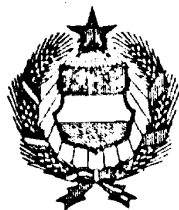


# SZABADALMI LEÍRÁS

(19) HU

MAGYAR  
NÉPKÖZTÁRSASÁG



ORSZÁGOS  
TALÁLHMÁNYI  
HIVATAL

(11)

**189687**

B  
Nemzetközi  
osztályjelzet:  
(51) NSZO,

A01N 43/50  
A01N 43/653  
C07D 233/61  
C07D 249/08,

A bejelentés napja: (22) 83.05.18. (28) (1748/83)

A bejelentés elsőbbsége: (33) DE:  
(32) 82.05.19.  
(38) (P 32 19 041.7.)

A közzététel napja: (41) (42) 84.06.28.

Megjelent: (45) 1989. 03. 20.

Feltaláló(k): (72)

dr. ELBE Hans-Ludwig, vegyész, dr. KRAMER  
Wolfgang, vegyész, Wuppertal, dr. BÜCHEL  
Karl Heinz, vegyész, Burscheid, dr. LÜRSEN  
Klaus, biológus, Bergisch-Gladbach, dr. REINECKE  
Paul, biológus, dr. SCHEINPFLUG Hans, biológus,  
Leverkusen, DE

Szabadalmas: (71)

BAYER AG., Leverkusen, DE

(54)

Hatóanyagként 1-azolil-2-oximino-bután-származékokat tartalmazó fungicid  
és növény-növekedést befolyásoló kompozíciók, valamint eljárás  
1-azolil-oximino-bután-származékok előállítására

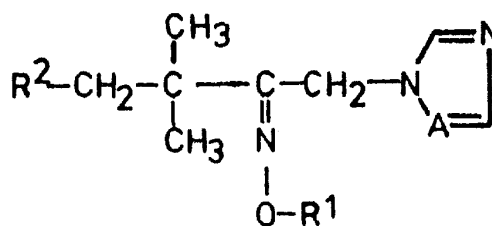
(57) KIVONAT

A találmány szerinti készítmények hatóanyagát az (I) általános képlet jellemzi – a képletben

A jelentése hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkil-, 5-7 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy a fenilgyűrűn két klóratommal vagy egy 1-4 szénatomos alkoxycsoporttal szubsztituált benzilcsoport,

R<sup>2</sup> jelentése klóratommal egyszeresen szubsztituált fenil-fenoxi- vagy fenil-tio-csoport. –

A találmány szerinti eljárással a fenti hatóanyagokon kívüli (I) általános képlettel jellemezhető 1-azolil-2-oximino-bután-származékok is előállíthatók.



(I)

A találmány tárgya eljárás új, (I) általános képletű 1-azolil-2-oximino-bután-származékok és e vegyületek savaddíciós sóinak és rézsókomplexeinek előállítására. A találmány tárgyához tartoznak (I) általános képletű vegyületek egy részét hatóanyagként tartalmazó fungicid növénynövekedést szabályozó szerek is.

Ismeretes, hogy a szubsztituált 2-azolil-1-benzil-oximino-1-fenil-etánok jó fungicid tulajdonságot mutatnak (lásd: 2 657 578, 2 723 942 és 2 816 817. sz. NSZK-beli közrebocsátási iratot). E vegyületek hatása azonban különösen kis koncentráció és alacsony dózisértékek mellett nem mindig kielégítő.

Az (I) általános képletben

A<sup>1</sup> jelentése nitrogénatom vagy CH-csoport,

R<sup>1</sup> jelentése hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkil-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos alkinilcsoport, ciklopentil-, ciklohexil-, vagy a fenilgyűrűn két klór- vagy egy 1,4 szénatomos alkoxycsoporttal szubsztituált benzilcsoport,

R<sup>2</sup> jelentése halogénatommal egyszeresen szubsztituált fenil-tio-csoport vagy adott esetben halogénatommal egyszeresen szubsztituált fenilcsoport vagy halogénatommal legfeljebb kétszeresen vagy halogénatommal és 1,4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált fenoxycsoport.

R<sup>2</sup> jelentése halogénatommal egyszeresen szubsztituált csoport, halogénatommal egyszeresen szubsztituált fenilcsoport. Legfeljebb kétszeresen vagy halogénatommal és 1,4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált fenilcsoport.

Az (I) általános képletű vegyületek szin- vagy anti-alakban fordulhatnak elő, általában e két izomer elegyét kapjuk.

Az (I) általános képletű 1-azolil-2-oximino-bután-származékokat oly módon állíthatjuk elő, hogy a) (II) általános képletű azolil-ketont, a képletben A és R<sup>2</sup> jelentése a fenti, (III) általános képletű szubsztituált hidroxil-aminnal – a képletben R<sup>1</sup> jelentése a fenti – adott esetben hígítószer jelenlétében reagáltatunk, vagy

b) (Ia) általános képletű 1-azolil-2-oximino-bután-származékot – a képletben A és R<sup>2</sup> jelentése a fenti – (IV) általános képletű halogéniddel – a képletben R<sup>1</sup> jelentése a fenti és Hal jelentése klóratom vagy brómatom – adott esetben erős bázis és hígítószer jelenlétében reagáltatunk, majd a kapott (I) általános képletű vegyületeket kívánt esetben savaddíciós sóvá, előnyösen sósavas sóvá vagy rézsó komplexszé, célszerűen rézklorid komplexszé alakítjuk.

Az (I) általános képletű vegyületekből adott esetben savval vagy rézsóval addíciós sót képezhetünk.

Ezen túlmenően azt tapasztaltuk, hogy az új (I) általános képletű 1-azolil-2-oximino-bután-származékok, továbbá e vegyületek savaddíciós sói és rézsó-komplexei erős fungicid és növényi növekedést szabályozó hatást mutatnak.

Azt találtuk, hogy a találmány szerinti eljárással előállított (I) általános képletű vegyületek kedvezőbb fungicid hatást mutatnak, mint a technika állásából ismert szubsztituált 2-azolil-1-(benzil-oximino)-1-fenil-etán-származékok, amelyek kémiaiilag és a hatás tekintetében közelálló vegyületek. A talá-

mány szerinti eljárással előállított (I) általános képletű vegyületek meglepően jó növényi növekedést szabályozó hatást mutatnak.

Ily módon a találmány szerinti eljárással előállított vegyületek a technika állását gazdagítják.

Azok a találmány szerinti eljárással előállított (I) általános képletű vegyületek, ahol a képletben R<sup>1</sup> jelentése hidrogénatom, kedvező közbenső termékek, így például e vegyületeket savhalogénidekkel, izocianátokkal, vagy karbamoil-kloriddal reagáltatva ismert módon savszármazékokat vagy karbamoil-származékokat állíthatunk elő.

Előnyösen alkalmazhatók azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R<sup>1</sup> jelentése egyenes vagy elágazó láncú 1-8 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncú 2-4 szénatomos alkenil- vagy 2-4 szénatomos alkinil-, ciklopentilcsoport, továbbá adott esetben 1-2-szeresen szubsztituált benzilcsoport, ahol szubsztituensként előnyösen klóratom vagy metoxycsoport szerepelhet. R<sup>2</sup> jelentése adott esetben egyszeresen szubsztituált fenil-, fenil-oxi-, fenil-tio-csoport, szubsztituensként célszerűen figyelembe jöhet klór- vagy fluoratom, metilcsoport.

Az (I) általános képletű vegyületek közül (A) jelentése nitrogénatom vagy CH-csoport) célszerűen az alábbi táblázatban felsorolt vegyületeket állítjuk elő:

Táblázat

	R	R <sup>2</sup>	
30	CH <sub>3</sub>	(a) képletű csoport	
	CH <sub>3</sub>	(b) " "	
	CH <sub>3</sub>	(c) " "	
	CH <sub>3</sub>	(d) " "	
35	CH <sub>3</sub>	(e) " "	
	CH <sub>3</sub>	(f) " "	
	CH <sub>3</sub>	(g) " "	
	CH <sub>3</sub>	(h) " "	
	CH <sub>3</sub>	(i) " "	
40	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(a) " "	
	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(b) " "	
	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(c) " "	
	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(d) " "	
	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(e) " "	
45	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(f) " "	
	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(g) " "	
	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(h) " "	
	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(i) " "	
50	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(a) " "	
	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(b) " "	
	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(c) " "	
	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(d) " "	
	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(e) " "	
	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(f) " "	
	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(g) " "	
55	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(h) " "	
	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(i) " "	
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(a) " "	
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(b) " "	
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(c) " "	
60	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(e) " "	

i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(f)	„	„
i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(g)	„	„
i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(h)	„	„
i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(i)	„	„
n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(a)	„	„
n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(b)	„	„
n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(c)	„	„
n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(d)	„	„
n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(e)	„	„
n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(f)	„	„
n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(g)	„	„
n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(h)	„	„
n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(i)	„	„
i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(a)	„	„
i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(b)	„	„
i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(c)	„	„
i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(d)	„	„
i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(e)	„	„
i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(f)	„	„
i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(g)	„	„
i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(h)	„	„
i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(i)	„	„
i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub>	(a)	„	„
CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub>	(b)	„	„
CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub>	(c)	„	„
CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub>	(d)	„	„
CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub>	(e)	„	„
CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub>	(g)	„	„
CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub>	(f)	„	„
CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub>	(h)	„	„
CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub>	(i)	„	„
CH=C-CH <sub>2</sub>	(a)	„	„
CH=C-CH <sub>2</sub>	(b)	„	„
CH=C-CH <sub>2</sub>	(c)	„	„
CH=C-CH <sub>2</sub>	(d)	„	„
CH=C-CH <sub>2</sub>	(e)	„	„
CH=C-CH <sub>2</sub>	(f)	„	„
CH=C-CH <sub>2</sub>	(g)	„	„
CH=C-CH <sub>2</sub>	(h)	„	„
CH=C-CH <sub>2</sub>	(i)	„	„
(k) képlet csoport	(a) képletű csoport		
(k) „	(b) „		
(k) „	(c) „		
(k) képletű csoport	(d) „		
(k) képletű csoport	(e) „		
(k) „	(f) „		
(k) „	(g) „		
(k) „	(h) „		
(k) „	(i) „		
CH <sub>3</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub>	(a)	„	„
CH <sub>3</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub>	(b)	„	„
CH <sub>3</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub>	(c)	„	„
CH <sub>3</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub>	(d)	„	„
CH <sub>3</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub>	(e)	„	„
CH <sub>3</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub>	(f)	„	„
CH <sub>3</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub>	(g)	„	„
CH <sub>3</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub>	(h)	„	„
CH <sub>3</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub>	(i)	„	„

Abban az esetben, ha a kiindulási anyagként 60

4-(4-klór-fenil-tio)-3,3-dimetil-1-(imidazol-1-il)-butan-2-ont és O-(2-butil)-hidroxil-amin használunk, a reakció menetét az A reakcióvázlattal szemléltethetjük.

Abban az esetben, ha kiindulási anyagként 4-(4-klór-fenil-tio)-3,3-dimetil-1-(imidazol-1-il)-2-oximino-butánt és jódotant használunk, a reakciómenetét a B reakcióvázlattal mutatjuk be.

Ha kiindulási anyagként 1-klór-4-(4-klór-fenil-tio)-3,3-dimetil-2-metil-oximino-bután és 1,2,4-triazol szerepel, a reakció menetét a C reakcióvázlattal mutathatjuk be.

Az (a) eljárásnál kiindulási anyagként használt azolil-kezonokat a (II) általános képlettel jellemezhetjük. E képletben a szubsztituensek célszerű jelentése megegyezik az (I) általános képletnél felsorolt célszerű jelentésekkel.

A (II) általános képletű azolil-származékok nem ismertek, a 3 048 266 számú NSZK-beli szabadalmi bejelentés írja le e vegyületeket. E vegyületeket a fenti számú bejelentésben ismertetett eljárással lehet előállítani oly módon, hogy valamely (VI) általános képletű 1-halogén-2-butanon-származékot – a képletben R<sup>2</sup> jelentése a fenti és Hal jelentése klór vagy brómatom – ismert módon 1,2,4-triazollal, vagy imidazollal valamely közömbös szerves oldószerben például dimetil-formamiddal egy savmegkötőanyag így pl. kálium-karbonát jelenlétében, 40–120°C közötti hőmérsékletre reagáltatnak.

Az a) eljárásához kiindulási anyagként alkalmazott, adott esetben szubsztituált (III) általános képletű hidroxil-amin-származékokat a (II) általános képlettel jelöljük. E képletben R<sup>1</sup> célszerű jelentése az (I) általános képletben megadott célszerű jelentésekkel azonos.

A (III) általános képletű, adott esetben szubsztituált hidroxil-aminok ismert vegyületek.

A b) eljárásnál kiindulási anyagként alkalmazott 1-azolil-2-oximino-bután-származékokat az (Ia) általános képlettel jellemezhetjük. E képletben R<sup>2</sup> és A jelentése az (I) általános képletnél megadott jelentésekkel azonos. Az (Ia) általános képletű vegyületek a találmány oltalmi köréhez tartoznak és az a) eljárással állíthatók elő.

A b) eljárásnál kiindulási anyagként alkalmazott halogénideket a (IV) általános képlettel jellemezhetjük, e képletben R<sup>1</sup> jelentése megegyezik az (I) általános képletnél megadott jelentésekkel, Hal jelentése célszerűen klór-, vagy jódatom.

A (IV) általános képletű vegyületek ismert vegyületek.

Az a) eljárásnál alkalmazandó hígítószerke közül elsősorban az alkoholokat vagy vizet, illetőleg ezek egyét említjük meg.

Az a) eljárásnál a reakcióhőmérsékletet széles tartományban változtathatjuk, általában 20–120 előnyösen 50–150°C közötti hőmérsékleten dolgozunk.

Az a) eljárásnál 1 mól (II) általános képletű azolil-kezonra előnyösen 1–1,3 mól (III) általános képletű hidroxil-amin alkalmazunk, az előállított (I) általános képletű vegyületek elkülönítése szokásos módon történik.

Az a) eljárás előnyös megoldásánál a (III) általá-

nos képletű hidroxil-amin-származékokat sók formájában, elsősorban sósavas só alakjában, adott esetben egy savmegkötőszer, így pl. nátrium-acetát, jelenlétében reagáltatjuk. (Lásd az előállítási példákat.)

A b) eljárásváltozatnál hígítószerként közömbös szerves oldószereket alkalmazunk, ezek közül említjük meg az étereket, mint a tetrahydrofuránt, vagy dioxánt, az aromás szénhidrogéneket így a toluolt, vagy benzolt, egyes esetekben klórozott szénhidrogéneket, így kloroformot, metilén-kloridot, vagy széntetrakloridot, továbbá hexametil-foszfor-sav-triamidot, savamidokat, így dimetil-formamidot és szulfoxidot, valamint dimetil-szulfoxidot használhatunk.

A találmány szerinti b) eljárást adott esetben egy erős bázis jelenlétében végezzük, ezek közül említjük meg az alkálifém-aminokat, -hidrideket, -hidroxidokat és -karbonátokat mint pl. kálium-amid, -karbonát, -hidroxid- vagy hidrid, továbbá a kvaterner ammónium-hidroxidokat és foszfónium-hidroxidokat, mint pl. a tetrametil-ammónium-hidroxidot, a benzil-trimetil-ammónium-hidroxidot, vagy a dibenzil-dimetil-ammónium-hidroxidot és a tetrafenil-foszfónium-hidroxidot vagy metil-trifenil-foszfónium-hidroxidot.

A b) eljárásnál a reakció hőmérsékletét széles tartományban változtathatjuk, általában 20–150°C között, előnyösen szobahőmérsékleten dolgozunk. Egyes esetekben célszerű az oldószer forráspontján így pl. 60– és 120°C közötti hőmérsékleten dolgozni.

A b) eljárásnál 1 mól (Ia) általános képletű oximra általában 1–3 mól (IV) általános képletű halogenidet alkalmazunk. A végtermék elkülönítésére a reakcióelegyből az oldószert eltávolítjuk, majd a maradékhoz vizet és egy szerves oldószert adunk. A szerves fázist elkülönítjük, szokásos módon feloldozzuk és tisztítjuk.

A b) eljárás egyik változata szerint a reakciót kétfázisos rendszerben végezzük, így például vizes nátrium- vagy kálium-hidroxid/toluol vagy metilén-klorid elegyével dolgozunk, az elegyhez 0,01–1 mól fázistranszfer katalizátort, így például ammónium- vagy foszfónium-vegyületet adunk, a szerves fázisban így a határfelületen etilátok képződnek, amelyek a szerves fázisban lévő halogenidekkel reagálnak.

Az (I) általános képletű vegyületek agrotechnikai szempontból megfelelő savadiciós sóinak előállításánál az alábbi savak jöhetnek figyelembe: hidrogén-halogén-savak, mint pl. sósav, vagy hidrogén-bromid, célszerűen sósav, továbbá foszforsav, salétromsav, kénsav, mono- vagy egy vagy kétértékű karbonsavak, hidroxikarbonsavak, így például ecetsav, maleinsav, borkősav, borostyánkősav, fumársav, citromsav, szalicilsav, szorbinsav, tejsav, továbbá szulfonsavak, így pl. p-toluol-szulfonsav- és 1,5-naftalindiszulfonsav.

Az (I) általános képletű vegyületek savadiciós sóit egyszerű eljárással ismert módon állíthatjuk elő, így például az (I) általános képletű vegyületeket valamely közömbös oldószerekben feloldjuk, ehhez savat, így például sósavat adunk, a kapott sóit ismert módon így például szűrővel elkülönítjük, a sóit közömbös szerves oldószerekkel mosva

tisztítjuk.

A találmány szerinti eljárással előállított vegyületek erős fungicid tulajdonsággal rendelkeznek és ezért nemkívánatos gombák ellen alkalmazhatók. A találmány szerinti készítményeket fungicid szerként használhatjuk.

A találmány szerinti fungicid szereket Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes, Deuteromycetes ellen használhatjuk.

A találmány szerinti készítményeket a növények jól tűrik és ezért a szükséges koncentrációban a növények föld feletti részei, a vetőmag és a talaj egyaránt kezelhető.

A találmány szerinti készítményeket jó eredménnyel alkalmazhatjuk a gabonamegbetegedések így például az árpalisztharmat (*Erysiphe graminis*) előidézője ellen, továbbá a (*Drechslera graminiae*) esetében, valamint *Pyrenophora teres* és *Cochliobolus sativus* előidézője ellen, rizsnövényen fellépő gombák ellen, és *Pyricularia oryzae* vagy *Pellicularia sasakii* ellen, a *Venturia-félékkel* szemben így például az almahéj foltosság előidézőjével (*Venturia inaequalis*) szemben.

A találmány szerinti hatóanyagokat tartalmazó készítmények a növények metabolizmusát befolyásolják, ezért növekedést szabályozó szerként alkalmazhatók.

A növényi növekedést befolyásoló anyagok esetében azt tapasztaltuk, hogy egy adott hatóanyag többféle hatást fejthet ki a növényekre. A hatás függ az alkalmazás időpontjától, a növény fejlődésének stádiumától, a felvitt hatóanyag mennyiségétől és az alkalmazás módjától. A növekedést szabályozó anyagoktól azt várjuk, hogy a kultúr-növényeket kíván, adott módon befolyásolják.

A hatóanyagokat ismert módon készítménnyé alakíthatjuk, oldatokat, emulziókat, szuszpenziókat, port, habot, pasztát, granulát, aeroszolt, polimer anyagok segítségével készített kapszulákat, a vetőmagok számára bevonóanyagot továbbá ULV készítményeket állíthatunk elő.

A készítményeket ismert módon állítjuk elő, így a hatóanyagot valamely segédanyaggal, hígítóanyaggal, folyékony oldószerekkel, nyomás alatt cseppfolyósítható gázokkal és/vagy szilárd hordozóanyagokkal, adott esetben felületaktív anyagokkal, így emulgeálószerekkel és/vagy diszpergáló szerekkel és/vagy habzást előidéző anyagokkal elegyíthetjük. Abban az esetben, ha hígítószerként vizet használunk, oldást elősegítő anyagként használhatunk szerves oldószereket is. Folyékony oldószereként az alábbiak jöhetnek figyelembe, aromás anyagok, így xilol, toluol, vagy alkil-naftalin, klórozott aromás vagy klórozott alifás szénhidrogének, így klór-benzol, klór-etilén, metilén-klorid, alifás szénhidrogének, mint ciklohexán vagy paraffinok, így például kőolaj frakciók, alkoholok, mint butanol vagy glikol, továbbá ezek éter- vagy észterszármazékai, ketonok, így acetone, metil-, etil-keton, metil-izobutil-keton vagy ciklohexanon, erősen poláros oldószerek mint dimetil-formamid és dimetil-szulfoxid, továbbá víz. Cseppfolyósított gázhalmazállapotú hígítószer, illetőleg hordozóanyagok alatt olyan folyadékokat értünk, amelyek normál hőmérsékleten és nyomáson gáz-

halmazállapotúak, mint például az aeroszol hajtógázok, így a halogénezett szénhidrogének, továbbá bután, propán, nitrogén és széndioxid. A szilárd hordozóanyagok közül említhetjük meg, például a közszalékokat, mint kaolin, agyagföld, talkum, kréta, kvarc, attapulgit, montmorillonit, diatomaföld, továbbá a nagy diszperzitású kovasavak, alumínium-oxidot, vagy a szilikátokat. A granulátumok előállításához szilárd hordozóanyagként figyelembe jöhetnek például az őrlött és frakcionált természetes kőzetek, így kalcit, márvány, habkő, szepiolit, dolomit, továbbá szerves és szerves lisztekkel készült granulátumok, továbbá szerves anyagokból készült granulátumok, így például fűrészporból, kókuszdióból, kukoricacsutkákból, a dohány-növény szárából készült granulátumok. Emulgeáló és/vagy habképző szerként az alábbiak jönnek figyelembe: nemionos vagy anionos emulgeátorok, így például poli-(oxi-etilén)-zsírsav-észterek, poli(oxi-etilén)-zsralkohol-észterek, például alkil-, aril-, poliglikol-éterek, alkil-szulfonátok, alkil-szulfátok, aril-szulfátok, továbbá fehérje hidrolizátum.

Diszpergálószerként az alábbiak jönnek figyelembe: így például a ligninszulfid, továbbá a metil-cellulóz.

A készítményekben kötőanyagként karboximetil-cellulóz, természetes vagy szintetikus porszerű anyagok, szemcsés vagy látex alakú polimerek, így gumiarabikum, poli(vinil-alkohol), poli(vinil-acetát) jöhetnek figyelembe.

A készítményekhez festékként használhatunk szerves pigmenteket, így például vas-oxidot, titán-oxidot, ferrocianidokat, továbbá szerves színezékeket, mint alizarint, azo-fém-ftalocianin-színezékeket, továbbá nyomelemeket, mint vas-, mangán-, réz-, kobalt-, molibdén- vagy cinksókat.

A készítmények általában 0,1–60 súly% hatóanyagot, célszerűen 0,5–60 súly% hatóanyagot tartalmaznak.

A találmány szerinti készítmények egyéb hatóanyagokkal, így fungicid, inszekticid, akaricid, herbicid anyagokkal, továbbá műtrágyákkal, növekedést szabályozó anyagokkal keverhetők össze.

A találmány szerinti készítményeket kívánt esetben alkalmazás előtt hígíthatjuk, a készítmények oldatok, emulgeálható koncentrátumok, emulziók, habok, szuszpenziók, szóróporok, paszták, oldható porok, porzószerke, és granulák formájában kerülhetnek forgalomba. A készítményeket szokásos módon permetezéssel, felszórással, porozással, habkészítéssel, kenéssel stb. hordjuk fel, lehetőség van arra is, hogy a találmány szerinti készítményeket ULV eljárásban permetezzük fel, a vetőmag és a növény egyaránt kezelhető.

A találmány szerinti vegyületeket növényi növekedést szabályozó szerekben is alkalmazhatjuk, ebben az esetben a vegyületek koncentrációja széles tartományban változhat, általában hektáronként 0,01–50 kg, célszerűen 0,05–10 kg hatóanyag kerülhet felhordásra.

Abban az esetben, ha a találmány szerinti készítményeket a növényi növekedés befolyásolására alkalmazzuk, az alkalmazást egy előnyös időpontban kell végezni, ez az időpont az időjárási viszonyoktól és a vegetatív adottságoktól függ.

5 Abban az esetben, ha a találmány szerinti készítményeket fungicid-szerként alkalmazzuk, a hatóanyag mennyisége széles tartományban változhat. A hatóanyag koncentrációja, ha a növényeket kezeljük, általában 1 és 0,001 tömeg%, célszerűen 0,5–0,001 tömeg% között van. A vetőmag kezelése esetében a hatóanyag mennyisége általában 0,001–50 g, célszerűen 0,01–10 g e vetőmag kg-jára számítva. Ha a találmány szerinti készítményekkel a talajt kívánjuk kezelni, a hatóanyag koncentrációja 0,00001–0,1 tömeg%, célszerűen 0,0001–0,02 tömeg%.

15 Előállítási példák

1. példa

Az (1) képletű vegyület előállítása

a) eljárás

20 30,9 g (0,1 mól) 4-(4-klór-fenil-tio)-3,3-dimetil-1-(imidazol-1-il)-butan-2-ont és 11,6 g (0,13 mól) 0-(2-butyl)-hidroxil-amin és 2 g p-toluol-szulfonsavnak 600 ml toluollal készült oldatával 20 óra hosszat (vízelválasztó feltét és visszafolyató hűtő alkalmazása mellett) forralunk. A reakcióelegyet lehűtjük, vízzel mossuk, nátrium-szulfáttal szárítjuk, vákuummal betöményítjük. A maradékot oszlopkromatográfiával tisztítjuk. Ilymódon 10,6 g (28 t%) 2-(2-butyl-oximino)-4-(4-klór-fenil-tio)-3,3-dimetil-1-(imidazol-1-il)-butánt kapunk, olajos termék formájában.  $n_D^{20} = 1,5630$

30 Kiindulási vegyületek előállítása

A (91) képletű vegyület előállítása

35 199 g (0,618 mól) 1-bróm-4-(4-klór-fenil-tio)-3,3-dimetil-butan-2-ont 120 ml (1,76 mól) imidazol és 2,435 (1,76 mól) kálium-karbonátot 3 liter acetonban 5 óra hosszat visszafolyató hűtő alatt, keverés közben forralunk. Ezt követően az elegyet lehűtjük, a szerveset sokat leszűrjük, a szűrletet betöményítjük. A maradékot metilén-kloriddal felvesszük, vízzel háromszor mossuk, nátrium-szulfáttal szárítjuk, majd betöményítjük. (izopropil-éterből való átkristályosítás után 156 g 4-(4-klór-fenil-tio)-3,3-dimetil-1-(imidazol-1-il)-butan-2-ont kapunk. Op.: 50°C.

A (92) képletű vegyület előállítása

45 97 g (0,4 mól) 1-(4-klór-fenil-tio)-2,2-dimetil-butan-3-ont szobahőmérsékleten lassan 64 g 0,4 mól brómmal reagáltatunk. A reakcióelegyet az 1-es példában leírtak szerint dolgozzuk fel. 127 g (99t%) 1-bróm-4-(4-klór-fenil-tio)-3,3-dimetil-butan-2-ont kapunk olajos termék formájában.

50 A (93) képletű vegyület előállítása

55 134,5 g (1 mól) 4-klór-pinakolon, 216 g (1,5 mól) 4-klór-tiofenol, 210 g 1,52 mól kálium-karbonát és 500 ml dimetil-formamid elegyével 15 óra hosszat 150°C hőmérsékleten 2–4 bar nyomáson kevertetünk. Az elegyet ezután hagyjuk szobahőmérsékletre lehűlni, majd 10 l vízzel elkeverjük és éterrel extraháljuk. Az éteres fázist nátrium-szulfáttal szárítjuk, bepároljuk, a maradékot vákuumban ledesztilláljuk. Ilymódon 151 g 1-(4-klór-fenil-tio)-2,2-dimetil-butan-3-ont kapunk. (Hozam: 62 t%). Forráspont: 146°C/0,7 mbar.

60

189 687

## A (94) képletű vegyület előállítása

11,6 g (0,1 mól) 2,2-dimetil-1-hidroxi-butan-3-ont (a 3-as példa szerint előállítva) 50–60°C hőmérsékleten (jeges hűtéssel) 20,5 g (0,1 mól) N,N-dimetil-1,2,2-triklór-vinil-aminhoz csepegtetünk. Az elegyet 2 óra hosszat 60°C hőmérsékleten kevertetjük, majd vízsugárszivattyú segítségével ledesztilláljuk. 8,1 g 4-klór-pinakolint kapunk, hozam: 60%, forráspont: 60–62°C/16 mbar.

## 2. példa

## A (2) képletű vegyület előállítása

## a) eljárás

30,9 g (0,1 mól) 4-(4-klór-fenil-tio)-3,3-dimetil-1-(imidazol-1-il)-butan-2-ont, 20 g (0,13 mól) hidroxil-amin-hidrokloridot, 11,8 g (0,13 mól) trietil-amin és 2 g p-toluolszulfonsavnak 200 ml toluollal készült oldatát 4 óra hosszat visszafolyató hűtő és vízelválasztófeltét alkalmazásával forraljuk. A reakcióelegyet lehűtjük, vízzel mossuk, nátrium-szulfáttal szárítjuk, vákuumban bepároljuk. A maradékot oszlopkromatográfiával tisztítjuk. 13,6 g (42%) 4-(4-klór-fenil-tio)-3,3-dimetil-1-(imidazol-1-il)-2-oximino-butánt kapunk. Op.: 125–126°C.

## 3. példa

## (3) képletű vegyület előállítása

## (b) eljárás

13,0 g (0,04 mól) 4-(4-klór-fenil-tio)-3,3-dimetil-1-(imidazol-1-il)-2-oximino-butánt 50 ml dimetil-formamidban oldunk, majd az oldathoz 4,5 g (0,04 mól) nátrium-terc-butilátot adunk. Az elegyet 50°C-ra melegítjük, majd ehhez 6,9 g (0,044 mól) jód-etánt adunk, ezután az elegyet 2 óra hosszat 50°C hőmérsékleten 2 óra hosszat kevertetjük. A reakcióelegyet lehűtjük, 600 ml vízzel elkeverjük, etil-acetáttal extraháljuk. Az etil-acetátos fázist vízzel háromszor mossuk, nátrium-szulfáttal szárítjuk, majd vákuumban 50°C hőmérsékletű vízfürdőn bepároljuk. A maradékot oszlopkromatográfiával tisztítjuk, 12,1 g (86,4%) 4-(4-klór-fenil-tio)-3,3-dimetil-2-(etil-oximid)-1-(imidazol-1-il)-butánt kapunk olajos termék formájában,  $n_D^{20}$ : 1,5699.

D Fentiek szerint eljárva állíthatjuk elő az alábbi táblázatban felsorolt (I) általános képletű vegyületeket.

Példa	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	A	Olvasáspont ill. törésmutató $n_D^{20}$
4.	-CH <sub>3</sub>	(1) képletű csoport	CH	1,5835
5.	-CH <sub>3</sub>	(1) „	CH	118–120 (xHCl)
6.	-CH <sub>3</sub>	(1) „	CH	158 (XCuCl <sub>2</sub> )
7.	n-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(1) „	CH	1,5665
8.	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(1) „	CH	1,5632
9.	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(1) „	CH	1,5567
10.	n-C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	(1) „	CH	1,5419
11.	H	(k) „	CH	1,5730 izo-

12.	H	(k) „	CH	1,522merek
13.	CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub>	(1) „	CH	1,5790
14.	HC=C-CH <sub>2</sub>	(1) „	CH	1,5849
15.	CH <sub>3</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub>	(1) „	CH	1,5722
16.	(m) képletű csoport	(1) „	CH	1,5997
17.	H	(a) „	CH	175–176 (x HCl)
18.	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(a) „	CH	1,5454
19.	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(a) „	CH	1,5431
20.	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(a) „	CH	1,5400
21.	-CH <sub>3</sub>	(1) „	N	1,5776
22.	szek-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(1) „	N	1,5523 (A alak X)
23.	szek-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(1) „	N	1,5496 (B alak X)
24.	n-C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	(1) „	N	1,5334
25.	(k) képletű csoport	(1) „	N	1,5673
26.	(o) „	(1) „	N	1,5961
27.	(m) „	(1) „	N	1,5850
28.	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(a) „	N	1,5170
29.	(m) képletű csoport	(a) „	N	165–170 (x HCl)
30.	(p) képletű csoport	(a) „	N	114 (x HCl)
31.	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(u) „	N	42
32.	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(u) „	N	66
33.	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(b) „ csoport	N	1,5158
34.	(m) képletű csoport	(u) „	N	1,5779
35.	(m) „	fenil-	N	1,5610
36.	szek-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(1) képletű csoport	N	1,5496
37.	H	(s) „	N	168–190 <sup>0</sup> (x HCl)
38.	H	(s) „	CH	98–100 <sup>0</sup> C
38.	H	(t) „	N	93–95 <sup>0</sup> C
40.	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(s) „	N	$n_D^{25}$ 1,5363
41.	-CH <sub>3</sub>	(u) „	CH	nyúlos olaj
42.	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(u) „	N	1,5205
43.	CH <sub>3</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub>	(u) „	N	1,5205
44.	CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub>	(b) „	N	1,5379
45.	CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub>	(b) „	N	1,5325
46.	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(b) „	N	1,5353
47.	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(u) „	N	1,5329
48.	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(b) „	N	1,5264
49.	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(t) „	N	1,5262
50.	H	(c) „	N	208 (x HCl)
51.	CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub>	(u) „	N	$n_D^{20}$ 1,5352
52.	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(c) „	N	$n_D^{20,8}$ 1,5208
53.	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(c) „	N	$n_D^{20,7}$ 1,5278
54.	H	(u) „	CH	153

55.	HC=C-CH <sub>2</sub> -	(u) „	CH	1,5574
56.	CH <sub>3</sub> -CH=CH-	(u) „	CH	1,5493
	-CH <sub>2</sub> -			
57.	H	(u) „	N	135-138
58.	HC=C-CH <sub>2</sub> -	(u) „	N	1,5511
59.	CH <sub>2</sub> -CH-CH <sub>2</sub> -	(u) „	N	1,5431
60.	H	(v) „	CH	145
61.	-CH <sub>3</sub>	(v) „	CH	1,5365
62.	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	(a) „	CH	n <sub>D</sub> <sup>20</sup> = 1,5270

x : geometriai izomerek

#### Hatásvizsgálatok

A hatásvizsgálatokhoz összehasonlítóanyagként az (A), (B), (C), (D), (E) és (F) képletű ismert vegyületeket alkalmazunk.

#### A példa

Erysiphe vizsgálat (árpa/védőhatás)

Oldószer: 100 tömegrész dimetil-formamid

Emulgeátor: 0,25 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

1 tömegrész hatóanyagot fent megadott mennyiségű oldószerrel és emulgeátorral elegyítünk, majd a kapott koncentrátumot vízzel az A táblázatban feltüntetett mértékben meghígítjuk.

Fiatál palántákat fenti készítménnyel harmanedvesre bepermetezünk, a permetlé leszáradása után a növényeket Erysiphe spórákkal befűjük.

A növényeket 20°C hőmérsékletű növényházban mintegy 80% nedvességtartalom mellett tároljuk, majd értékeljük a lisztharmattal való fertőzés mértékét.

7 nappal a fertőzés után értékeljük az eredményt.

A 8., 9., 11., 12., 16., 17., 22., 23., 24., 25., 27., 28., és 30. előállítási példák szerinti vegyületeket tartalmazó készítmények lényegesen jobb hatást mutatnak, mint a technika állásából ismert vegyületek.

A számszerű eredményeket az A táblázat foglalja össze.

A táblázat		
Erysiphe-vizsgálat (árpa) védőhatás		
Hatóanyag	Hatóanyag-koncentráció %-ban a permetlében tömeg%	Fertőzés %-ban a kezeltlen kontrollhoz viszonyítva
(A) képletű ismert vegyület	0,025	75,0
27. példa szerinti vegyület	0,025	3,8
22. példa szerinti vegyület	0,025	17,5
23. példa szerinti vegyület B alak	0,025	17,5
26. példa szerinti vegyület	0,025	0,0
25. példa szerinti vegyület	0,025	0,0
24. példa szerinti vegyület	0,025	0,0

28. példa szerinti vegyület	0,025	20,0
30. példa szerinti vegyület	0,025	16,3
16. példa szerinti vegyület	0,025	8,8
11. példa szerinti vegyület	0,025	0,0
A alak		
9. példa szerinti vegyület	0,025	0,0
8. példa szerinti vegyület	0,025	8,8
12. példa szerinti vegyület	0,025	8,8
17. példa szerinti vegyület	0,025	12,5

#### B. példa

Pyricularia vizsgálat (rizs)/védőhatás

Oldószer: 12,5 tömegrész acetone

Emulgeátor: 0,3 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

1 tömegrész hatóanyagot fent megadott mennyiségű oldószerrel és emulgeátorral elegyítünk, majd az így kapott koncentrátumot vízzel meghígítjuk.

Fiatál rizspalántákat a fenti készítménnyel harmanedvesre bepermetezünk, a permetlé leszáradása után a növényeket Pyricularia oryzae vizes spóraszuszpenziójával fertőzzük. Ezt követően a palántákat 100% relatív nedvességtartalmú, 25°C hőmérsékletű növényházba helyezzük el.

4 nappal a fertőzés követően értékeljük a növények fertőzöttségét.

A 7. és 23. előállítási példák szerinti vegyületek hatása kedvezőbb, mint a technika állásából ismert vegyületeké.

A vizsgálati eredményeket a B táblázat foglalja össze.

B táblázat		
Pyricularia-vizsgálat (rizs)/védőhatás		
Hatóanyag	Hatóanyag-koncentráció (%)	Fertőzés %-ban a kezeltlen kontrollhoz viszonyítva
(B) képlet ismert vegyület	0,025	100
(C) képletű ismert vegyület	0,025	100
(D) képletű ismert vegyület	0,025	100
(E) képletű ismert vegyület	0,025	50
23. példa szerinti vegyület	0,025	25
7. példa szerinti vegyület	0,025	0

#### C példa

Pellicularia vizsgálat (rizs)

Oldószer: 12,5 tömegrész acetone

Emulgeátor: 0,3 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

1 tömegrész hatóanyagot fent megadott mennyiségű oldószerrel és emulgeátorral elegyítünk, majd a koncentrátumot meghígítjuk.

Fiatal 3–4 levelű rizspalántákat harmatnedvesre bepermetezünk. A palántákat növényházban tartjuk, amíg meg nem száradnak. Ezután a palántákat 25°C hőmérsékleten 100% relatív nedvességtartalom mellett tároljuk.

A fertőzést követő 5–8. napon értékeljük az eredményt.

A 7. előállítási példa szerinti vegyület lényegesen jobb hatást mutat, mint a technika állásából ismert vegyületek. A vizsgálati eredményeket a C táblázat foglalja össze.

Hatóanyag	Hatóanyag-koncentráció (t%)	Fertőzés %-ban a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva
(B) képletű ismert vegyület	0,025	100
(C) képletű ismert vegyület	0,025	100
(D) képletű ismert vegyület	0,025	75
(E) képletű ismert vegyület	0,025	100
7. példa szerinti vegyület	0,025	0

#### D példa

Drechslera graminea-vizsgálat (árpa/vetőmagkezelés) (syn. Helminthosporium gramineum)

A vizsgálatot száraz pácolószerrel végezzük, a vizsgálatához alkalmazott hatóanyagot az 1. formálási példa szerint közvetlenül elkeverjük, finom porrá őröljük, a kapott készítményt a vetőmag felületén egyenletesen eloszlatjuk.

A fertőzött vetőmagot 3 percig a D táblázat szerinti mennyiségű pácolószerrel keverjük, a műveletet zárt üvegedényben végezzük.

Az így kezelt vetőmagot nedves rostált földbe ágyazzuk, a földet zárt Petri-csészében 10 napig hűtőszekrényben (4°C hőmérsékleten) tartjuk. Ez idő alatt az árpamag és az esetleges gombaspórák kicsíráznak. Az így előcsíráztatott árpamagokat 3 cm mélyen, földdel telt edényekbe helyezzük (2 x 50 szem) és 18°C hőmérsékleten tároljuk, a palánták napi 15 óra megvilágítást kapnak.

3 héttel a vetést követően értékeljük a gombával való fertőzöttség mértékét.

A 17. előállítási példában leírt vegyület kedvezőbb hatást mutat a technika állásából ismert vegyületeknél. A vizsgálati eredményeket a D táblázat tünteti fel.

Hatóanyag	Felhasznált hatóanyag mennyisége mg/kg vetőmagra	Beteg növények %-ban az összes kikelt növényhez viszonyítva
csávázatlan (B) képletű ismert vegyület	—	33,8
17. példa szerinti vegyület	500	26,5
15. példa szerinti vegyület	500	1,6

#### E példa

Gyapot növekedésének gátlása

Oldószer: 38 tömegrész dimetil-formamid

Emulgátor: 1 tömegrész poli(oxi-etilén)-szorbítán-monolaurát

1 tömegrész hatóanyagot fent megadott mennyiségű oldószerrel és emulgátorral elegyítünk, majd vízzel hígítjuk az E táblázat szerint.

A gyapot palántákat növényházban az 5. levél megjelenéséig neveljük. Ebben a stádiumban a növényeket a fenti készítménnyel harmatnedvesre bepermetezzük. 3 hét eltelte után a növények növekedését mérjük és a kontroll növényekhez viszonyítva, a növekedés gátlását %-ban adjuk meg. 100%-os növekedésgátlás a növény növekedésének leállítását jelöli, 0 % azt jelenti, hogy a vizsgálati növény növekedése a kontroll növényével azonos volt.

A 22., 25., 31., 32., és 33. előállítási példák szerinti vegyületekkel készült készítmények jobb hatást mutatnak, mint a technika állásából ismert vegyületeket tartalmazó készítmények. A vizsgálati eredményeket az E táblázat foglalja össze.

Hatóanyag	Koncentráció t%-ban	Növekedésgátlás %-ban
(C) képletű ismert vegyület	0,05	0
(B) képletű ismert vegyület	0,05	5
Kontroll	—	0
32. példa szerinti vegyület	0,05	70
31. példa szerinti vegyület	0,05	78
33. példa szerinti vegyület	0,05	52
25. példa szerinti vegyület	0,05	35
22. példa szerinti vegyület	0,05	75



**F példa**  
Szójabab növekedésének gátlása  
Oldószer: 30 tömegrész dimetil-formamid  
Emulgeátor: 1 tömegrész poli(oxi-etilén)-szorbitán-monolaurát

1 tömegrész hatóanyagot fent megadott mennyiségű oldószerrel és emulgeátorral elegyítünk, majd az elegyet vízzel meghígítjuk az F táblázat szerint.

Szójabab palántákat növényházban az első levél teljes kifejlődéséig nevelünk. Ebben a stádiumban a növényeket a fenti készítménnyel harmatnedvesre befűjük, 3 hét eltelté után értékeljük a kontroll növényekhez viszonyítva a kísérleti növények növekedését, az eredményt %-ban adjuk meg: 100% növekedés gátlás azt jelenti, hogy a növények növekedése teljes mértékben leállt, 0% a kontroll növényekkel azonos növekedést jelent.

A 22., 25., 28., 31. és 32. előállítási példák szerinti vegyületek lényegesen erősebb növekedésgátlást mutatnak, mint a technika állásából ismert vegyületeket tartalmazó készítmények. A számszerű eredményeket az F táblázat foglalja össze.

Hatóanyag	Koncentráció t%-ban	Növekedés- gátlás %-ban 0
Kontroll		
32. példa szerinti vegyület	0,05	91*ü
31. példa szerinti vegyület	0,05	96 *
28. példa szerinti vegyület	0,1 0,025	44 * 27 *
25. példa szerinti vegyület	0,05	30
22. példa szerinti vegyület	0,05	75 *

\* sötétzöld levélszín

**G példa**  
Cukorrépa növekedésének befolyásolása  
Oldószer: 30 tömegrész dimetil-formamid  
Emulgeátor: 1 tömegrész poli(oxi-etilén)-szorbitán-monolaurát

1 tömegrész hatóanyagot fent megadott mennyiségű oldószerrel és emulgeátorral elegyítünk, majd vízzel meghígítjuk a G táblázat szerint.

Cukorrépa palántát növényházban a csíralevél kifejlődéséig nevelünk, ebben a stádiumban a növényeket fenti permetlével befűjük. 14 nap eltelté után mérjük a növények növekedését és értékeljük a kontroll növényekhez viszonyítva a növekedés mértékét. 0% azt jelenti, hogy a kontroll növényekhez képest a növekedésben eltérés nem volt, negatív értékek a növekedés gátlására, pozitív értékek a növekedés elősegítésére utalnak.

A 22., 23., 24., 25. és 31. és 32. előállítási példák szerinti hatóanyagot tartalmazó készítmények erősebb mértékben befolyásolják a növekedést, mint a technika állásából ismert vegyületek. A számszerű eredményeket a G táblázat foglalja össze.

Hatóanyag	Koncentráció t%	Növekedés befolyásolása %-ban
(F) képletű ismert vegyület	0,05	0 *
Kontroll	0,05	-100 *)**)
31. példa szerinti vegyület	0,05	-100 *)**)
24. példa szerinti vegyület	0,05	- 80 **)
25. példa szerinti vegyület	0,05	- 60 *)**)
23. példa szerinti vegyület	0,05	-100 *)**)
22. példa szerinti vegyület	0,05	- 90
A alak		

\*) = sötétszínű levélszín  
) = vastag levelek

**H példa**  
Szén-dioxid-megkötés stimulálása szójababnál  
Oldószer: 30 tömegrész dimetil-formamid  
Emulgeátor: 1 tömegrész poli(oxi-etilén)-szorbitán-monolaurát

1 tömegrész hatóanyagot fent megadott mennyiségű oldószerrel és emulgeátorral elegyítünk, majd a koncentrátumot vízzel meghígítjuk a H táblázat szerint.

Szójabab palántákat nevelünk az első levél megjelenéséig, ebben a stádiumban a palántákat fenti készítménnyel harmatnedvesre bepermetezzük. Ezt követően a növények szén-dioxid megkötését ismert módon ellenőrizzük. A kapott eredményeket a hatóanyaggal nem kezelt kontroll-növényekkel ellenőrizzük.

A vizsgálatok eredményét a H táblázat foglalja össze: az eredményt az alábbi jelzésekkel értékeljük:

- : a szén-dioxid-megkötés gátlása,  
0 : a szén-dioxid-megkötés a kontrollnövényeknél mért értékkel azonos,  
+ : a szén-dioxid-megkötés kismértékű stimulálása,  
++ : a szén-dioxid-megkötés nagymértékű stimulálása,  
+++ : a szén-dioxid-megkötés igen nagymértékű stimulálása.

A 28. előállítási példa szerinti vegyület jó eredményt mutatott a kontroll vegyületek hatásához viszonyítva.

Hatóanyag	Koncentráció t%-ban	Hatás
Kontroll		0
28. példa szerinti vegyület	0,1 0,05 0,025	+ + +

## Formálási példák

## 1. Porozószer előállítása

5 g 25. előállítási példa szerinti hatóanyagot 95 g természetes kőzetliszttel elegyítünk, majd az elegyet porfinomságúra őröljük. Az így kapott készítményt a növényekre, illetőleg ezek életterére permetezzük.

## 2. Permetezőszer (diszpergálható por)

## a) Folyékony hatóanyagból készült készítmény

A 22. előállítási példa szerinti hatóanyagból 25 tömegrész veszünk, ezt 1 tömegrész dibutil-naftalinszulfonáttal, 4 tömegrész ligninszulfonáttal, 8 tömegrész nagydiszperzitású kovasavval, továbbá 62 tömegrész természetes kőzetliszttel elkeverjük, és finom porrá őröljük. Alkalmazás előtt a port vízzel kívánt mértékben hígítjuk.

## b) Szilárd hatóanyagból készült készítmény

50 tömegrész 30. előállítási példa szerinti vegyületet 1 tömegrész dibutil-naftalinszulfonáttal, 4 tömegrész ligninszulfonáttal, 8 tömegrész finomra porított kovasavval, továbbá 37 tömegrész természetes kőzetliszttel elegyítünk, és az elegyet finom porrá őröljük. Felhasználás előtt a port vízzel kívánt mértékben meghígítjuk.

## 3. Emulgeálható koncentrátum

25 tömegrész 23. előállítási példa szerinti vegyületet 55 tömegrész xilol és 10 tömegrész ciklohexanon elegyében feloldjuk. Emulátorként ezt követően 10 tömegrész dodecil-benzolszulfonsavkalciumsó és nonil-fenil-poliglikol-éter elegyét adjuk hozzá. Felhasználás előtt az emulziókoncentrátumot vízzel kívánt mértékben meghígítjuk.

## 4. Granulátum

## a) Folyékony hatóanyagból készült készítmény

1 tömegrész 12. előállítási példa szerinti hatóanyagot 9 tömegrész granulált, abszorpcióra képes agyagra permetezzük. A kapott granulátumot a növényekre, illetőleg ezek életterére szórjuk.

## b) Szilárd hatóanyagból készült készítmény

91 tömegrész 0,5–1,0 szemcseméretű homokot 2 tömegrész orsóolajjal, majd 7 tömegrész finomra őrölt hatóanyag-eleggyel elkeverünk. A hatóanyag-elegy 75 tömegrész 31. előállítási példa szerinti vegyületet és 25 tömegrész természetes kőzetliszttel tartalmaz. Az elegyet összekeverjük és mindaddig porítjuk, amíg egyenletes, könnyen gördülő nem porzó granulátumot nem kapunk. A kapott készítményt a növényekre, illetőleg ezek életterére szórjuk.

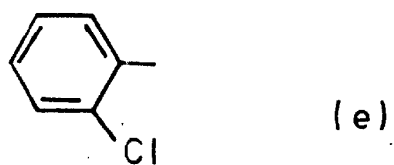
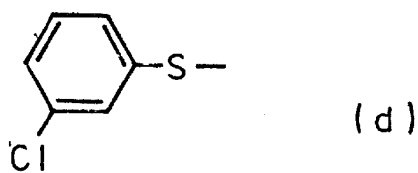
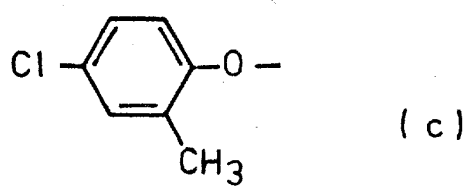
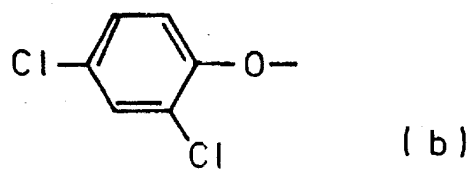
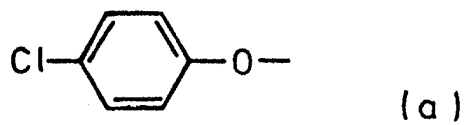
## SZABADALMI IGÉNYPONTOK

- 5 1. Fungicid és növénynövekedést befolyásoló kompozíciók, amelyekben szilárd hígítóanyagként előnyösen természetes kőzetliszt vagy nagydiszperzitású kovasav, folyékony hígítószerként előnyösen xilol és ciklohexanon, továbbá adott esetben felületaktív anyagként előnyösen dodecil-benzolszulfonsav-kalciumsó és nonil-fenil-poliglikol-éter van, azzal j e l l e m e z v e, hogy a készítmény hatóanyagként 0,5–60 tömeg%-ban legalább egy (I) általános képletű 1-azolil-2-oximino-bután-származékot, – adott esetben savaddíciós, előnyösen sósavas sója formájában – tartalmaz – a képletben
- 10 A<sup>1</sup> jelentése hidrogénatom vagy CH-csoport, R<sup>1</sup> jelentése hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkil-, 5-7 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy a fenilgyűrűn két klóratommal vagy egy 1,4 szénatomos alkoxycsoporttal szubsztituált benzilcsoport,
- 15 R<sup>2</sup> jelentése klóratommal monoszubsztituált fenil-, fenoxi-, fenil-tio-csoport,
- 20 2. Eljárás az (I) általános képletű 1-azolil-2-oximino-bután-származékok, savaddíciós, előnyösen sósavval képzett sóik, valamint réz(II)-kloriddal képzett sósavval képzett sóik, valamint réz(II)-kloriddal képzett komplexeik előállítására – a képletben
- 25 A jelentése nitrogénatom vagy CH-csoport, R<sup>1</sup> jelentése hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkil-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos alkinilcsoport, ciklopentil-, ciklohexil-, vagy a fenilgyűrűn két klóratommal vagy egy 1,4 szénatomos alkoxycsoporttal szubsztituált benzilcsoport,
- 30 R<sup>2</sup> jelentése halogénatommal egyszeresen szubsztituált fenil-tio-csoport, vagy adott esetben halogénatommal egyszeresen szubsztituált fenilcsoport vagy halogénatommal legfeljebb kétszeresen vagy halogénatommal és 1,4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált fenoxycsoport – azzal j e l l e m e z v e, hogy
- 35 a) (II) általános képletű azolil-ketont, a képletben A és R<sup>2</sup> jelentése a fenti, (III) általános képletű szubsztituált hidroxil-aminnal – a képletben R<sup>1</sup> jelentése a fenti – adott esetben hígítószer jelenlétében reagáltatunk, vagy
- 40 b) (Ia) általános képletű azolil-2-oximino-bután-származékot – a képletben A és R<sup>2</sup> jelentése a fenti – (IV) általános képletű halogeniddal – a képletben R<sup>1</sup> jelentése a fenti és Hal jelentése klór- vagy brómatom – adott esetben erős bázis és hígítószer jelenlétében reagáltatunk, majd a kapott (I) általános képletű vegyületet kívánt esetben savaddíciós sóvá, előnyösen sósavas sóvá vagy réz-klorid-komplexszé alakítjuk.
- 45
- 50

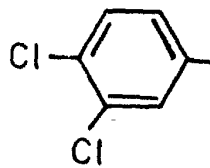
12 db rajz

Kiadja: Országos Találmányi Hivatal  
Felelős kiadó: Himer Zoltán o.v.

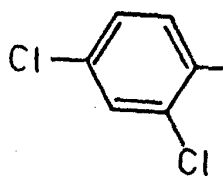
KÓDEX



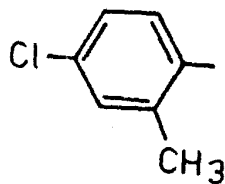
189.687  
Nemzetközi osztályjelzet: A 01 N 43/50  
A 01 N 43/653, C 07 D 233/61, C 07 D 249/08



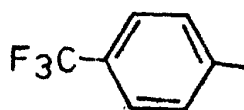
(f)



(g)



(h)



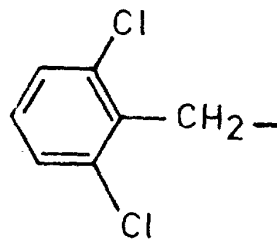
(i)



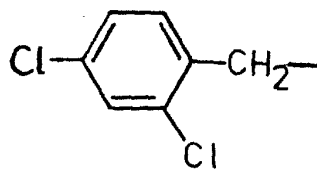
(k)



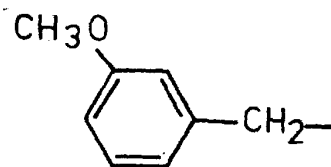
(l)



(m)

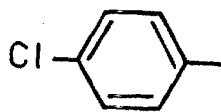


(o)

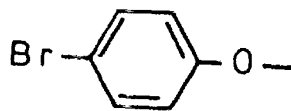


(p)

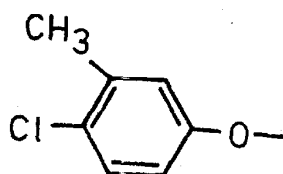
189.687  
Nemzetközi osztályjelzet: A 01 N 43/50  
A 01 N 43/653, C 07 D 233/61, C 07 D 249/08



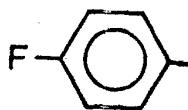
(u)



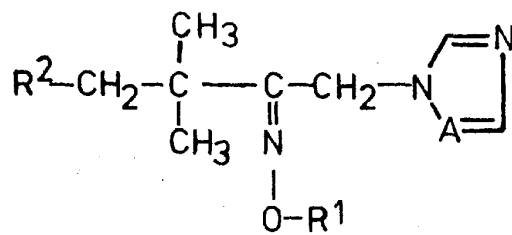
(s)



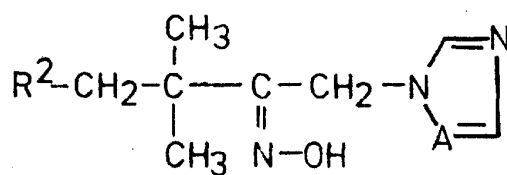
(t)



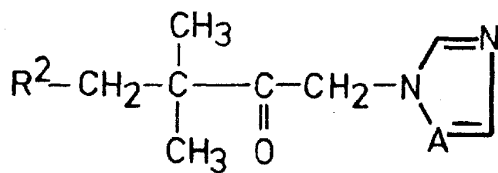
(v)



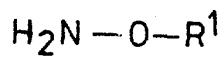
(I)



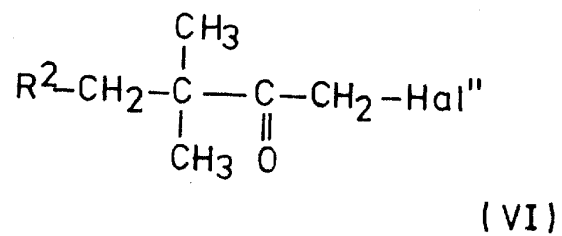
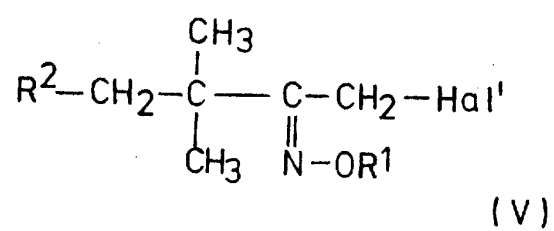
(I a)



(II)

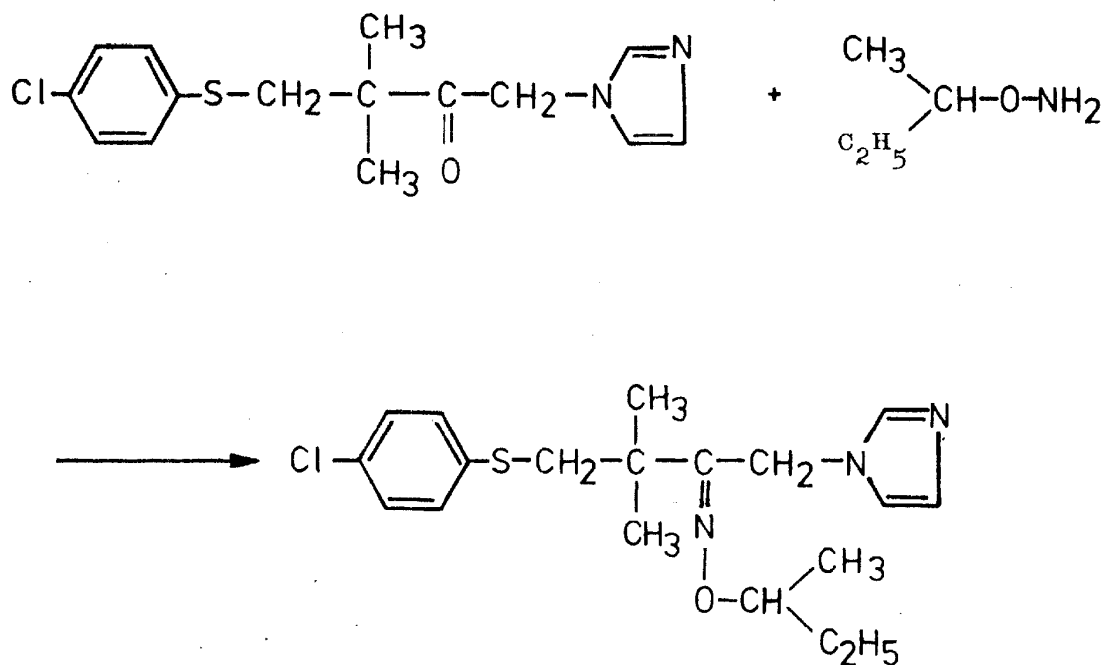


(III)

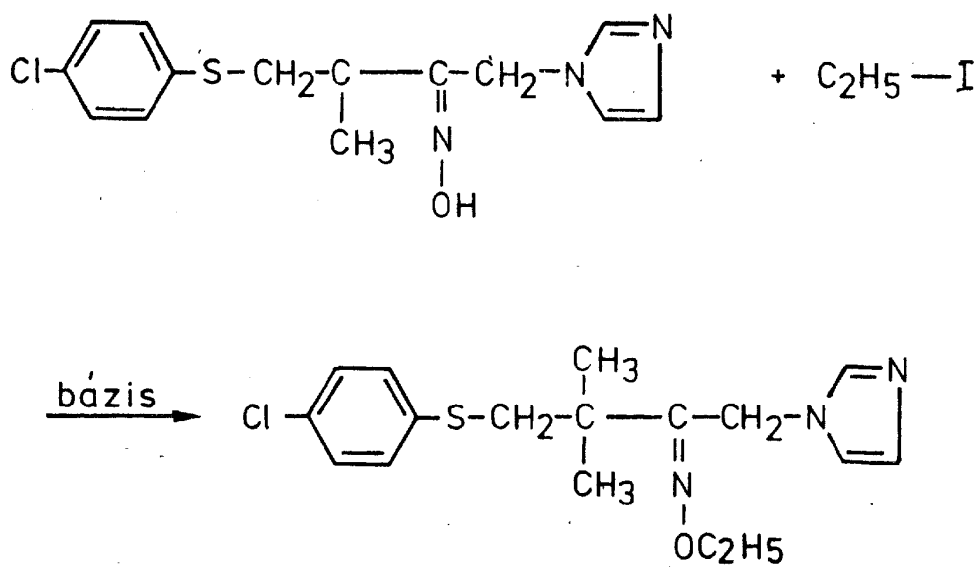




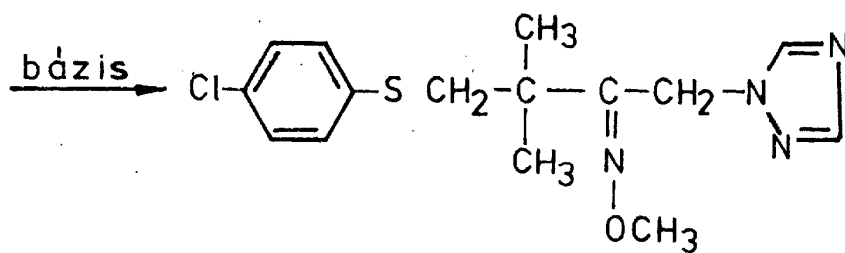
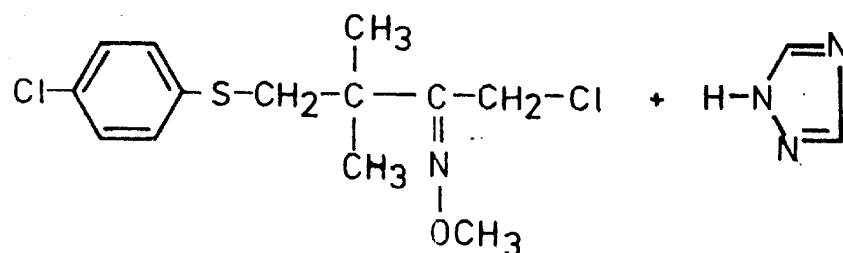
A reakcióvázlat

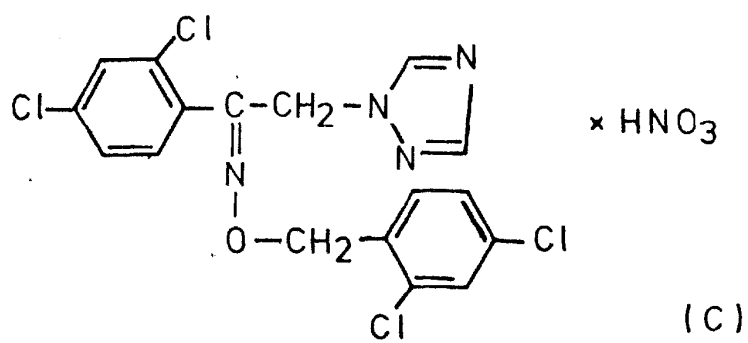
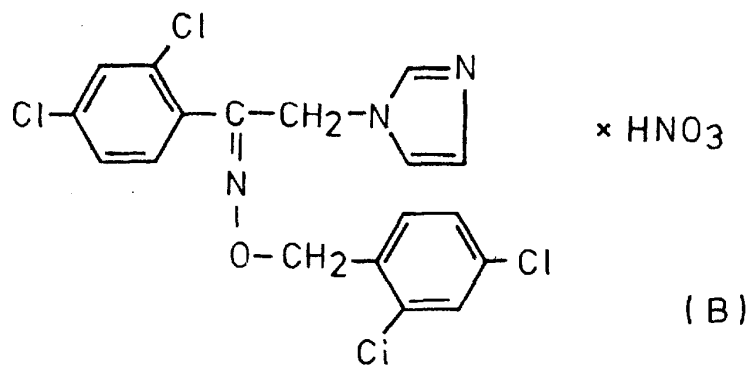
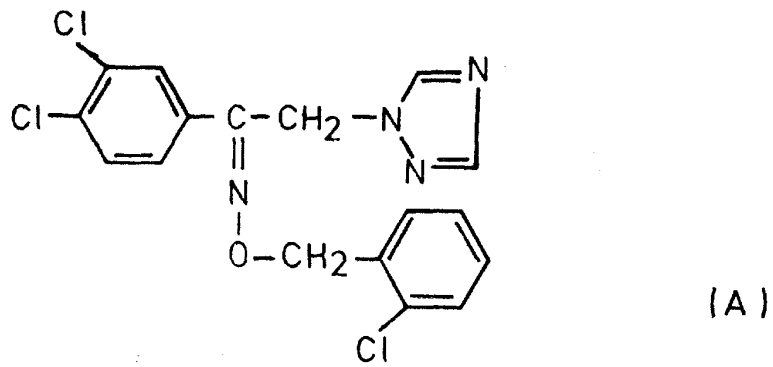


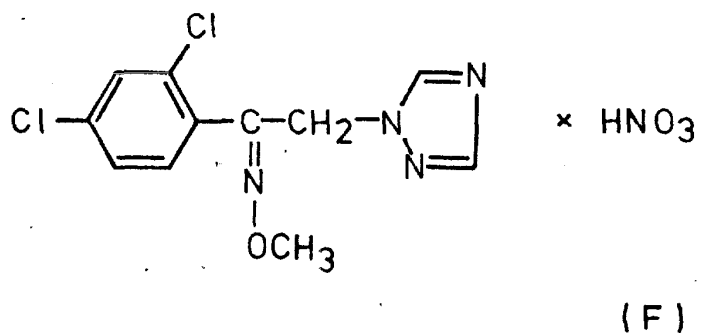
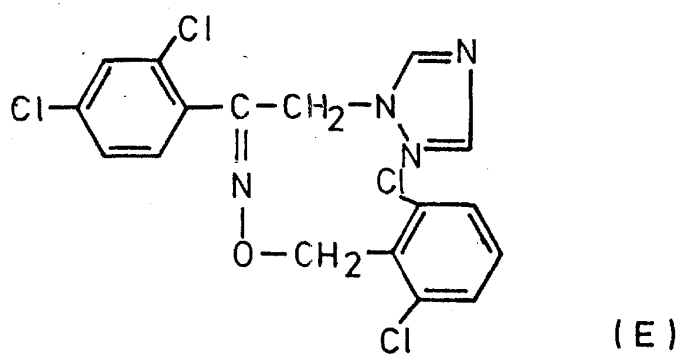
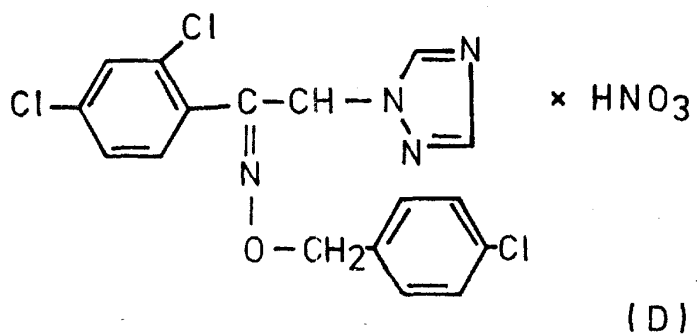
B reakcióvázlat

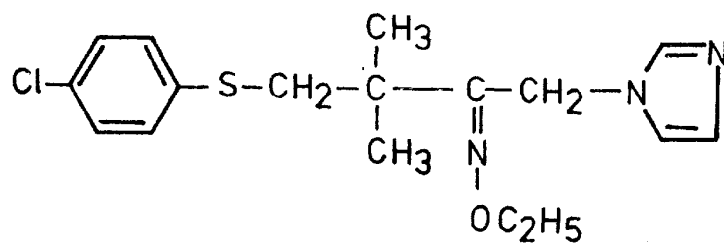
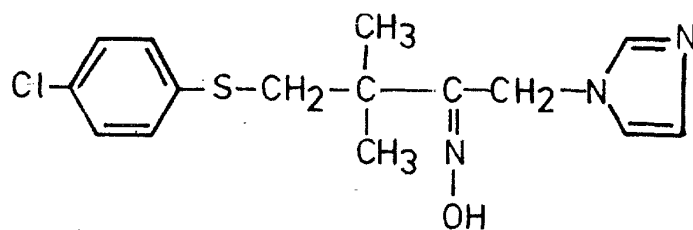
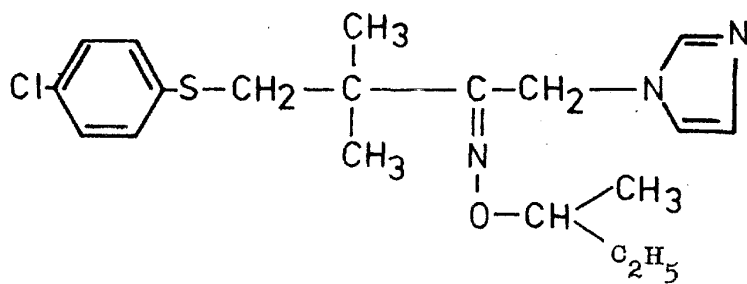


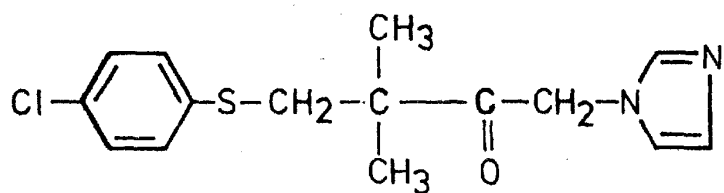
C reakcióvázlat



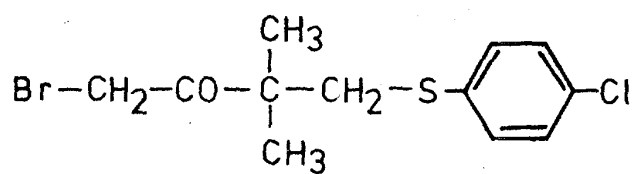




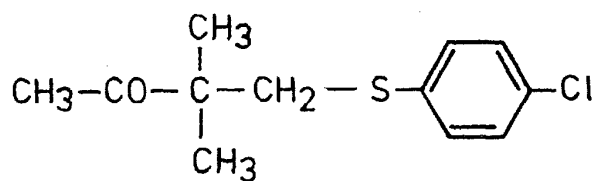




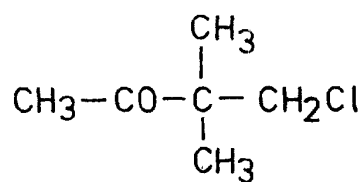
(91)



(92)



(93)



(94)