

FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

POPIS VYNÁLEZU

K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

269 384

(21) PV 4757-88.P
(22) Přihlášeno 01 07 88

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

(11)

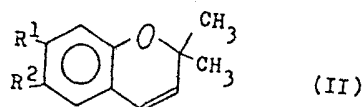
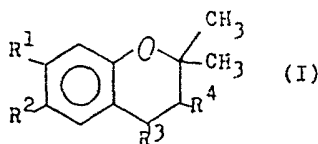
(13) B1

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

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

(54) Biologicky účinné deriváty 3,4-dihydro-
-2H-benzopyranu a způsob jejich přípra-
vy

(57) Předmětem řešení jsou nové biologic-
ky účinné deriváty 3,4-dihydro-2H-benzo-
pyranu obecného vzorce I, kde symbol R^1
a R^2 značí nezávisle na sobě jeden z
těchto substituentů: 1-hydroxyalkylsku-
pinu či alkoxy skupinu nebo alkoxyalko-
xyskupinu s maximálně 3 atomy uhlíku,
symboly R^3 a R^4 značí brom nebo alkoxy-
skupinu s maximálně 3 atomy uhlíku, a to
takovým způsobem, že značí-li R^4 brom,
 R^3 značí alkoxy skupinu a naopak. Jejich
pesticidní účinek byl vyzkoušen napří-
klad na hmyzu a roztočích. Další částí
řešení je způsob přípravy látek obecné-
ho vzorce I, spočívající v reakci nena-
sycené sloučeniny obecného vzorce II,
kde symboly R^1 , R^2 mají výše uvedený
význam s alkanolem s maximálně 3 atomy
uhlíku v alkylskupině a N-bromsukcinimi-
dem při teplotě 0 až 5 °C.



Vynález se týká biologicky účinných derivátů 3,4-dihydro-2H-benzopyranu a způsobu jejich přípravy.

Látky, jež jsou předmětem vynálezu představují ekologicky vhodnější variantu překocennových, biologicky účinných sloučenin.

Podstatou vynálezu jsou biologicky účinné deriváty 3,4-dihydro-2H-benzopyranu obecného vzorce I



kde R^1 a R^2 značí nezávisle na sobě jeden z těchto substituentů: 1-hydroxyalkylskupinu či alkoxy skupinu nebo alkoxyalkoxy skupinu s maximálně 3 atomy uhlíku, R^3 a R^4 značí brom nebo alkoxy skupinu s maximálně 3 atomy uhlíku, a to takovým způsobem, že značí-li R^4 brom, R^3 značí alkoxy skupinu a naopak.

Způsob přípravy biologicky účinných derivátů 3,4-dihydro-2H-benzopyranu obecného vzorce I se vyznačuje tím, že se nechá reagovat nenasycená sloučenina obecného vzorce II



kde R^1 , R^2 mají výše uvedený význam, s alkanolem s maximálně 3 atomy uhlíku v alkylskupině a N-bromsukcinimidem při teplotě 0 až 5 °C, za vzniku látky obecného vzorce I.

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

Příklad 1

K roztoku 0,19 g (1 mmol) 2,2-dimethyl-7-methoxy-2H-benzopyranu v 5 ml bezvodého methanolu bylo při teplotě 0 až 5 °C přidáno za míchání a za nepřístupu vzdušné vlhkosti 0,2 g (1,7 mmol) N-bromsukcinimidu. Reakční směs byla pak ještě míchána 15 minut. Po zředění vodou a extrakci diethyleterem byla oddělená a vysušená éterická vrstva odpařena. Odparek poskytl po dělení na sloupci silikagelu s 8 % hmot. vody (eluční činidlo: petroléter obsahující až 50 % obj. diethyleteru) 0,2 g (67 %) 3-brom-2,2-dimethyl-4,7-dimethoxy-3,4-dihydro-2H-benzopyranu.

IČ spektrum (CCl_4 , 5 %): 2830 (CH_3 v OCH_3), 1613, 1581, 1489 (aromatika), 1444 (CH_3 v OCH_3), 1387, 1372 (CH_3) cm^{-1} .

^{13}C -NMR spektrum: 22.97 a 27.31 ($(\text{CH}_3)_2\text{C}$), 55.24 (CHBr), 55.99 (OCH_3), 56.16 ($\text{CH}_3\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4$), 78.19 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 78.69 (CHOCH_3), 101.36 (CH), 108.52 (CH_2), 112.76 (C_6H_4), 129.38 (CH), 153.84 ($\text{C}=\text{O}$), 160.84 ($\text{CH}_3\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4$).

Příklad 2

Stejným způsobem byl připraven 3-brom-2,2-dimethyl-4-methoxy-6-(1-hydroxypropyl)-3,4-dihydro-2H-benzopyran. MS spektrum: 328/330 M^+ , $\text{C}_{15}\text{H}_{21}\text{BrO}_3$.

Biologická účinnost látek podle vynálezu byla zkoušena například na termitech *Prorhinotermes simplex* (insekticidní účinek u 0,2 % váh. v acetonu, vznik interkast u 0,2 % váh. za přídatku 0,1 % váh. juvenilizačního metoprénu v acetonu: 14.den 10/10 v čitateli % bílých vojáků, ve jmenovateli % interkast.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Biologicky účinné deriváty 3,4-dihydro-2H-benzopyranu obecného vzorce I



kde R^1 a R^2 značí nezávisle na sobě jeden z těchto substituentů: 1-hydroxyalkylskupinu či alkoxy skupinu nebo alkoxyalkoxy skupinu s maximálně 3 atomy uhlíku, R^3 a R^4 značí brom nebo alkoxy skupinu s maximálně 3 atomy uhlíku, s podmínkou, že značí-li R^4 brom, R^3 značí alkoxy skupinu a naopak.

2. Způsob přípravy derivátů 3,4-dihydro-2H-benzopyranu obecného vzorce I, kde R^1 , R^2 , R^3 a R^4 mají shora uvedený význam, vyznačující se tím, že se nechá reagovat nenasyčená sloučenina obecného vzorce II



kde R^1 , R^2 mají výše uvedený význam, s alkanolem s maximálně 3 atomy uhlíku v alkylskupině a N-bromsukcinimidem při teplotě 0 až 5 °C.