

FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

POPIS VYNÁLEZU

K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

269 381

(11)

(13) B1

(51) Int. Cl.⁴

C 07 C 69/40
A 61 K 37/02

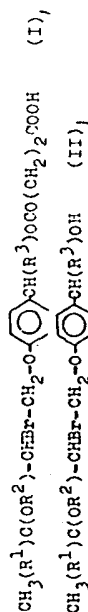
(21) PV 4754-88.J
(22) Přihlášeno 01 07 88

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

(75) Autor vynálezu KAHOVCOVÁ JITKA ing. CSc.,
MASOJÍDKOVÁ MILENA RNDr.,
FIEDLER PAVEL ing., PRAHA

(54) Poloester kyseliny jantarové s 4-(3-alkoxy-3-alkyl-2-brombutoxy)fenylalkanolem jako biologicky účinná látka a způsob jeho přípravy

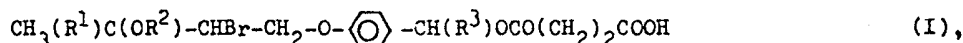
(57) Předmětem řešení je nová biologicky účinná látka obecného vzorce I, kde symbol R^1 značí methyl- nebo ethylskupinu, symboly R^2 a R^3 značí alkylskupinu s rovným nebo rozvětveným řetězcem s maximálně 3 atomy uhlíku. Jejich pesticidní účinky byly vyzkoušeny například na hmyzu. Další část řešení je způsob přípravy látek obecného vzorce I, spočívající v reakci 4-(3-alkoxy-3-alkyl-2-brombutoxy)fenylalkanolu obecného vzorce II, kde symboly R^1 , R^2 a R^3 mají význam uvedený výše, s ekvimolárním množstvím anhydridu kyseliny jantarové a bezvodého pyridinu při teplotě 60 až 70 °C.



Vynález se týká poloesteru kyseliny jantarové s 4-(3-alkoxy-3-alkyl-2-brombutoxy)fenylalkanolem jako biologicky účinné látky a způsobu jeho přípravy.

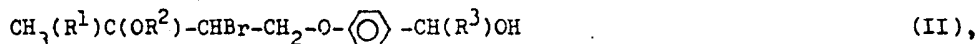
Látka, jež je předmětem vynálezu, je příkladem nového typu pesticidu s volnou karboxylovou skupinou. Dosud připravené fyziologicky účinné estery vždy po hydrolyze na sloučeniny s volnou karboxylovou skupinou biologickou aktivitu ztratily.

Podstatou vynálezu je poloester kyseliny jantarové s 4-(3-alkoxy-3-alkyl-2-brombutoxy)fenylalkanolem obecného vzorce I



kde R^1 značí methyl- nebo ethylskupinu, R^2 a R^3 značí alkylskupinu s maximálně 3 atomy uhlíku.

Způsob přípravy poloesteru kyseliny jantarové s 4-(3-alkoxy-3-alkyl-2-brombutoxy)fenylalkanolem obecného vzorce I se vyznačuje tím, že se nechá reagovat 4-(3-alkoxy-3-alkyl-2-brombutoxy)fenylalkanol obecného vzorce II



kde symboly R^1 , R^2 a R^3 mají výše uvedený význam, s ekvimolárním množstvím anhydridu kyseliny jantarové a bezvodého pyridinu při teplotě 60 až 70 °C, za vzniku poloesteru obecného vzorce I.

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

Příklad

Směs 0,33 g (0,001 mol) 1-[4-(3-methoxy-3-methyl-2-brombutoxy)fenyl]-1-propanolu, 0,1 g anhydridu kyseliny jantarové a 87 mg bezvodého pyridinu byla zahřívána 7 hodin na 60 °C a potom byla ponechána stát přes noc. Reakční směs byla dělena sloupcovou chromatografií na silikagelu s 8 % hmot. vody (eluční činidlo petroléter obsahující až 75 % obj. diethyléteru). Bylo získáno 0,23 g (63 %) produktu.

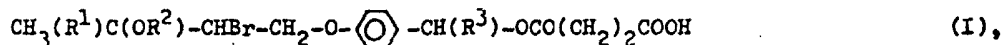
IČ spektrum (CCl_4 , 5 %): 3535, 2800-3300, 2600, 2680 (ν OH), 2830 (ν CH_3 v OCH_3), 1767, 1739, 1724, 1712 (ν C=O), 1614, 1588, 1519 (ν aromatika), 1383, 1371 (δ CH_3) cm^{-1} .

^{13}C -NMR spektrum: 200MHz: 9.91 (CH_3CH_2), 22.16 a 23.77 ($(\text{CH}_3)_2\text{CO}$), 29.16 (CH_2CH_2), 29.06 (CH_2COO), 28.90 (HOOCOCH_2), 49.92 (CHBr), 58.79 (OCH_3), 69.73 (OCH_2), 76.24 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 77.66 ($\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4$), 114.65 ($\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}$), 127.98 ($\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2$), 132.92 ($\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}$), 157.91 ($\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}-\text{O}$), 171.42 (COO), 177.71 (COOH).

Biologická účinnost byla zkoušena například na masařce *Sarcophaga bullata*, kdy se nakladená vajíčka téměř se 100% účinností nevyvíhla (látka I, $\text{R}^1 = \text{R}^2 = \text{CH}_3$, $\text{R}^3 = \text{C}_2\text{H}_5$), aplikovaná dávka $5 \cdot 10^{-3}$ mg v acetonu, dále potom na *Tenbrio molitor*, jehož morfogeneza byla potlačena již v koncentraci 10^{-2} mg.

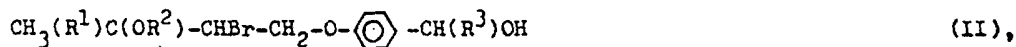
PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Poloester kyseliny jantarové s 4-(3-alkoxy-3-alkyl-2-brombutoxy)fenylalkanolem obecného vzorce I



kde R^1 značí methyl- nebo ethylskupinu, R^2 a R^3 značí alkylskupinu s rovným či rozvětveným řetězcem s maximálně 3 atomy uhlíku, jako biologicky účinná látka.

2. Způsob přípravy poloesteru kyseliny jantarové obecného vzorce I, kde R^1 , R^2 a R^3 mají shora uvedený význam, vyznačující se tím, že se nechá reagovat 4-(3-alkoxy-3-alkyl-2-brombutoxy)fenylalkanol obecného vzorce II



kde symboly R^1 , R^2 a R^3 mají význam uvedený výše, s ekvimolárním množstvím anhydridu kyseliny jantarové a bezvodého pyridinu při teplotě 60 až 70 °C.