

(19) BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

PATENTCHRIFT



(12) Ausschließungspatent

(11) DD 287 033 A5

Erteilt gemäß § 17 Absatz 1
Patentgesetz der DDR
vom 27. 10. 1983
in Übereinstimmung mit den entsprechenden
Festlegungen im Einigungsvertrag

4(51) C 07 D 239/96

DEUTSCHES PATENTAMT

In der vom Anmelder eingereichten Fassung veröffentlicht

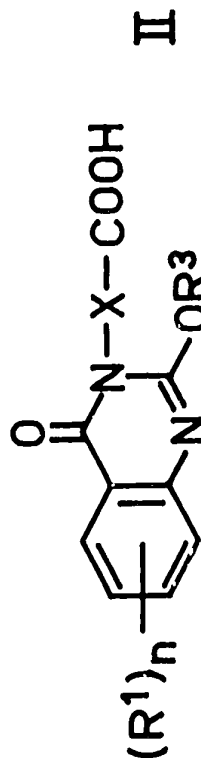
(21)	DD C 07 D / 331 859 3	(22)	17.08.89	(44)	14.02.91
(71)	Akademie der Wissenschaften der DDR, Otto-Nuschke-Straße 22/23, O - 1080 Berlin, DE				
(72)	Süße, Manfred, Dr. sc. Dipl.-Päd.; Johne, Siegfried, Prof. Dr. rer. nat. habil. Dipl.-Chem., DE				
(73)	Akademie der Wissenschaften der DDR, Institut für Biochemie der Pflanzen, BfSR, Weinberg 3, O - 4050 Halle (Saale), DE				
(74)	siehe (73)				
(54)	Verfahren zur Herstellung von 2-Alkoxy-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkansäuren				

(55) 2-Alkoxy-3,4-dihydro-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkansäuren;
2-Alkylthio-3,4-dihydro-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkan-
säureester

(57) Die Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung von
2-Alkoxy-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkansäuren.

Erfindungsgemäß wird ein

2-Alkylthio-3,4-dihydro-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkansäure-
ester in einem aliphatischen primären Alkohol mit einem
Alkalihydroxid unter Erwärmen zu einer
2-Alkoxy-3,4-dihydro-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkansäure der
allgemeinen Formel II umgesetzt. Unter den Verbindungen
der allgemeinen Formel II befinden sich fungizid oder
pflanzenwachstumsregulatorisch wirksame Substanzen.
Formel II



Patentansprüche:

Verfahren zur Herstellung von 2-Alkoxy-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkansäuren der allgemeinen Formel II, dadurch gekennzeichnet, daß man einen 2-Alkylthio-3,4-dihydro-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkansäureester der allgemeinen Formel I in einem aliphatischen primären Alkohol mit einem Alkalihydroxid unter Erwärmen zu einer 2-Alkoxy-3,4-dihydro-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkansäure der allgemeinen Formel II umsetzt, wobei in den allgemeinen Formeln I und II R, R² und R³ unabhängig voneinander für Alkyl (gleich oder verschieden), X für Alkylen (geradkettig [C₁-C₁₀] oder verzweigt, gegebenenfalls substituiert) R¹ für Alkyl, Alkoxy, Halogen, CF₃, NO₂, CN oder Dialkylamino und n für 0 bis 4, wobei in den Fällen n = 2, 3 oder 4 die R¹ gleich oder verschieden sind, stehen.

Hierzu 1 Seite Formeln

Anwendungsgebiet der Erfindung

Die Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung von 2-Alkoxy-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkansäuren der allgemeinen Formel II. Die Erfindung ist für die Land-, Garten- und Forstwirtschaft von Interesse, wo erfindungsgemäß hergestellte Verbindungen z. B. als Fungizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren einsetzbar sind.

Charakteristik des bekannten Standes der Technik

Eine große Anzahl von Chinazolinen mit potentieller Wirkung als Phytoeffektoren, Fungizide, Akarizide, Insektizide oder Herbizide ist bekannt (M. Süße, S. John, Z. Chem. 21, 431 [1981]).

Einige 4-Alkoxy- und 2,4-Dialkoxy-chinazoline wurden bisher aus den entsprechenden Halogenchinazolinen und Alkoholen erhalten (W. L. F. Armarego, „The Chemistry of Heterocyclic Compounds“, 24. Band „Fused Pyrimidines, I. Quinazolines“, New York, London, Sydney, [1967]).

2-Alkoxy-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkansäuren der allgemeinen Formel II sind bisher nicht bekannt.

Ziel der Erfindung

Ziel der Erfindung ist es, neue, biologisch aktive 2-Alkoxy-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkansäuren der Praxis als Wirkstoffe zur Verfügung zu stellen.

Darlegung des Wesens der Erfindung

Die Aufgabe der Erfindung besteht darin, ein Verfahren zur Herstellung von 2-Alkoxy-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkansäuren der allgemeinen Formel II zu entwickeln.

Erfindungsgemäß wird ein 2-Alkylthio-3,4-dihydro-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkansäureester der allgemeinen Formel I in einem aliphatischen primären Alkohol mit einem Alkalihydroxid unter Erwärmen zu einer 2-Alkoxy-3,4-dihydro-4-oxo-chinazolin-3-yl-alkansäure der allgemeinen Formel II umgesetzt.

Überraschenderweise findet unter diesen Reaktionsbedingungen neben der Hydrolyse der Estergruppe (-COOR²) eine Substitution der Alkylthiogruppe (-SR) statt.

In den allgemeinen Formeln I und II stehen R, R² und R³ (vorzugsweise C₁-C₄, gleich oder verschieden) für Alkyl, X für Alkylen (geradkettig [C₁-C₁₀] oder verzweigt, gegebenenfalls substituiert), R¹ für Alkyl, Alkoxy, Halogen, CF₃, NO₂, CN oder Dialkylamino und n für 0 bis 4, wobei in den Fällen n = 2, 3 oder 4 die R¹ gleich oder verschieden sind.

Das erfindungsgemäße Verfahren ermöglicht erstmalig die Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel II.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel II sind biologisch aktiv. Unter ihnen befinden sich solche, die eine fungizide oder pflanzenwachstumsregulatorische Wirkung zeigen.

Die Erfindung wird nachstehend durch Ausführungsbeispiele erläutert.

Ausführungsbeispiele

Beispiel 1

300 mg 3,4-Dihydro-2-methylthio-4-oxo-chinazolin-3-yl-essigsäuremethylester (I: n = 0, R = R² = CH₃, X = CH₂) und 240 mg KOH werden in 30 ml 95%igem Methanol 1 Stunde unter Rückfluß erhitzt. Das Methanol wird im Vakuum abdestilliert und der Rückstand aus Ethanol mit Aktivkohle umkristallisiert; Ausbeute: 160 mg an 3,4-Dihydro-2-methoxy-4-oxo-chinazolin-3-yl-essigsäure (II: n = 0, R² = CH₃, X = CH₂).

