



401m 9/38

POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 42513

Kl. 45 ~~1, 3701~~

451 9/38

Polska Akademia Nauk*)
(Zakład Syntezy Organicznej)
Warszawa, Polska

Środek grzybobójczy i bakterlobójczy

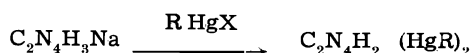
Patent trwa od dnia 28 stycznia 1959 r.

Związki rtęcioorganiczne, zawierające wiązania $\text{N} - \text{Hg} -$ charakteryzują się wysoką aktywnością biologiczną. Liczne z nich znalazły zastosowanie jako diuretyki oraz środki grzybobójcze.

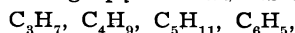
Dó środków grzybobójczych tego typu należą np. Ceresan/M (N-etylortęcio-p-tolilosulfanilid), Leytosan (fenylortęciomocznik) i Panogen (metylortęciocyjanoguanidyna). Najaktywniejszym z nich jest Panogen o wzorze sumarycznym $\text{C}_2\text{N}_4\text{H}_8 - \text{HgCH}_3$.

Stwierdzono, że z reakcji między solami alkilo- lub aryloortęciowymi kwasów mineralnych i organicznych z solą sodową cyjanoguanidyny

powstają dwualkilortęciowe (dwuaryloortęciowe) pochodne cyjanoguanidyny. Reakcja przebiega następująco:



gdzie R oznacza grupę alkilową lub aryłową np.



a X jest resztą kwasu mineralnego lub organicznego.

Według wynalazku jako produkt wyjściowy w tej reakcji stosuje się monosodową sól cyjanoguanidyny.

Dwualkilo- (lub dwuarylo) rtęciowo pochodne cyjanoguanidyny stanowią grupę fungicydów o silnych właściwościach grzybobójczych.

Sól sodową cyjanoguanidyny przyrządza się działaniem cyjanoguanidyny na etanolan sodowy w temperaturze około 50°C.

*) Właściciel patentu oświadczył, że współtwórcami wynalazku są Bogumił Hetnarski, Zygmunt Eckstein i Tadeusz Urbański.

Wytworzoną zawiesinę soli sodowej cyjanoguanidyny zadaje się następnie solą alkilortęciową i miesza w temperaturze około 50°C w czasie od pół do trzech godzin. Po oddzieleniu osadu z mieszaniny poreakcyjnej, przesącz rozcieńcza się wodą i chłodzi. Wykryształizowany przy tym osad sący się i suszy.

Pochodne arylortęciowe przyrządza się działaniem soli arylortęciowej na zwiesinę soli sodo-

wej cyjanoguanidyny w alkoholu, miesza się przez jedną do trzech godzin w temperaturze około 50°C, następnie osad sący się, przemycwa wodą i suszy.

Otrzymane produkty wykazują wysoką aktywność grzybobójczą, co przedstawia poniższa tabela:

Nr	Związek	Stężenie substancji badanej, całkowicie hamujące wzrost grzybów wyrażone w % wagowych w stosunku do objętości pożywki agarowej.		
		Szczep	Alternaria tenuis	Rhisoctonia solani
		Fusarium culmorum		
1.	$(C_3H_7Hg)_2C_2N_4H_2$	0,00005	0,000005	0,000005
2.	$(C_4H_9Hg)_2C_2N_4H_2$	0,00005	0,00005	0,00001
3.	$(C_8H_{11}Hg)_2C_2N_4H_2$	0,00001	0,00005	0,000005
4.	$(C_6H_5Hg)_2C_2N_4H_2$	0,0005	0,0005	0,0005
	F	0,0005	0,0005	0,0005
	C	0,0001	0,00005	0,00005

W celu porównania przytoczono czynność grzybobójczą substancji czynnej Ceresanu — M (C) oraz octanu fenylortęciowego (F), znanych fungicydów.

Poniższe przykłady ilustrują sposób otrzymywania omawianych związków według wynalazku:

Przykład I. Do zawiesiny 2,1 części wagowych cyjanoguanidyny w 35 częściach objętościowych bezwodnego etanolu dodano roztwór etanolanu sodowego, otrzymanego przez działanie 0,6 części wagowych sodu metalicznego na 15 części objętościowych bezwodnego etanolu w temperaturze 50°C, a następnie 5,2 części wagowych mieszaniny chlorku i bromku butylortęciowego. Zawartość naczynia reakcyjnego mieszano w ciągu 3 godzin w temperaturze 50°C, a następnie przesączono.

Do przesączu dodano 100 części objętościowych wody. Wydzielony przy tym osad odsączono, wysuszono i przemycło eterem etylowym.

Otrzymano 2,8 części wagowych białej, kryształicznej substancji o temperaturze topnienia 81—84°C (temperatura topnienia po dalszym oczyszczeniu wynosiła 84,5—85,5°C).

Przykład II. Do zawiesiny 1,1 części wagowych cyjanoguanidyny w 35 częściach obję-

tościowych bezwodnego etanolu dodano roztwór etanolanu sodowego, otrzymanego przez działanie 0,3 części wagowych sodu metalicznego na 15 części objętościowych bezwodnego etanolu i mieszało kilkanaście minut w temperaturze około 50°C. Następnie do mieszaniny reakcyjnej dodano 4,2 części wagowych octanu fenylortęciowego i mieszało dalej przez 1,5 godziny, utrzymując przy tym temperaturę 50°C.

Osad przesączono, przemycło wodą, etanolem i acetonem. Uzyskano 4 części wagowe preparatu, którego temperatura topnienia po oczyszczeniu wynosiła 181,5—182°C.

Zastrzeżenie patentowe

Środek grzybobójczy i bakterio-bójczy, znamienny tym, że zawiera produkty reakcji soli monosodowej cyjanoguanidyny z solami alkilo — lub arylortęciowymi o ogólnym wzorze $C_2N_4H_2(HgR)_2$, w którym R oznacza grupę alkilową lub arylową.

Polska Akademia Nauk

(Zakład Syntezy Organicznej)