

FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

POPIS VYNÁLEZU

K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

269 383

(11)

(13) B1

(51) Int. Cl.⁴
A 01 N 43/16
C 07 D 311/18

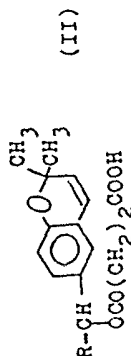
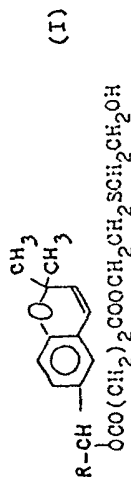
(21) PV 4756-88.N
(22) Přihlášeno 01 07 88

(40) Zveřejněno 12 09 89
(45) Vydáno 16 01 91

(75) Autor vynálezu KAHOVCOVÁ JITKA ing. CSc., PRAHA

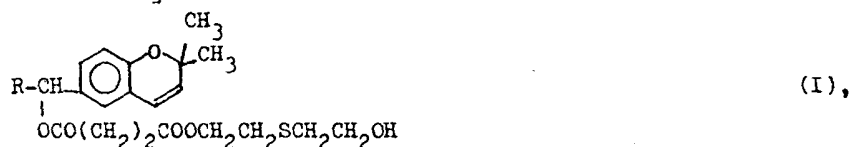
(54) 2-/2-hydroxyethylthio/ethylester kyseliny 1-[2,2-dimethyl-6-/2H-benzopyranyl/]-1-alkyloxykarbonylpropanové jako biologicky účinná látka a způsob její přípravy

(57) Předmětem řešení jsou nové biologicky účinné látky obecného vzorce I, kde symbol R značí alkylskupinu s maximálně 3 atomy uhlíku. Jejich pesticidní účinky byly vyzkoušeny například na termitech. Další částí řešení je způsob přípravy látky obecného vzorce I, spočívající v reakci organické kyseliny obecného vzorce II, kde symbol R má výše uvedený význam, s 2-(2-hydroxyethylthio)-ethanolem za přítomnosti ekvimolárního množství dicyklohexylkarbodiimidu a katalytického množství N,N-dimethylamino-pyridinu při teplotě 10 až 20 °C.



Vynález se týká 2-(2-hydroxyethylthio)ethylesteru kyseliny 1-[2,2-dimethyl-6-(2H-benzopyranyl)]-1-alkyloxykarbonylpropanové jako biologicky účinné látky a způsobu její přípravy.

Podstatou vynálezu je 2-(2-hydroxyethylthio)ethylester kyseliny 1-[2,2-dimethyl-6-(2H-benzopyranyl)]-1-alkyloxykarbonylpropanové obecného vzorce I



kde R značí alkylskupinu s maximálně 3 atomy uhlíku.

Biologické účinky (například pesticidní) byly zkoušeny například na termitech, škůdcích na dřevě, kde se dosud používal ekologicky nevhodný pentachlorfenol.

Způsob přípravy 2-(2-hydroxyethylthio)ethylesteru kyseliny 1-[2,2-dimethyl-6-(2H-benzopyranyl)]-1-alkyloxykarbonylpropanové obecného vzorce I se vyznačuje tím, že se nechá reagovat organická kyselina obecného vzorce II



kde R má výše uvedený význam, s 2-(2-hydroxyethylthio)ethanolem za přítomnosti ekvimolárního množství dicyklohexylkarbodiimidu a katalytického množství N,N-dimethylaminopyridinu při teplotě 10 až 20 °C, za vzniku produktu obecného vzorce I.

Vynález je blíže objasněn na příkladu provedení, aniž se na tento příklad výlučně omezuje.

Příklad

0,13 g (1,1 mmol) 2-(2-Hydroxyethylthio)ethanolu, 0,33 g (1 mmol) 3-{1-[2,2-dimethyl-6-(2H-benzopyranyl)]-1-propyloxykarbonyl propanové kyseliny, 0,2 g (1 mmol) dicyklohexylkarbodiimidu a 0,01 g (0,1 mmol) N,N-dimethylaminopyridinu bylo při teplotě 15 až 20 °C v 10 ml bezvodého diethyléru mícháno po dobu 2 hodin. Po zředění diethylérem, filtraci a promytí 5%ním roztokem kyseliny chlorovodíkové a vodou byla oddělená éterická vrstva vysušena nad bezvodým síranem sodným, odpařena a dělena na sloupci silikagelu s 8 % hmot. vody /eluční činidlo petroléter obsahující až 20 % obj. diethyléru/. Spojením chromatograficky jednotných frakcí bylo po odpaření rozpouštědel získáno 0,19 g /45 %/ 2-(2-hydroxyethylthio)-ethylesteru kyseliny 1-[2,2-dimethyl-6-(2H-benzopyranyl)]-1-propyloxykarbonylpropanové.

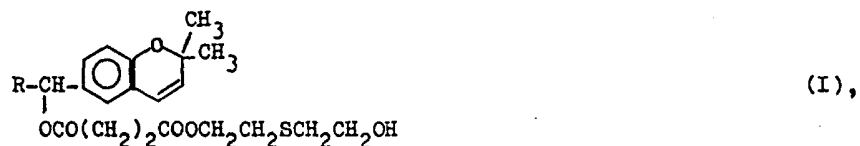
MS spektrum: 422/M⁺, C₂₂H₃₀O₆S/, 407/C₂₁H₂₇O₆S/, 303/C₁₈H₂₃O₄/, 201/C₁₄H₁₇O/, 185/C₁₃H₁₃O/, 171/C₁₂H₁₁O/, 105/C₄H₉OS/

¹H-NMR spektrum: 0.80/t, CH₃CH₂, J=7.0/, 1.35//CH₃/₂C, s/, 2.1 - 2.65/M, CH₂COO+CH₂CHOCO/, 2.65/t, J=7.0, CH₂S/, 3.68/t, J=6.0, CH₂OH/, 6.56 - 7.17/m, arom.H/.

Biologické účinky byly zkoušeny například u termitu *Prorhinotermes simplex* /0,2 % váh. v acetonu/: 13. den 0/0, 15. den 0/0, 17. den 0/0, 19. den 0/0, kde v čitateli je uvedeno % bílých vojáků a ve jmenovateli % interkast. Zpomalení přirozeného vývoje vede ve svých důsledcích k zániku celých kolonií.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. 2-(2-Hydroxyethylthio)ethylester kyseliny 1-[2,2-dimethyl-6-(2H-benzopyrany)]-1-alkyloxykarbonylpropanové obecného vzorce I



kde R značí alkylskupinu s maximálně 3 atomy uhlíku, jako biologicky účinná látka.

2. Způsob přípravy 2-(2-hydroxyethylthio)ethylesteru kyseliny 1-[2,2-dimethyl-6-(2H-benzopyrany)]-1-alkyloxykarbonylpropanové obecného vzorce I, vyznačující se tím, že se nechá reagovat organická kyselina obecného vzorce II



kde R má výše uvedený význam, s 2-(2-hydroxyethylthio)ethanolem za přítomnosti ekvimolárního množství dicyklohexylkarbodiimidu a katalytického množství N,N-dimethylaminopyridinu při teplotě 10 až 20 °C.