



FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVEDČENIU

266 991

(11)

(13) B1

(51) Int. Cl.⁴
A 01 N 43/78

(21) PV 2041-88.0
(22) Prihlášené 28 03 88

(40) Zverejnené 12 05 89
(45) Vydané 14 12 90

(75)

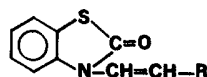
Autor vynálezu

SUTORIS VIKTOR prof. RNDr. CSc.,
SEKERKA VLADIMÍR prof. RNDr. DrSc., BRATISLAVA

(54)

3-(2-R-vinyl)-2-benzotiazolinóny a spôsob ich prípravy

(57) Podstatou riešenia sú nové látky, 3-(2-R-vinyl)-2-benzotiazolinónov, vzorca I, kde R znamená fenyl, 2-nitrofenyl, 3-nitrofenyl, 4-nitrofenyl, 2-chlórfenyl, 4-chlórfenyl, 3,4-dichlórfenyl, 2-metoxifenyl, 4-metoxifenyl, 2,4-dimetoxifenyl, 4-dimetylaminofenyl, 4-acetamidofenyl, 3,4-metylidéndioxyfenyl, 2-furyl, 3-pyridyl, 5-(4-metylphenyl)-2-furyl, ktoré môže nájsť uplatnenie ako regulátory rastu rastlín v oblasti stimulačnej alebo inhibičnej a ako nové východiskové zlúčeniny pre ďalšie chemické reakcie. Uvedené látky možno pripraviť reakciou (2-oxo-3-benzotiazolinyl-metyl)trifenylfosfóniumhalogenidu s RCHO, kde R je uvedené vyššie v prostredí organických rozpúšťadiel ako sú bezvodý metylalkohol, etylalkohol a tetrahydrofurán za prítomnosti trietylaminu, metylátu sodného, alebo etylátu sodného pri teplote 64 až 80 °C po dobu 3 až 5 h.



(I)

Vynález sa týka 3-(2-R-vinyl)-2-benzotiazolinónov obecného vzorca I.



kde R znamená fenyl, 2-nitrofenyl, 3-nitrofenyl, 4-nitrofenyl, 2-chlórfenyl, 4-chlórfenyl, 3,4-dichlórfenyl, 2-metoxifenyl, 4-metoxifenyl, 2,4-dimetoxifenyl, 4-dimetylamínofenyl, 4-acetamidofenyl, 3,4 metylidéndioxyfenyl, 2-furyl, 2-pyridyl, 5-(4-metylfenyl)-2-furyl a spôsobu ich prípravy.

Z oblasti derivátov benzotiazolu, podľa literárnej dokumentácie sú 3-substituované-2-benzotiazolinóny najúčinnnejšie v oblasti regulácie rastu rastlín (D'Amico J. J.: USA pat. 4 371 388 (1983); Chem. Abstr. 99, 22 454 (1983); D'Amico J. J.: USA pat. 4 187 097 (1977); Eur. pat. 2 613 (1979); Chem. Abstr. 92, 419 332 (1983); Ueda I.: Jap. Pat. 92 956 (1979); Chem. Abstr. 92, 94 383 (1983); Sutoris V., Mikulášek S., Sekerka V., Konečný V.: CS pat. 252 502 (1987); Varkonda Š., Hýblová O., Sutoris V., Konečný V., Mikulášek S.: CS pat. AO č. 235 845.

Účinnosť bola zistená tiež v oblasti fungicídnej (Jap. pat. 9 040 546 (1977); ZSSR pat. 713 523 (1978); NSR pat. 2 846 980 (1978); D'Amico J. J.: Eur. pat. 7 772 (1980); Chem. Abstr. 93, 150 241 (1983) a tiež ako herbicíd (Sohler E., Seidler L., Vaňo J., Šplháček R., Fedor E.: CS pat. 172 118 (1974)).

Je známe, že okrem prirodzených regulátorov rastu sa rozvíja využitie rôznych syntetických látok. Uplatňujú sa predovšetkým tie, u ktorých postačuje dávka v rozsahu niekoľkých gramov na ha, nie sú závislé od klimatických podmienok a nevyvolávajú negatívne dôsledky, ako sú napr. nežiaduce reziduá.

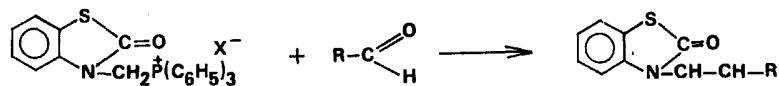
Teraz sa zistilo, že zlúčeniny typu 3-(2-R-vinyl)-2-benzotiazolinónov, kde R znamená to isté ako vo vzorci I, majú rastovoregulačný účinok podľa vynálezu.

3-(2-R-vinyl)-2-benzotiazolinóny podľa vynálezu nie sú v literatúre doteraz popísané.

Podstata spôsobu prípravy látok podľa vynálezu spočíva v tom, že (2-oxo-3-benzotiazolinyl-metyl)trifenylfosfóniumhalogenid vzorca II



kde X^- znamená chlór, bróm, jód, reaguje s aromatickými aldehydmi v prostredí bezvodých organických rozpúšťadiel ako sú metanol, etanol, tetrahydrofurán, za prítomnosti trietylamínu, metylátu sodného alebo etylátu sodného pri teplote 64 až 80 °C, po dobu tri až päť hodín. Uvedenú reakciu naznačuje nasledovná schéma:



kde X^- je horeuvedené a R znamená to isté ako vo vzorci I.

Postupy prípravy 3-(2-R-fenyl)-2-benzotiazolinónov

P r í k l a d 1

3-(2-fenylvinyl)-2-benzotiazolinón

Po rozpustení 4,6 g (0,01 mol) (2-oxo-3-benzotiazolinylnymetyl)trifenylfosfóniumchloridu v 30 cm³ bezvodého metanolu, pridá sa 1 g (0,01 mol) trietylaminu a za miešania sa prikvapká 1,06 g (0,01 mol) benzaldehydu v 10 až 15 cm³ metanolu. Reakčná zmes sa 5 h zahrieva na teplotu varu. Po ochladení sa pridá 10 až 20 cm³ vody a reakčná zmes sa nechá cez noc stať. Izolovaný kryštalický podiel kryštalizovaný z etanolu. T. t. 91 až 92,5 °C, výťažok 30 %.

Pre C₁₅H₁₁NOS, m.h. 253,32 vypočítané % C = 71,15, % H = 4,43, % N = 5,53, % S = 12,64. Zistené % C = 71,16, % H = 4,43, % N = 5,62, % S = 12,71.

P r í k l a d 2

3-(2-(2-nitrofenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón

K 30 cm³ bezvodého metanolu sa pridá 0,23 g (0,01 mol) sodíka a 4,6 (0,01 mol) (2-oxo-3-benzotiazolinylnymetyl)trifenylfosfóniumchloridu. Za miešania sa prikvapká roztok 1,5 g (0,01 mol) 2-nitrobenzaldehydu v 15 cm³ bezvodého metanolu. Reakčná zmes sa 3 h zahrieva na teplotu varu. Po ochladení žltá kryštalická látka sa kryštalizuje z acetónu. Kryštalizácia sa urýchli pridaním 20 cm³ vody. T. t. 157 až 160 °C, výťažok 46 %.

Pre C₁₅H₁₀N₂O₃S, m.h. 298,32, vypočítané % C = 60,39, % H = 3,37, % N = 9,39, % S = 10,71. Zistené % C = 60,15, % H = 3,25, % N = 9,15, % S = 10,53.

P r í k l a d 3

3-(2-(2-chlórfenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón

5,5 g (0,01 mol) (2-oxo-3-benzotiazolinylnymetyl)trifenylfosfóniumjodidu, 1 g (0,01 mol) trietylaminu, 2,1 g (0,01 mol) 2-chlórbenzaldehydu a 20 cm³ bezvodého tetrahydrofuránu sa mieša 4 h pri teplote varu reakčnej zmesi. Po pridaní 20 cm³ vody sa reakčná zmes chladí. Izolovaný pevný podiel sa kryštalizuje z etanolu. T. t. 89 až 91 °C, výťažok 23 %.

Pre C₁₅H₁₀ClNOS, m.h. 287,77, vypočítané % C = 62,62, % H = 3,50, % N = 4,86, % S = 11,14. Zistené % C = 62,70, % H = 3,32, % N = 4,66, % S = 11,20.

P r í k l a d 4

2-(2-(4-betoxifyenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón

K 20 cm³ bezvodého etanolu sa pridá 0,23 g (0,01 mol) sodíka, 5 g (0,01 mol) (2-oxo-3-benzotiazolinylnymetyl)trifenylfosfóniumbromidu a 2 g (0,015 mol) 4-metoxybenzaldehydu. Reakčná zmes sa zahrieva 4 h na teplotu varu. Pridá sa 20 cm³ vody a 48 h chladením v chladničke vznikne kryštalický podiel, ktorý sa kryštalizuje z etanolu. T. t. 78 až 80 °C, výťažok 32 %.

Pre C₁₆H₁₃NO₂S, m.h. 283,35, vypočítané % C = 67,83, % H = 4,62, % N = 4,94, % S = 11,31. Zistené % C = 67,70, % H = 4,50, % N = 4,80, % S = 11,16.

P r í k l a d 5

3-(2-(4-dimetylaminofenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón

K 15 cm³ bezvodého metanolu sa pridá 0,23 g (0,01 mol) sodíka, 5,0 g (0,01 mol) (2-oxo-3-benzotiazolinylnymetyl)trifenylfosfóniumbromidu sa postupne pridá 2,34 (0,015 mol) 4-dimetylaminobenzaldehydu v 10 cm³ metanolu. K reakčnej zmesi po 5 h zahrievania na teplotu varu sa pridá voda do mierneho zákalu. Chladením vzniknutá pevná látka sa kryštalizuje z etanolu. T. t. 144 až 146 °C, výťažok 34 %.

Pre $C_{17}H_{16}N_2OS$, m.h. 296,39, vypočítané % C = 68,88, % H = 5,77, % N = 9,45, % S = 10,81.
Zistené % C = 68,73, % H = 5,41, % N = 9,55, % S = 10,77.

Pr í k l a d 6

3-(2-pyridylvinyl)-2-benzotiazolinón

4,6 g (0,01 mol) (2-oxo-3-benzotiazolinylmetyl)trifenylfosfóniumchloridu sa rozpustí v 30 cm³ bezvodého metanolu, pridá sa 1 g (0,01 mol) trietylamínu a za miešania sa prikvapká 1,07 g (0,01 mol) pyridinkarbaldehydu v 10 cm³ bezvodého metanolu. Zmes sa 4 h zahrieva na teplotu varu. Po ochladení sa izoluje kryštallická látka o t. t. 137 až 140 °C, výťažok 44 %.

Pre $C_{14}H_{10}N_2OS$, m.h. 254,31, vypočítané % C = 66,12, % H = 3,96, % N = 11,01, % S = 12,60.
Zistené % C = 66,27, % H = 3,94, % N = 10,98, % S = 12,50.

Výsledky elementárnej analýzy syntetizovaných zlúčenín podľa vynálezu sa uvedené v tabuľke 1.

T a b u ľ k a 1

Charakterizácia syntetizovaných zlúčenín

Zlúčenina	R	Sumárny vzorec	M.h.	Vypočítané/Zistené				Výťažok %	T. t. °C
				% C	% H	% N	% S		
I	C_6H_5	$C_{15}H_{11}NOS$	253,32	71,15 71,16	4,43 4,43	5,53 5,62	12,64 12,71	30	91 až 92,5
II	$2-NO_2C_6H_4$	$C_{15}H_{10}N_2O_3S$	298,32	60,39 60,15	3,37 3,25	9,39 9,15	10,71 10,53	46	157 až 160
III	$3-NO_2C_6H_4$	$C_{15}H_{10}N_2O_3S$	298,32	60,39 60,58	3,37 3,33	9,39 9,16	10,71 10,54	37	192 až 195
IV	$4-NO_2C_6H_4$	$C_{15}H_{10}N_2O_3S$	298,32	60,39 60,30	3,37 3,32	9,39 9,20	10,71 10,50	67	209 až 212
V	$2-ClC_6H_4$	$C_{15}H_{10}ClNOS$	287,77	62,62 62,70	3,50 3,32	4,86 4,66	11,14 11,20	23	89 až 91
VI	$4-ClC_6H_4$	$C_{15}H_{10}ClNOS$	287,77	62,62 62,35	3,50 3,66	4,86 4,72	11,14 10,96	49	132 až 135
VII	$3,4-Cl_2C_6H_3$	$C_{15}H_9Cl_2NOS$	322,21	55,91 55,64	2,81 2,64	4,34 4,32	9,95 9,83	57	220 až 223
VIII	$2-OCH_3C_6H_4$	$C_{16}H_{13}NO_2S$	283,35	67,83 68,00	4,62 4,59	4,94 4,99	11,31 11,38	50	65 až 67,5
IX	$4-OCH_3C_6H_4$	$C_{16}H_{13}NO_2S$	283,35	67,83 67,70	4,62 4,50	4,94 4,80	11,31 11,16	32	78 až 80
X	$2,4-(OCH_3)_2C_6H_3$	$C_{17}H_{15}NO_3S$	313,37	65,17 65,10	4,82 4,87	4,47 4,37	10,23 10,23	26	65 až 68
XI	$4-H(CH_3)_2C_6H_4$	$C_{17}H_{16}N_2OS$	296,39	68,88 68,73	5,77 5,41	9,45 9,55	10,81 10,77	34	144 až 146
XII	$4-CH_3CONHC_6H_4$	$C_{17}H_{14}N_2O_2S$	310,37	65,80 65,92	4,54 4,48	9,02 8,94	10,30 10,28	68	225 až 228
XIII	$3,4-O_2CH_2C_6H_4$	$C_{16}H_{11}NO_3S$	297,33	64,64 64,41	3,72 3,96	4,71 4,45	10,78 10,50	26	107 až 109
XIV	$2-Fu^a$	$C_{13}H_9NO_2S$	243,28	64,17 64,60	3,72 3,70	5,57 5,79	13,18 13,20	34	79 až 82
XV	$3-Pyr^a$	$C_{14}H_{10}N_2OS$	254,31	66,12 66,27	3,96 3,94	11,01 10,98	12,60 12,50	44	137 až 140
XVI	$C_6H_5CH=CH$	$C_{17}H_{13}NOS$	279,36	73,07 73,45	4,69 4,73	5,01 5,02	11,47 11,47	50	164 až 167
XVII	$5-(4-CH_3C_6H_4)-2Fu$	$C_{20}H_{15}NO_2S$	333,42	72,05 71,82	4,53 4,56	4,20 4,20	9,61 9,56	45	143 až 145

^askratky: Pyr - pyridyl

Fu - furyl

Infračervené spektrá 3-(2-R-vinyl)-benzotiazolínov, kde R znamená to isté ako vo vzorci I sa namerali v roztokoch tetrachlórmetánu a trichlórmetánu v oblasti 1 800 až 1 600 cm^{-1} na mriežkovom spektrofotometri Perkin-Elmer 567 pri laboratórnej teplote. Použili sa NaCl kvety hrúbky 0,1, 1,0 a 5,0 mm. Koncentrácia meraných roztokov sa volila tak, aby maximálna absorbanca bola 70 %-ná až 75 %-ná. Polohy pásov boli stanovené ako arytmetické priemety z troch meraní s presnosťou $\pm 0,5 \text{ cm}^{-1}$. Kalibrácia vlnočtovej stupnice spektrofotometra sa kontrolovala s použitím referenčných spektier vodnej pary a indénu.

Vlnočty IČ spektier syntetizovaných zlúčenín podľa vynálezu sú uvedené v tabuľke 2.

T a b u ľ k a 2

Hodnoty IČ spektier syntetizovaných zlúčenín podľa vynálezu

Zlúčenina	CHCl_3		CCl_4	
	$\nu(\text{C=O})$	$\nu(\text{C=C})$	$\nu(\text{C=O})$	$\nu(\text{C=C})$
I	1 684,5	1 644,0	1 700,5	1 645,0
II	1 687,5	1 645,0	1 701,0	1 646,0
III	1 686,5	1 645,5	1 699,5	-
IV	1 688,5	1 644,5	1 704,5	1 644,0
V	1 685,0	1 643,0	1 703,0	1 643,0
VI	1 684,5	1 645,0	1 702,0	1 647,0
VII	1 678,0	1 646,0	1 705,0	1 648,0
VIII	1 681,0	1 642,0	1 700,0	1 641,5
IX	1 682,5	1 648,0	1 699,0	1 649,0
X	1 679,0	1 639,0	1 679,0	1 642,0
XI	1 678,5	1 644,0	1 697,0	-
XII	1 681,5	1 647,5	1 701,0	-
XIV	1 683,5	1 652,5	1 698,0	1 650,0
XV	1 688,5	1 644,5	1 702,0	1 644,0
XVI	1 683,5	1 639,0	1 697,0	1 639,0
XVII	1 681,5	1 650,0	1 695,0	1 650,5

Látky podľa vynálezu sú účinné ako regulátory rastu rastlín. Rastové testy boli zamerané na prolungačný rast primárnych koreňov u *Vicia Sativa* L., cv. Solarka, ktorý je jedným z dôležitých ukazateľov fyziologických prejavov rastlín. Rastové testy sa uskutočnili antrónovou modifikovanou metódou. Príklad 7 osvetľuje spôsob testovania zlúčenín podľa vynálezu na reguláciu rastu.

P r í k l a d 7

Semená *Vicia Sativa* L., cv. Solarka klíčili na Petriho miskách v termostate, v tme pri 25 °C. Klíčenci po 48 h raste sa exponovali v molárnych roztokoch 3-(2-R-vinyl)-2-benzotiazolínónich, kde R je uvedené vo vzorci I. Testovanie sa uskutočnilo v koncentračnej škále 10^{-3} až $10^{-13} \text{ mol l}^{-1}$ a po 24 h inkubácii bol stanovený prírastok predĺžovacieho rastu koreňov. Po každom stanovení bol uskutočnený aj rastový efekt v kontrolnej sérii. Šírka súbormi boli stanovené biometricky. Výsledky regulácie rastu syntetizovaných zlúčenín podľa vynálezu sú uvedené v tabuľke 3.

T a b u l k a 3

Rastovoregulačný účinok syntetizovaných zlúčenín

Zlúčenina	Vicia sativa L.,			cv. Solarka		
	Stimulácia			Inhibícia		
	$\Delta l/mm$	%	C/(mol dm ⁻³)	$-\Delta l/mm$	%	C/(mol dm ⁻³)
I	1,56	4,95	10 ⁻⁵	6,83	21,69	10 ⁻³
II				10,83	32,43	10 ⁻³
III	1,79	6,86	10 ⁻⁷	6,64	25,47	10 ⁻³
IV				12,47	48,83	10 ⁻³
V	1,87	7,15	10 ⁻¹³	16,13	61,73	10 ⁻³
VI	3,64	12,89	10 ⁻⁵	5,49	19,46	10 ⁻³
VII	3,36	10,81	10 ⁻⁷	4,06	14,81	10 ⁻³
VIII	1,26	4,52	10 ⁻⁹	9,94	35,67	10 ⁻³
IX	3,33	10,53	10 ⁻¹¹	6,40	20,26	10 ⁻³
X	5,67	20,67	10 ⁻⁷	3,77	13,75	10 ⁻³
XI	1,59	5,70	10 ⁻⁷	8,01	24,66	10 ⁻³
XII	3,81	13,29	10 ⁻⁷	2,88	10,05	10 ⁻³
XIII	2,14	6,70	10 ⁻¹¹	5,07	15,88	10 ⁻³
XIV	1,87	6,23	10 ⁻⁵	13,53	45,10	10 ⁻³
XVI	1,20	4,01	10 ⁻⁹	6,07	20,33	10 ⁻³
IAA	3,10	12,99	10 ⁻¹²	18,55	77,78	10 ⁻⁶
2,4-D	4,49	20,00	10 ⁻⁹	23,30	94,15	10 ⁻⁵
CCC				3,85	11,23	10 ⁻³

IAA: beta-indolyloctová kyselina

2,4-D: 2,4-dichlórfenoxycetová kyselina

CC: 2-chlóretyltrimetylamóniumchlorid

Rastové testy boli uskutočnené aj na *Triticum aestivum* L.. Príklad 9 osvetľuje spôsob testovania zlúčenín podľa vynálezu na reguláciu rastu.

P r í k l a d 8

Zrno pšenice bolo napučené po dobu dvoch až troch h v destilovanej vode pri laboratórnej teplote a naklíčenie prebiehalo v tme pri teplote 25 °C. Po vyklíčení koleoptil na 20 až 25 mm z každej koleoptily bol vyseknutý 3 mm dlhý segment asi 2 mm pod povrchom. Koleoptilové segmenty boli dané na 2 h do destilovanej vody a potom umiestnené po 10 do testovaných roztokov, obsahujúcich 2 % sacharózy. Inkubácia prebiehala za trepania, aby sa predišlo zakrýveniu segmentov. Po 24 h inkubácii pri 25 °C bolo merané predĺženie koleoptil pomocou zväčšovacieho fotografického prístroja. Rozdiely boli vyjadrené v % ku kontrole a preukaznosť bola vypočítaná t-testom. Celý pokus bol robený pri červenom svetle. Roztoky boli riedené v koncentračnej stupnici 10⁻³ až 10⁻¹³ mol l⁻¹, kontrola bola robená v 2 %-nej sacharóze. Biotest je citlivý nielen na auxínové látky, ale aj na inhibičné látky, ktoré predlžovanie segmentov brzdia.

Výsledky regulácie rastu syntetizovaných zlúčenín podľa vynálezu sú uvedené v tabuľke 4.

T a b u l k a 4

Rastovoregulačný účinok syntetizovaných zlúčenín

T a b u l k a 4 pokračovanie

Zlúčenina	Triticum aestivum L.					
	Stimulácia			Inhibícia		
	Δ l/mm	%	C/(mol dm ⁻³)	- Δ l/mm	%	C/(mol dm ⁻³)
I	0,50	9,20	10 ⁻⁷	1,69	31,13	10 ⁻³
II	0,17	3,13	10 ⁻¹¹	1,35	24,87	10 ⁻³
III	0,61	11,23	10 ⁻⁵	1,83	33,71	10 ⁻³
IV	1,10	20,25	10 ⁻⁷	1,85	34,07	10 ⁻³
V	0,25	5,16	10 ⁻⁹	1,06	21,91	10 ⁻³
VI	0,17	3,03	10 ⁻⁵	1,45	25,85	10 ⁻³
VII	0,29	5,99	10 ⁻⁷	1,01	20,87	10 ⁻³
VIII				1,78	31,73	10 ⁻³
IX	0,19	3,92	10 ⁻⁴	0,59	31,73	10 ⁻³
X				1,61	28,70	10 ⁻³
XI				2,38	42,43	10 ⁻³
XII	0,29	5,16	10 ⁻⁴	1,70	30,31	10 ⁻³
XIII	0,49	9,02	10 ⁻⁷	1,81	33,34	10 ⁻³
XIV	0,35	7,23	10 ⁻⁵	1,40	28,93	10 ⁻³
XVI	0,62	12,80	10 ⁻⁴	0,64	13,85	10 ⁻³
IAA	5,93	100,33	10 ⁻⁵	2,77	46,72	10 ⁻³
2,4-D	2,56	51,09	10 ⁻⁵	2,01	40,12	10 ⁻³
CCC				1,75	32,35	10 ⁻³

Ako štandardy boli testované u Vicia Sativa L., cv. Solarka a u Triticum aestivum L. IAA: beta-indolyloctová kyselina, 2,4-D: 2,4-dichlórfenoxyoctová kyselina, CCC: 2-chlóretyltrimetylamóniumchlorid.

Bolo zistené, že syntetizované zlúčeniny podľa vynálezu pôsobením na semená Vicia Sativa L., cv. Solarka v koncentrácii 10⁻³ až 10⁻¹³ mol l⁻¹ spôsobili rozličný rastový efekt. V stimulácii rastu sú zlúčeniny 3-(2-(4-chlórfenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón, 3-(2-(3,4-dichlórfenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón, 3-(2-(4-metoxifyfenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón, 3-(2-(2,4-dimetoxifyfenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón a 3-(2-(4-acetamidofenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón podľa vynálezu porovnateľné so štandardom beta-indolyloctovou kyselinou. Štandardu 2,4-dichlórfenoxyoctovej kyseliny dá sa porovnať 3-(2-(2,4-dimetoxifyfenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón. Inhibičná účinnosť v porovnaní s 2-chlóretyltrimetylamóniumchloridu bola u syntetizovaných zlúčenín podľa vynálezu vyššia okrem 3-(2-(4-acetamidofenyl)vinyl)-2-benzotiazolinónu. Nedosiahli však inhibičné účinky v nižších koncentráciách.

Bolo zistené, že syntetizované zlúčeniny podľa vynálezu sú rôznou mierou účinné aj na Triticum aestivum L.. Preukazná účinnosť bola zistená u 3-(2-(3-nitrofenyl)vinyl)-2-benzotiazolinónu, 3-(2-(4-nitrofenyl)vinyl)-2-benzotiazolinónu a u 3-(2-styrylvinyl)-2-benzotiazolinónu. Zistená inhibičná účinnosť je porovnateľná zo všetkými štandardami.

Vysvetlivky:

- I 3-(2-fenylvinyl)-2-benzotiazolinón
- II 3-(2-(2-nitrofenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón
- III 3-(2-(3-nitrofenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón
- IV 3-(2-(4-nitrofenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón
- V 3-(2-chlórfenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón
- VI 3-(2-(4-chlórfenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón
- VII 3-(2-(3,4-dichlórfenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón
- VIII 3-(2-(2-metoxifyfenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón

- XI 3-(2-(4-metoxyfenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón
 X 3-(2-(2,4-dimetoxifenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón
 XI 3-(2-(4-dimetlyaminofenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón
 XII 3-(2-(4-acetamidofenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón
 XIII 3-(2-(3,4-metylidéndioxyfenyl)vinyl)-2-benzotiazolinón
 XIV 3-(2-furylvinyl)-2-benzotiazolinón
 XV 3-(2-pyridylvinyl)-2-benzotiazolinón
 XVI 3-(2-styrylvinyl)-2-benzotiazolinón
 XVII 3-(2-(5-(4-metylphenyl))-2-furylvinyl)-2-benzotiazolinón

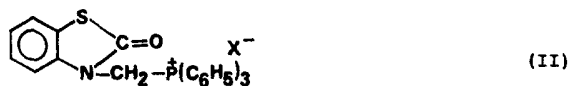
P R E D M E T V Y N Á L E Ž U

1. 3-(2-R-vinyl)-2-benzotiazolinóny obecného vzorce I



kde R znamená fenyl, 2-nitrofenyl, 3-nitrofenyl, 4-nitrofenyl, 2-chlórfenyl, 4-chlórfenyl, 3,4-dichlórfenyl, 2-metoxifenyl, 4-metoxifenyl, 2,4-dimetoxifenyl, 4-dimetylaminofenyl, 4-acetamidofenyl, 3,4-metylidéndioxyfenyl, 2-furyl, 3-pyridyl, 5-(4-metylphenyl)-2-furyl.

2. Spôsob prípravy látok podľa bodu 1 vyznačený tým, že (2-oxo-3-benzotiazolinylmetyl)-trifenylfosfóniumhalogenid vzorca II



kde X⁻ znamená chlór, bróm, jód, reaguje s RCHO, kde R znamená to isté ako vo vzorci I v prostredí bezvodých organických rozpúšťadiel, ako sú metylalkohol, etylalkohol a tetrahydrofurán za prítomnosti trietylaminu, metylátu sodného alebo etylátu sodného pri teplote 64 až 80 °C po dobu 3 až 5 h.