ČESKÁ A SLOVENSKÁ FEDERATIVNÍ REPUBLIKA
(19)

FEDERÁLNÍ ÚŘAD PRO VYNÁLEZY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

269 382

(11)

(13) B1

(51) Int. Cl.[4]
A 01 N 43/06

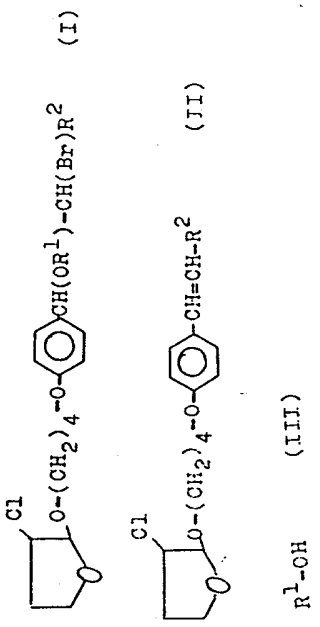
(21) PV 4755-88.L
(22) Přihlášeno 01 07 88

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

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

(54) Vicinální brom-alkoxyderiváty alifatickoaromatických éterů s tetrahydrofuranovým cyklem v molekule jako biologicky účinné látky a způsob jejich přípravy

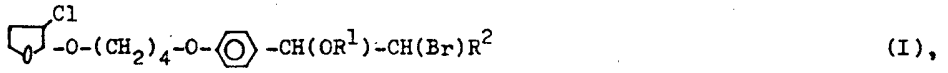
(57) Předmětem řešení jsou nové biologicky účinné látky obecného vzorce I, kde symbol R^1 značí alkylskupinu s rovným i rozvětveným řetězcem s maximálně 3 atomy uhlíku, symbol R^2 značí methyl- nebo ethylskupinu. Jejich pesticidní účinky byly vyzkoušeny například na hmyzu a roztočích. Další částí řešení je způsob přípravy látek obecného vzorce I, spočívající v reakci nenasyceného éteru obecného vzorce II, kde symbol R^2 má výše uvedený význam a N-bromsukcinimidem při teplotě 0 až 5 °C.



CS 269 382 B1

Vynález se týká vicinálních brom-alkoxyderivátů alifaticko-aromatických éterů s tetrahydrofuranovým cyklem v molekule jako biologicky účinných látek a způsobu jejich přípravy.

Podstatou předmětného vynálezu jsou vicinální brom-alkoxyderiváty alifaticko-aromatických éterů s tetrahydrofuranovým cyklem v molekule obecného vzorce I



(I),

kde R^1 značí alkylskupinu s rovným i rozvětveným řetězcem s maximálně 3 atomy uhlíku, R^2 značí methyl- nebo ethylskupinu.
Biologické (pesticidní) účinky látek obecného vzorce I byly zkoušeny například na termitech, kde se k boji proti těmto škůdcům na dřevě doposud používají ekologicky neúnosné prostředky, jako je pentachlorfenol a podobně.

Způsob přípravy vicinálních brom-alkoxyderivátů alifatickoaromatických éterů s tetrahydrofuranovým cyklem v molekule obecného vzorce I se vyznačuje tím, že se nechá reagovat nenasycený éter obecného vzorce II

(II),

kde R^2 má výše uvedený význam,
s alkanolem obecného vzorce III

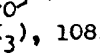
$$R^1OH \qquad \text{(III)},$$

kde R^1 má výše uvedený význam,
a N-bromsukcinimidem při teplotě 0 až 5 °C za vzniku produktu obecného vzorce I.

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

Příklad

K roztoku 0,3 g (1 mmol) 1-(2-propenyl)-4-[4-(3-chloro-2-tetrahydrofuryl)oxybutoxy]-benzenu v 5 ml bezvodého methanolu bylo přidáno při 0 až 5 °C za nepřístupu vzdušné vlhkosti 0,3 g (1,7 mmol) N-bromsukcinimidu. Po čtvrthodinovém míchání reakční směs zředěna vodou a vytřepána mezi diethyléter a vodu. Oddělená a vysušená éterická vrstva byla odpařena k suchu. Chromatografií odparku na sloupci silikagelu s 8 % hmot. vody (eluční činidlo petroléter obsahující až 20 % obj.(diethyléteru) bylo získáno 0,3 g (73 %) 1'-(1-methoxy-2-brompropyl)-4'-[4-(3-chlor-2-tetrahydrofuryl)-oxybutoxy]benzenu.

^{13}C-NMR spektrum (200 MHz): 20.60 ($\underline{CH_3}$), 25.97 a 26.16 ($\underline{CH_2CH_2}$), 33.38 ( ), 52.71 ($\underline{CH}Br$), 57.33 ($O\underline{CH_3}$), 60.31 ( ), 66.35 (), 66.90 ($\underline{CH_2}O$-), 67.38 ($CH_2\underline{CH_2}O$), 86.73 ($\underline{CH}OCH_3$), 108.17 (), 114.04, 128.58, 130.16, 158.82 (aromatické jádro).

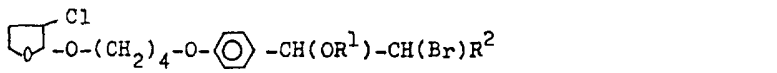
MS spektrum : 420/2/4 (M^+,$C_{18}H_{26}BrClO_4$), 313($C_{16}H_{22}ClO_4$), 299($C_{14}H_{20}O_2Br$), 237($C_{13}H_{17}O_4$), 164($C_{10}H_{12}O_2$), 137($C_8H_9O_2$), 105 (C_4H_6O).

IČ spektrum (CCl_4, 3 %): 2 825 ($\nu_s CH_3$), 1 613, 1 586, 1 515 (νaromatika), 1 474 ($\delta_s CH_2 + \delta_{as} OCH_3$), 1 176, 1091, 1042 (heterocyklus)cm^{-1}.

Biologické účinky byly zkoumány u termitů Prorhinotermes simplex a Coptotermes formosanum, u roztočů Tetranychus urticae a škůdci na bavlníku Dysdercus cingulatus. Tak například 1'-(1-methoxy-2-brompropyl)-4'-[4-(3-chlor-2-tetrahydrofuryl)oxybutoxy]benzen vyvolal:
u Prorhinotermes simplex (0,2 % váh. v acetonu): zpomalení vývoje způsobující ve svých důsledcích zánik kolonií (13. den 0/0, 15. den 0/0, 17. den 0/0, kde v čitateli zlomku je vyznačen výskyt bílých vojáků v %, ve jmenovateli výskyt interkast v %),
u Coptotermes formosanum (0,001 % váh. v acetonu, filtrační papír Whatman č. 1): 82%ní snížení žravosti,
u roztočů Tetranychus urticae byl nalezen akaricidní účinek ve smyslu snížení oogeneze a líhnivosti již při koncentraci 10^{-4} % obj..

P Ř E D M Ě T V Y N Á L E Z U

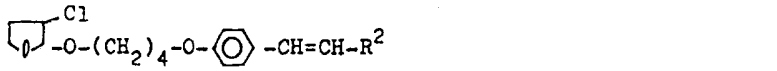
1. Vicinální brom-alkoxyderiváty alifaticko-aromatických éterů s tetrahydrofuranovým cyklem v molekule obecného vzorce I



(I),

kde R^1 značí alkylskupinu s rovným i rozvětveným řetězcem s maximálně 3 atomy uhlíku, R^2 značí methyl- nebo ethylskupinu, jako biologicky účinné látky.

2. Způsob přípravy sloučenin podle bodu 1, obecného vzorce I, vyznačující se tím, že se nechá reagovat nenasycený éter obecného vzorce II



(II),

kde R^2 má výše uvedený význam, s alkanolem obecného vzorce III

$$R^1OH \qquad \text{(III)},$$

kde R^1 má výše uvedený význam,
a N-bromsukcinimidem při teplotě 0 až 5 °C.