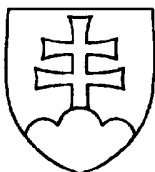


SLOVENSKÁ REPUBLIKA

(19) **SK**



ÚRAD
PRIEMYSELNÉHO
VLASTNÍCTVA
SLOVENSKEJ REPUBLIKY

PATENTOVÝ SPIS

(11) Číslo dokumentu:

277 947

(13) Druh dokumentu: **B6**

(51) Int. Cl.⁶:

C 07 D 277/68,
C 07 D 277/70,
C 07 D 417/12

(21) Číslo prihlášky: 1605-90

(22) Dátum podania: 02.04.90

(31) Číslo prioritnej prihlášky:

(32) Dátum priority:

(33) Krajina priority:

(43) Dátum zverejnenia: 15.10.91

(45) Dátum oznámenia o udelení vo Vestníku: 13.09.95

(86) Číslo PCT:

(76) Majiteľ a pôvodca patentu: **LÁCOVÁ Margita** doc. RNDr. CSc., Bratislava, SK;
TICHÁ Ester RNDr., Bratislava, SK;
VARKONDA Štefan RNDr. CSc., Bratislava, SK;
KONEČNÝ Václav RNDr. CSc., Bratislava, SK;

(54) Názov vynálezu: **2-(4-Chlórbenzotiazolyl)-2-(4-chlórbenzotiazol)karbaditioát**

(57) Anotácia:
Bol pripravený 2-(4-chlórbenzotiazolyl)-2-(4-chlórbenzotiazol)karbaditioát, ktorého syntéza sa uskutočňuje reakciou 2,4-dichlórbenzotiazolu a sírouhlika v prostredí dimetylsulfoxidu a vodného roztoku hydroxidu sodného. Zlúčenina je fungicídne účinná proti *Alternaria species*, *Botrytis cinerea* a *Fusarium nivale*.

Oblasť techniky

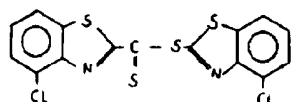
Vynález sa týka 2-(4-chlórbenzotiazolyl)-2-(4-chlórbenzotiazolyl)karbaditioátu a spôsobu jeho výroby.

Doterajší stav techniky

Je známe, že v poľnohospodárskej praxi sa používajú prostriedky na ochranu rastlín na báze ditiokarboxylových kyselín a benzotiazolov napr. METHAM-SODIUM ($\text{CH}_3\text{NHCSSNa}^+$), ktorý je pôdnym fungicídom a BENZTHIAZURON (N-2-benzotiazolyl-N'-metylmocovina) je známy herbicídny prostriedok.

Podstata vynálezu

Predmetom vynálezu je 2-(4-chlórbenzotiazolyl)-2-(4-chlórbenzotiazolyl)karbaditioát a spôsob jeho výroby. Táto zlúčenina má fungicídne vlastnosti. 2-(4-Chlórbenzotiazolyl)-2-chlórbenzotiazolyl)karbaditioát vzorca I sa vyrába



reakciou 2,4-dichlórbenzotiazolu so sírouhlíkom v prostredí dimetylsulfoxidu a vodného roztoku NaOH. Pri zlúčenine vzorca I boli súčasne zistené fungicídne účinky na tri patogénne organizmy, a to *Alternaria species*, *Botrytis cinerea* a *Fusarium nivale*. Výhodnosť riešenia je v tom, že zlúčenina je účinná súčasne proti trom patogénnym hubám. Syntéza vychádza z dostupných surovín a je jednoduchá.

Zlúčenina podľa vynálezu sa môže používať ako fungicídny prostriedok na poľnohospodárske a záhradnícke účely samotná alebo v zmesi s úpravárenskými pomocnými látkami, ďalej sa môže používať ako prostriedok na morenie osív a sadív.

Prostriedok podľa vynálezu sa môžu používať vo forme prášku, mikrogramúl, suspenzií alebo emulzií koncentrátov.

Príklady uskutočnenia vynálezu

Nasledujúce príklady ozrejmuju, ale neobmedzujú predmet vynálezu.

Príklad 1

2-(4-Chlórbenzotiazolyl)-2-(4-chlórbenzotiazolyl)karbaditioát.

K reakčnej zmesi zloženej z 2,4-dichlórbenzotiazolu (0,02 mol), sírouhlíka (0,014 mol) a dimetylsulfoxidu (40 cm^3) sa za miešania prikvapáva 5 %-ný vodný roztok NaOH (18 cm^3). Zmes sa udržiava pri teplote $30 - 35^\circ\text{C}$. Potom sa pri laboratórnej teplote mieša 1 hodinu, vyleje na rozlíšený ľad, žltá zrazenina sa odsaje, premyje vodou a môže sa kryštalizovať zo zmesi cyklohexán-etanol. Teplota topenia je $199 - 202^\circ\text{C}$.

Analýza pre $\text{C}_{15}\text{H}_6\text{Cl}_2\text{N}_2\text{S}_4$ ($M = 413,36$)

(%)	C	H	Cl	N	S
vypočítané:	43,58	1,46	17,15	6,77	31,02
zistené:	43,21	1,86	17,48	6,85	30,70

Príklad 2

Výsledky antifungálnej aktivity zlúčeniny z príkladu 1.

Metodika práce II. screeningu.

Antifungálna aktivita novosyntetizovanej zlúčeniny sa stanovila na modelových mikromycétach "in vitro" tak, že navážka zlúčeniny sa pridáva do živného agarového média a periodicky sa sleduje kinetika rastu modelovej mikromycéty, pri rôznych koncentráciách účinnej látky. Kritérium antifungálnej účinnosti je inhibícia radiálneho rastu kolónie huby. Spôsob vyhotovenia vychádza z periodického merania premien kolónie mikromycéty, z meraní sa zostroja rastové krivky. Účinnok testovanej látky sa porovnáva s účinkom štandardu pomocou hodnôt indexu toxicity (IT)

$$IT = \frac{ED_{50} \text{ štandard}}{ED_{50} \text{ testovaná vzorka}} \cdot 100$$

Výsledky sú v tabuľke 1. Používal sa 5 %-ný emulzný koncentrát.

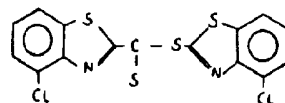
Tabuľka 1

Výsledky fungicídneho testu

modelové objekty	účinná látka	MIC ($\mu\text{g ml}^{-1}$)
	Príklad 1	MIC > 100
<i>Alternaria species</i>	Dithiane 2-45 (Štandard)	$50 < \text{MIC} < 100$
<i>Botrytis cinerea</i>	Príklad 1	MIC > 100
	Suparen (Štandard)	$10 < \text{MIC} < 50$
<i>Fusarium nivale</i>	Príklad 1	$50 < \text{MIC} < 100$
	Fundesol (Štandard)	$5 < \text{MIC} < 10$

PATENTOVÉ NÁROKY

1. 2-(Chlórbenzotiazolyl)-2-(4-chlórbenzotiazolyl)karbaditioát vzorca I



2. Spôsob prípravy zlúčeniny podľa nároku 1, vyznačujúci sa tým, že sa nechá reagovať zmes 2,4-dichlórbenzotiazolu, sírouhlíka a hydroxidu sodného v prostredí dimetylsulfoxidu a vody.

Koniec dokumentu