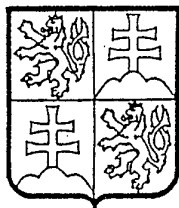


ČESKÁ A SLOVENSKÁ
FEDERATIVNÍ
REPUBLIKA

(19)



FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

PATENTOVÝ SPIS 275 955

(21) Číslo přihlášky : 5853-89.X

(22) Přihlášeno : 16 10 89

(30) Prioritní data :

(40) Zveřejněno : 15 01 92

(47) Uděleno : 22 01 92

(24) Oznámeno udělení ve Věstníku : 18 03 92

(13) Druh dokumentu : B 6

(51) Int. Cl.⁵ :

C 07-D 277/68//

A 01 N 43/78

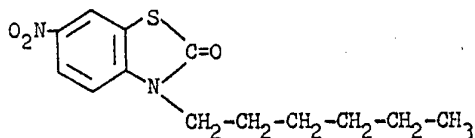
(73) Majitel patentu : UNIVERZITA KOMENSKÉHO, BRATISLAVA

(72) Původce vynálezu : SIDOŮVÁ EVA ing.CSc.,
KRÁĚOVÁ KATARÍNA RNDr.CSc.,
MITTERHAUSZEROVÁ LUDMILA ing.CSc., BRATISLAVA

(54) Název vynálezu : 3-n-Hexyl-6-nitro-2-benzotiazolinón

(57) Anotace :

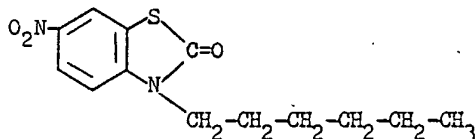
Bol pripravený doteraz neznámy 3-n-hexyl-6-nitro-2-benzotiazolinón uvedeného vzorca. Syntéza uvedenej zlúčeniny sa uskutočňuje reakciou draselnej soli 6-nitro-2-benzotiazolinónu s n-hexyljodidom v zmesi etanolu a vody za varu. Zlúčenina je účinná ako stimulátor rastu koreňov a stoniek kukurice a zároveň je účinná ako regulátor rastu a syntézy chlorofylu zelených rias.



Vynález sa týka 3-n-hexyl-6-nitro-2-benzotiazolinónu.

3-Substituované deriváty 6-nitro-2-benzotiazolinónu prejavili účinnosť ako regulátory rastu rastlín (D'Amico J.J. US pat. 4 282 029 /1981/, Sidóová, E., Blanáriková, V., Mitterhauszerová, Ľ. a Kráľová, K. CS 270 539) a ako herbicídy (D'Amico J.J. US pat. 4 185 990 /1980/).

Teraz sme zistili, že doteraz neznáma zlúčenina vzorca



stimuluje rast koreňov a stoniek u kukurice a zároveň reguluje rast a syntézu chlorofylu u zelených rias v závislosti na koncentrácii.

Súčasne bol zistený spôsob prípravy uvedenej zlúčeniny reakciou draselnej soli 6-nitro-2-benzotiazolinónu s n-hexyljodidom v zmesi etanolu a vody za varu.

Nasledujúce príklady bližšie osvetľujú, ale nijako neobmedzujú prípravu a vlastnosti zlúčeniny podľa vynálezu.

Príklad 1

Príprava 3-n-hexyl-6-nitro-2-benzotiazolinónu

6-Nitro-2-benzotiazolinón (5,9 g, 0,03 mol) bol rozpustený za varu v roztoku hydroxidu draselného (2,0 g, 0,03 mol) v zmesi vody (10 cm³) a etanolu (20 cm³). K roztoku sa pridal n-hexyljodid (6,35 g, 0,035 mol), reakčná zmes sa refluxovala 3 hodiny a potom sa odstavila cez noc pri 5 °C. Z roztoku sa vylúčil produkt s t.t. 61 až 66 °C v množstve 7,6 g (90,5 %).

Vzorka pre analýzu bola prekryštalizovaná zo zmesi etanolu a vody v pomere 4:1 za použitia aktívneho uhlia, čím sa získal čistý 3-n-hexyl-6-nitro-2-benzotiazolinón s t.t. 68 až 70 °C.

M.h. = 280,35

Pre C₁₃H₁₆N₂O₃S

vypočítané % : C 55,70 H 5,75 N 9,99 S 11,44

zistené % : 55,77 5,76 10,01 11,46

Príklad 2

Test fytotoxicity a stimulačnej účinnosti zlúčeniny podľa vynálezu

Tabuľka k príkladu 2

Vplyv zlúčeniny podľa vynálezu na prolongačný rast koreňov a stoniek kukurice (*Zea mays* L.) po 72 hodinovej inkubácii v tme, vyjadrený v percentách kontrolnej vzorky

Koncentrácia mol.dm ⁻³	% kontrolnej vzorky dĺžka koreňa	± I.S. 0,05 dĺžka stonky
1.10 ⁻⁴	91,1 ± 1,3	85,1 ± 3,1
1.10 ⁻⁵	107,2 ± 1,5	120,8 ± 6,6
1.10 ⁻⁶	112,2 ± 2,5	116,2 ± 4,2
1.10 ⁻⁷	113,2 ± 2,2	126,9 ± 3,2
1.10 ⁻⁸	120,6 ± 2,9	120,5 ± 3,7
1.10 ⁻⁹	114,0 ± 2,6	122,2 ± 1,7
1.10 ⁻¹⁰	116,7 ± 4,1	115,0 ± 4,3

Fytotoxicita zlúčeniny podľa vynálezu sa hodnotila meraním prolungačného rastu koreňa a stonky kukurice (*Zea mays* L.) (Murín, A., Koleková, A., Váchová, M. a Bagula, Š., *Biológia /Bratislava/* 35, 937 /1980/, Sekerka, V. a Sutoris, V., *Poľnohospodárstvo* 31, 832 /1985/).

Semená kukurice sa napučovali vo vodných roztokoch zlúčenín podľa vynálezu o koncentracii 1.10⁻⁴ až 1.10⁻¹⁰ mol.dm⁻³ 24 hodín, potom sa uložili na filtračný papier navlhčený príslušnými roztokmi testovaných koncentracii a predkličovali sa v tme po dobu 72 hodín pri izbovej teplote, pričom stočané válce filtračného papiera boli umiestnené v perforovaných polyetylénových sáčkoch (ČSN 46 0610). Po uplynutí tejto doby sa merala dĺžka koreňa a nadzemnej časti rastliny. Výsledky sa vyhodnocovali v percentách kontrolnej vzorky. Vzhľadom na nízku rozpustnosť zlúčeniny podľa vynálezu vo vode, sa testované koncentrácie pripravovali riedením vodou z jej roztoku v N,N-dimetylformamide o koncentracii 1.10⁻² mol.dm⁻³. Jednotlivé kontrolné vzorky k testovaným koncentraciam zlúčeniny podľa vynálezu obsahovali zodpovedajúce množstvo čistého rozpúšťadla.

Pri nízkych koncentraciách zlúčeniny podľa vynálezu, v koncentračnom rozmedzí 1.10⁻⁵ až 1.10⁻¹⁰ mol.dm⁻³, zlúčenina podľa vynálezu pôsobila stimulačne na rast koreňov a stoniek kukurice.

Príklad 3

Regulačná účinnosť zlúčeniny podľa vynálezu na rast a syntézu chlorofylu zelených rias

Tabuľka k príkladu 3

Regulačná účinnosť zlúčeniny podľa vynálezu na rast a syntézu chlorofylu rias *Chlorella vulgaris*

Koncentrácia mol.dm ⁻³	% Kontroly ±	
	Chlorofyl	Absorbancia
1.10 ⁻⁴	77,9 ± 0,8	71,3 ± 1,1
1.10 ⁻⁵	77,1 ± 8,8	84,5 ± 2,0
1.10 ⁻⁶	96,6 ± 14,7	100,2 ± 10,0
1.10 ⁻⁷	109,7 ± 15,2	101,9 ± 9,0
1.10 ⁻⁹	106,2 ± 10,3	98,0 ± 1,2

Riasy *Chlorella vulgaris* sa pestovali štácinárnou kultiváciou pri teplote 25 ± 1 °C pri svetelnom režime 16 hodín svetlo, 8 hodín tma v kultivačnom médiu podľa Šetlíka (Šetlík I.: Annual Report of Algolog. Lab. for 1967, 71-140, Třeboň, 1968). Testovaná látka sa pridávala do kultivačného média v roztoku N,N-dimetylformamidu (celkový obsah rozpúšťadla v kultivačnom médiu ≤ 1 %) a ten istý obsah rozpúšťadla sa pridával ku kontrolným vzorkám. Kultivačné banky sa inokulovali presným objemom homogénnej suspenzie rias. Po 7-dennej kultivácii sa objem kultivačného média doplnil destilovanou vodou na pôvodný objem (vyrovnanie odparu vody) a v suspenzii buniek sa merala absorbanca pri 660 nm (úmerná množstvu buniek rias) a obsah chlorofylu po jeho extrakcii N,N-dimetylformamidom z odcentrifugovaných buniek rias (Inskeep, W.P., Bloom, P.R.: Plant Physiol. 77 /2/, 483-5, 1958). Získané hodnoty týchto parametrov sa porovnávali s hodnotami parametrov súčasne kultivovaných kontrolných vzoriek a vyhodnocovali sa percentom hodnoty.

Zlúčenina podľa vynálezu inhibuje rast rias a syntézu chlorofylu zelených rias pri koncentráciách 1.10^{-7} mol.dm⁻³ až 1.10^{-9} mol.dm⁻³.

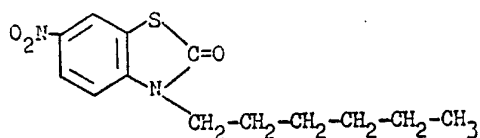
Významný je fakt, že zlúčenina podľa vynálezu je novej, doteraz neznámej štruktúry a pôsobí regulačne na rast a syntézu chlorofylu rias *Chlorella vulgaris*.

Zvlášť významný je fakt, že zlúčenina podľa vynálezu v koncentrácii 1.10^{-5} až 1.10^{-10} mol.dm⁻³ stimuluje u kukurice rast koraňov a stoniek.

Zlúčeninu podľa vynálezu možno používať ako účinnú zložku prípravkov pre stimuláciu rastu rastlín a reguláciu zelených rias a to samostatne, alebo v zmesi s inými látkami, ďalej ako medziprodukt pre ďalšie syntézy.

P A T E N T O V É N Á R O K Y

1. 3-n-Hexyl-6-nitro-2-benzotiazolinón vzorca



2. Spôsob prípravy zlúčeniny podľa bodu 1 vyznačený tým, že sa nechá reagovať draselná soľ 6-nitro-2-benzotiazolinónu s n-hexyljodidom v zmesi etanolu a vody za varu.