 0,1 t% és 10 t% közötti mennyiségben tixotróp anyagot, 0 t% és 10 t% közötti mennyiségű megfelelő adalékanyagot, így habzástgátló szert, korróziógátló szert, stabilizáló ágenszt, áthatolást és tapadást biztosító anyagot, valamint hordozóanyagként vizet vagy valamilyen szerves folyadékot, amelyben a hatóanyag csak kevéssé vagy egyáltalán nem oldódik; bizonyos szilárd szerves anyagok vagy szervetlen sók oldhatók a hordozóanyagban, hogy segítsék a kiülepedés megakadályozását, vagy víz esetében fagyásgátlóként szerepeljenek.

Példaként bemutatjuk néhány vizes szuszpenzió-koncentrátum összetételét:

#### 11. példa

(Vizes szuszpenzió-koncentrátum)

Az alábbiakat tartalmazó vizes szuszpenziót készítünk:

45 Hatóanyag (3. számú vegyület)	100 g/liter
Nedvesítőszer (etilén-oxid alkil-fenollal képezett polikondenzátuma)	5 g/liter
Diszpergálószer (nátrium-naftalin-szulfonát)	10 g/liter
50 Fagyásgátló szer (propilénglikol)	100 g/liter
Sűrítőszer (poliszacharid)	3 g/liter
Biocid anyag (formaldehid)	1 g/liter
Vízzel feltöltve	1 literre

#### 12. példa

(Vizes szuszpenzió-koncentrátum)

Az alábbiakat tartalmazó vizes szuszpenziót készítünk:

60 Hatóanyag (4. számú vegyület)	250 g/liter
Nedvesítőszer (etilén-oxid-polikonden-	

zátuma egy 13 szénatomos szintetikus alkohollal)	10 g/liter
Diszpergálószer (nátrium-ligninszulfonát)	15 g/liter
Fagyásgátló szer (karbamid)	50 g/liter
Sűrítőszer (poliszacharid)	2,5 g/liter
Biocid anyag (formaldehid)	1 g/liter
Vízzel feltöltve	1 literre

*13. példa**(Vizes szuszpenzió-koncentrátum)*

Az alábbiakat tartalmazó vizes szuszpenziót készítünk:

Hatóanyag (5. számú vegyület)	500 g/liter
Nedvesítőszer (etilén-oxid polikondenzátuma egy 13 szénatomos szintetikus alkohollal)	10 g/liter
Diszpergálószer [etilén-oxid-poli(arilfenol)-kondenzátum-foszforsav-só]	50 g/liter
Fagyásgátló szer (propilénlikol)	100 g/liter
Sűrítőszer (poliszacharid)	1,6 g/liter
Biocid anyag (4-hidroxi-benzoészter-nátrium-só)	3,3 g/liter
Vízzel feltöltve	1 literre

Szilárd készítményi formákként megemlíthetünk beporzáshoz porokat (amelyek a hatóanyagot egészen 100% tartalomig tartalmazhatják) és granulátumokat, különösen az extrudálással, összesajtolással, granulált hordozóanyag impregnálásával vagy valamilyen por granulálásával [az utóbbi esetekben ezen granulátumokban az (I) általános képletű vegyület mennyisége 0,5 t% és 80 t% között lehet] kapott granulátumokat.

A nedvesíthető porokat (vagy permetezhető porokat) általában úgy készítjük, hogy azok 10 t% és 95 t% közötti mennyiségben tartalmazzák a hatóanyagot. Ezek általában tartalmazzák a szilárd hordozóanyagon kívül 0% és 5 t% közötti mennyiségben valamilyen nedvesítőszerrel, 3 t% és 10 t% közötti mennyiségben valamilyen diszpergálószerrel és, szükség esetén, 0 t% és 10 t% közötti mennyiségben egy vagy több stabilizálószerrel és/vagy más adalékanyagokat, így az áthatolást biztosító anyagokat, tapadást biztosító anyagokat, összecsomósodás elleni szereket, színezőanyagokat és hasonlókat.

Példaként bemutatjuk négy nedvesíthető por tömeg%-ban kifejezett összetételét:

*14. példa**(Nedvesíthető por)*

Hatóanyag (1. számú vegyület)	10%
Nedvesítőszer (8–10 mol etilén-oxid 13 szénatomos elágazó láncú szintetikus oxo-alkohollal képezett kondenzátuma)	75%
Diszpergálószer (neutrális kalcium-ligninszulfonát)	12%
Inert töltőanyaggal (kalcium-karbonáttal) feltöltve	100%-ra

*15. példa**(Nedvesíthető por)*

Hatóanyag (2. számú vegyület)	50%
Nedvesítőszer [(etilén-oxid)-zsíralkohol-kondenzátum]	2,5%
Diszpergálószer (etilén-oxid-sztiril-fenollal képezett kondenzátuma)	5%
Inert hordozóanyag (kréta)	42,5%

*16. példa**(Nedvesíthető por)*

A fenti példában felsoroltakkal azonos alkotórészeket használjuk az alábbi arányokban:

Hatóanyag (2. számú vegyület)	75%
Nedvesítőszer	1,5%
Diszpergálószer	8%
Inert töltőanyaggal (kalcium-karbonáttal) feltöltve	100%

*17. példa**(Nedvesíthető por)*

Hatóanyag (3. számú vegyület)	90%
Nedvesítőszer [(etilén-oxid)-zsíralkohol-kondenzátum]	4%
Diszpergálószer (etilén-oxid sztiril-fenollal képezett kondenzátuma)	6%

Ezeknek a permetezhető vagy nedvesíthető poroknak az előállításuk céljából a hatóanyagot megfelelő keverőberendezésben alaposan elkeverjük a többi anyaggal, és az elegyet valamilyen malomban vagy más alkalmas őrlőberendezésben megőröljük. Ilyen módon olyan előnyös nedvesíthetőséggel és szuszpendálhatósággal rendelkező permetezhető porokat kapunk, amelyek bármely kívánt koncentrációban szuszpendálhatók vízben, és ez a szuszpenzió nagyon előnyösen alkalmazható, különösen a növények leveleire.

Az (I) általános képletű vegyületek porok formájában beporzásra is felhasználhatók; használhatunk 50 g hatóanyagot és 950 g talkumot tartalmazó készítményt is; ugyancsak használhatunk 20 g hatóanyagot, 10 g finoman elosztatott szilikagél és 970 g talkumot tartalmazó készítményt; ezeket a komponenseket összekeverjük, megőröljük és az elegyet beporzással alkalmazzuk.

A beporzásra használt granulátumok mérete 0,1 és 2 mm között van, és előállításuk történhet agglomerálással vagy impregnálással. A granulátumok általában 0,5 t% és 25 t% közötti mennyiségű hatóanyagot és 0 t% és 10 t% közötti mennyiségű adalékanyagot, így stabilizálószerrel, a késleltetett felszabadulást befolyásoló szereket, kötőanyagokat és oldószerrel tartalmazzák.

Az alábbiakban megadjuk két példát a granulátumkészítményekre:

*18. és 19. példa**(Granulátum-készítmények)*

Hatóanyag (4. számú vegyület)	50 g	200 g
Propilénlikol	50 g	50 g

Cetil-poli(glikol-éter)	2,5 g	2,5 g
Poli(etilén-glikol)	35 g	35 g
Kaolin (részecskeméret: 0,3 mm és 0,8 mm között)	910 g	760 g

A találmány szerinti vegyületeket előnyösen formázhatjuk vízben diszpergálható granulátumok alakjában, amelyek szintén a találmány oltalmi körébe tartoznak.

Ezeknek az általában 0,3 és 0,6 közötti látszólagos sűrűséggel rendelkező diszpergálható granulátumoknak a részecskemérete általában körülbelül 150 µm és 2000 µm között, előnyösen 300 µm és 1500 µm között van.

E granulátumok hatóanyag-tartalma általában 1 t% és 90 t% között, előnyösen 25 t% és 90 t% között van.

A granulátum fennmaradó része szilárd töltőanyagból és, adott esetben, felületaktív adjuvánsokból áll, amelyek vízben diszpergálható tulajdonságokat kölcsönöznek a granulátumnak. Ezek a granulátumok két különböző típushoz tartozhatnak, attól függően, hogy az alkalmazott töltőanyag vízben oldható-e; ez lehet szerves és előnyösen szerves. Kitűnő eredmények érhetők el karbamiddal. Oldhatatlan töltőanyag esetében ez utóbbi előnyösen szerves, így például kaolin vagy bentonit. Ezt azután felületaktív ágensek (a granulátum 2 és 20 tömeg%-a közötti mennyiségben), felületaktív adjuvánsok kísérik, amelyeknek több mint fele legalább egy lényegileg anionos diszpergálószerből, így valamilyen poli(alkálifém- vagy alkáliföldfém-naftalinszulfonáttól) vagy alkálifém- vagy alkáliföldfém-ligninszulfonáttól, a fennmaradó rész pedig nemionos vagy anionos nedvesítőszerből, így valamilyen alkálifém- vagy alkáliföldfém-alkil-naftalin-szulfonáttól áll.

Ezenfelül, bár ez nem elengedhetetlen, lehetséges még más adjuvánsokat, így habzástgátló szereket is adni a készítményhez.

A találmány szerinti granulátum úgy állítható elő, hogy a kívánt alkotórészeket összekeverjük, és azután bizonyos, önmagukban ismert technikák (szemcsészés, fluidágy, porlasztás, extrudálás és hasonló) alkalmazásával granuláljuk. Az előállítás általában aprítással, majd a fent említett határok közötti részecskeméretre való szitálással fejeződik be.

A granulátumot előnyösen extrudálással nyerjük.

Az alábbi példákban megadott előállítást elvégezve a következő diszpergálható granulátum-készítményeket kapjuk:

#### 20. példa

(Diszpergálható granulátum)

Egy keverőben összekeverünk 90 tömeg% hatóanyagot (5. számú vegyület) és 10 tömeg% gyöngy formájú karbamidot. A keveréket ezután verőpálcás malomban elporítjuk. Nyirkos port kapunk így, amit perforált hengeres extruderben extrudálunk. Így granulátumot kapunk, amelyet megszártunk, majd aprítunk és megszitálunk, hogy csak 150 µm és 2000 µm közötti méretű granulátumok maradjanak vissza.

#### 21. példa

(Diszpergálható granulátum)

Keverőben a következő alkotórészeket keverjük össze:

5	Hatóanyag (2. számú vegyület)	75%
	Nedvesítőszer (nátrium-alkil-naftalinszulfonát)	2%
	Diszpergálószer (nátrium-polinaftalinszulfonát)	8%
10	Vízben oldhatatlan inert töltőanyag (kaolin)	15%

#### 22. példa

(Diszpergálható granulátum)

15	Hatóanyag (1. számú vegyület)	20%
	Nátrium-alkil-naftalinszulfonát	2%
	Nátrium-metilén-bisz(naftalinszulfonát)	8%
	Kaolin	70%

20 Ezt az elegyet víz jelenlétében fluidágyban granuláljuk, majd megszártjuk, aprítjuk és szitáljuk úgy, hogy 0,16 mm és 0,40 mm közötti méretű granulátumot nyerjünk.

25 Ezeket a granulátumokat használhatjuk önmagukban vagy vizes oldatban vagy diszperzióban, hogy a kívánt adagolást kapjuk. Felhasználhatjuk ezeket más hatóanyagokkal, különösen fungicidekkel való kombinációk előállításánál is, amikor is az utóbbiak nedvesíthető porok vagy granulátumok vagy vizes szuszpenzió formájában vannak.

30 A találmány szerinti vegyületeket formálhatjuk szerves oldatok alakjában is, amelyek kapszulázhatók, különösen határfelületi polimerizációval, polimer, így poliamid, polikarbamid vagy karbamid-poliamid alapú falakkal határolt kapszulákba. Ezek a kapszulák koncentrált vizes diszperziók formájában vannak, amelyek a felhasználás idejében hígíthatók, vagy így permetezhető elegyet kapjunk.

35 Miként már említettük, a vizes diszperziók és emulziók, például valamilyen nedvesíthető por vagy egy, a találmány szerinti emulgeálható koncentrátum vizes hígításával kapott készítmények a találmány szerint használható készítmények általános körébe tartoznak. Az emulziók lehetnek „víz-az-olajban” vagy „olaj-avízben” típusúak, és lehetnek sűrű, „majonézszerű” konzisztenciájúak.

40 A találmány tárgyát képező továbbá eljárás növények mind gyógyító, mind megelőző kezelésére fitopatogén, különösen a *Phytophthora* species típus *Oomyces* családjába tartozó gombák, így a *Phytophthora infestans* (burgonyavész és paradicsomvész), *Phytophthora citrophthora*, *Phytophthora capsici*, *Phytophthora cactorum*, *Phytophthora palmivora*, *Phytophthora cinnamoni*, *Phytophthora megasperma* vagy *Phytophthora parasitica*, a *Perenospora* species típusú (különösen a dohánypenészt okozó), a *Plasmopara* species típusú, különösen a *Plasmopara viticola* (a szőlő-perenoszpórát okozó) és a *Plasmopara halstedei* (a napraforgópenészt okozó) és a *Pseudomonas* species típusú (különösen a tökfélék és a komló penészes

megbetegedését okozók) vagy a *Bremia lactucae* típusú (a salátapeneszt okozók), valamint a talajgombák által okozott megbetegedések ellen, amely eljárásra az jellemző, hogy egy találmány szerinti származékot használunk. A találmány szerinti vegyületek kitűnő gyógyító hatása különösen előnyös, minthogy lehetővé teszi a szisztémikus megelőző kezelések számának csökkentését, miközben jól hat a paraziták ellen.

Ezek a származékok felhasználhatók egyedüli hatóanyagként, vagy más, agrokémiai hatóanyagokkal, különösen valamilyen fungicid tulajdonságú anyaggal, így a tiokarbamát- vagy az etilén-bisz(ditiokarbamát)-csoportba tartozókkal, például a tirammal, manebbel, cinebbel és mankozebbel, a ftálimid-csoportba tartozókkal, így a kaptánnal, kaptofollal és folpettel, az acil-alanin-csoportba tartozókkal, így a metalaxillal, oxadixillal és benalaxillal, a rézre alapozott vegyületek csoportjával, a foszfonsavszármazékok családjába tartozókkal, így a foszetil-alumíniummal, ditianonnal, klórtalonillal, cimoxanillal, a tiadiazol-csoportba vagy az N,N'-dialkil-N-fenil-szulfamid-csoportba tartozókkal kombinálva.

Az eljárásra az jellemző, hogy a növényekre hatóanyagként egy (I) általános képletű vegyületet tartalmazó készítmény hatásos mennyiségét alkalmazzuk. A „hatásos mennyiség” alatt olyan mennyiséget értünk, amely elegendő a növényeken jelen lévő gombák növekedésének gátlására és azok elpusztítására. Az alkalmazott adagok azonban az elpusztítandó gombától, a növény típusától, az időjárási viszonyoktól és az alkalmazott vegyülettel függően széles határok között változhatnak.

A gyakorlatban az 1 g/hektoliter és 500 g/hektoliter közötti adagok, amelyek 10 g hatóanyag/hektár és 5000 g hatóanyag/hektár közötti adagoknak felelnek meg, általában jó eredményeket adnak.

Az alkalmazható kezelési eljárások példaként megemlítjük a levelek vagy a talaj bepermetezését, beporzását, áztatását; granulátumok, porok vagy keverékek talajbavitelét; a locsolást, a fákba való injektálást, az ecsetelést és a magok kezelését.

### 23. példa

*Összehasonlító vizsgálat: in vivo kuratív hatás szőlő lisztharmat (*Plasmopara viticola*) ellen*

Chardonnay fajta szőlőcseméteket (*Vitis vinifera*) cserepekben neveltünk. Amikor a csemétek 2 hónaposaak voltak (8–10 levelesek, 20–30 cm magasságúak), permetezéssel megfertőztük a *Plasmopara viticola* vizes spórasuszpenziójával (100 000 spóra/ml). A fertőzés után a cseméteket 1 napig 18 °C-on tartott páratartalom mellett inkubáltuk.

A fertőzött növényeket ezt követően megpermeteztük a vizsgálandó hatóanyagot az alábbi táblázatban megadott koncentrációban tartalmazó vizes emulzióval, amely szorbitán-monooleátnak 20 mol etilén-oxiddal készült kondenzátumával készült, és ezt a hatóanyag koncentrációjának fele mennyiségében tartalmazta. A hatóanyag vizsgált koncentrációit 5-5 növényen alkalmaztuk. A kontrollként használt, fertőzött növényeket olyan oldattal kezeltük, amely hatóanyagot nem tartalmazott,

csak szorbitán-monooleát etilén-oxiddal készült kondenzátumát azonos koncentrációban.

Ezután a növényeket 7 napig 20 °C-on tartott páratartalom mellett tároltuk.

5 A hatást vizuálisan értékeltük, és a spórával lepett felületet (fehér zónák) határoztuk meg a levelek fonákján. A fungicid hatás mértékét a kontroll növényekhez viszonyítva, százalékosan értékeltük ki.

10 Összehasonlító hatóanyagként az EP-A 0 360 701 számú leírásban ismertetett 205. és 206. számú hatóanyagot szolgált. A találmány szerinti hatóanyagok közül az 1. és 3. számú vegyület hatását vizsgáltuk.

A tapasztalt eredményeket a következő táblázatban ismertetjük.

15

Vizsgált hatóanyag	Koncentrációja (mg/ml)	
	12	37
20 3. számú hatóanyag	53%	65%
206.* számú hatóanyag (ismert)	5%	50%
25 1. számú hatóanyag	58%	96%
205.** számú hatóanyag (ismert)	20%	38%

\* N,N-dietil-2-(3,4-dimetoxi-fenil)-4-bróm-benzamid

30 \*\* N-etil-N-metil-2-(3,4-dimetoxi-fenil)-4-bróm-benzamid

Az eredmények azt mutatják, hogy a találmány szerinti hatóanyagoknak kuratív hatásuk van, és ez a hatás az ismert hatóanyagoknál hiányzik, illetve rendkívül mérsékelt, ami gyakorlati felhasználáshoz nem kielégítő.

35

## SZABADALMI IGÉNYPONTOK

40 1. Fungicid készítmény, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként 0,001–95 tömeg% (I) általános képletű fenil-benzamid-származékot – a képletben

R<sub>1</sub> jelentése hidrogénatom vagy halogénatom,

45 R<sub>2</sub> jelentése halogénatom vagy 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoport, *azzal a megkötéssel*, hogy ha R<sub>2</sub> klór- vagy brómatom, akkor R<sub>1</sub> hidrogénatomtól eltérő jelentésű,

R<sub>3</sub> és R<sub>4</sub> jelentése, amelyek lehetnek azonosak vagy különbözők, 1–4 szénatomos alkilcsoport, vagy a 50 nitrogénatommal együtt, amelyhez kapcsolódnak, egy morfolinocsoportot alkothatnak – tartalmaz a szokásos segédanyagokkal együtt.

2. Az 1. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy olyan (I) általános képletű hatóanyagot tartalmaz, amelynek képletében R<sub>1</sub> és R<sub>2</sub> jelentése klóratom, vagy R<sub>1</sub> hidrogénatom vagy klóratom és R<sub>2</sub> jelentése klóratom vagy trifluor-metil-csoport az 1. igénypontbeli megkötéssel.

55

3. Az 1. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy olyan (I) általános képletű hatóanyagot

60



tartalmaz, amelynek képletében  $R_1$  jelentése hidrogénatom és  $R_2$  jelentése trifluor-metil-csoport.

4. Az 1. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy olyan (I) általános képletű hatóanyagot tartalmaz, amelynek képletében  $R_3$  és  $R_4$  jelentése, amelyek lehetnek azonosak vagy különbözők, metil-csoport vagy etilcsoport.

5. Az 1. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy olyan (I) általános képletű hatóanyagot tartalmaz, amelynek képletében  $R_3$  és  $R_4$  a nitrogénatommal együtt, amelyhez kapcsolódnak, egy morfolinocsoportot alkotnak.

6. Eljárás (I) általános képletű fenil-benzamid-származékok – a képletben  $R_1$ ,  $R_2$ ,  $R_3$  és  $R_4$  az 1. igénypontban megadott jelentésűek – előállítására, *azzal jellemezve*, hogy

a) egy (II) általános képletű vegyület – a képletben  $R_1$  és  $R_2$  a fenti jelentésűek – savas funkciós csoportját aktiváljuk, és az aktivált vegyületet szerves oldószerben szerves vagy szervetlen bázis jelenlétében egy  $HNR_3R_4$  általános képletű aminsármazékkal –  $R_3$  és  $R_4$  a fenti jelentésűek – reagáltatjuk, vagy

b) olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében  $R_1$  és  $R_2$  bróm- vagy jódatomtól eltérő jelentésű – egy (VII) általános képletű vegyületet, amelyben mind  $R_1$ , mind  $R_2$  brómatomtól vagy jódatomtól eltérő jelentésű,  $R_3$  és  $R_4$  a fenti jelentésűek, (3,4-dimetoxi-fenil)-bórsavval katalizátor jelenlétében reagáltatunk.

7. A 6. igénypont szerinti a) eljárás, *azzal jellemezve*, hogy a savas funkciós csoportot szulfinil-kloriddal, foszforil-kloriddal, foszfor-trikloriddal vagy foszfor-pentakloriddal, dicitklohexil-karbodiimiddal, karbonil-diimidazolal, alkil-(klór-formiát)-tal és trifluor-ecetsavanhidriddel aktiváljuk; és a  $HNR_3R_4$  általános képletű aminsármazékkal való reakciót klórozott vagy aromás oldószer és éter, így tetrahydrofuran, valamelyikében hajtjuk végre.

8. Eljárás növényeket károsító gombák elleni védekezésre, *azzal jellemezve*, hogy a növényeket vagy életterüket 10–5000 g/ha hatóanyagoknak megfelelő mennyiségű 1. igénypont szerinti fungicid készítménnyel kezeljük.

9. A 8. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy gombafertőzött növényeket kezelünk.

