

AKTYWNOŚĆ NOWYCH POCHODNYCH KWASU
2,3-METYLENOFARNEZENOWEGO (TYPU REGULATORÓW
WZROSTU OWADÓW) BADANA U MUCHY DOMOWEJ
(*MUSCA DOMESTICA* L.)

BOGUMIŁA STYCZYŃSKA*, ROMAN STERZYCKI** i WIESŁAW SOBÓTKA**

* Zakład Toksykologii Sanitarnej Państwowego Zakładu Higieny, Warszawa

** Zakład Związków Biologicznie Czynnych Instytutu Chemii Organicznej PAN,
Warszawa

Stwierdzone przez nas uprzednio [1] wystąpienie efektów morfogenetycznych u wybranych gatunków owadów pod wpływem działania pochodnych estrów 2,3-metylenofarnezolu oraz estrów kwasu 2,3-metylenofarnezenowego skłoniły nas do bliższego zbadania aktywności hormonomimetycznej, wobec muchy domowej, kilku nowych połączeń wśród drugiej z wymienionych grup związków.

W syntezie stosowanych do badań związków o działaniu regulatorów wzrostu owadów wykorzystaliśmy farnezol o ponad 80% zawartości izomeru (2E, 6E), który w zmodyfikowanej regioselektywnej reakcji Simmonsa-Smitha przekształciliśmy w 2,3-metylenofarnezol. Został on użyty jako materiał wyjściowy do otrzymania alkoholi 11-alkoksy-2,3-metylenofarnezylowych powstałych w wyniku alkoksyrzędziowania i redukcji przeprowadzonych odpowiednio w alkoholu metylowym i etylowym. Kolejne dwustopniowe utlenienie alkoholi, zachodzące przez pośrednie stadium aldehydu, prowadziło do zfunkcjonalizowanych w pozycji C-11 dwóch kwasów 2,3-metylenofarnezenowych. Estryfikacja ich dokonana za pomocą dwuazometanu, halogenków alkilowych lub cyklopropanometanolu dała dwie grupy estrów 1a-1c i 2a-2c przedstawionych w tabeli 1.

Szczegóły dotyczące syntezy związków 1a-2c zostaną podane oddzielnie [2].

Badania aktywności związków hormonomimetycznych oznaczonych symbolami 1a, 1b, 1c, 2a, 2b, 2c prowadzono testem eliminującym, stosując metodę nanoszenia kontaktowego.

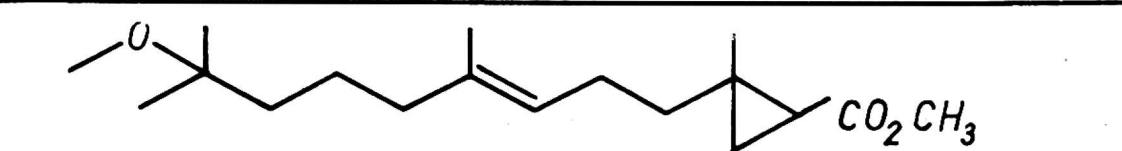
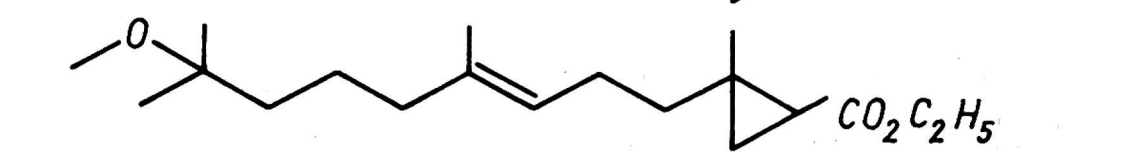
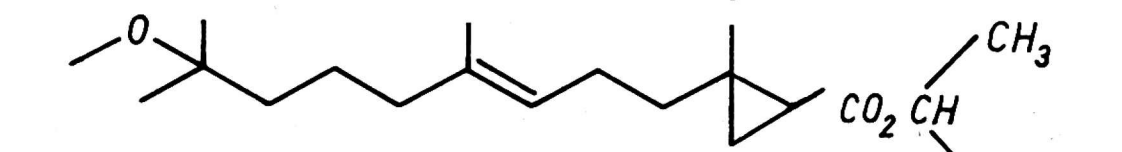
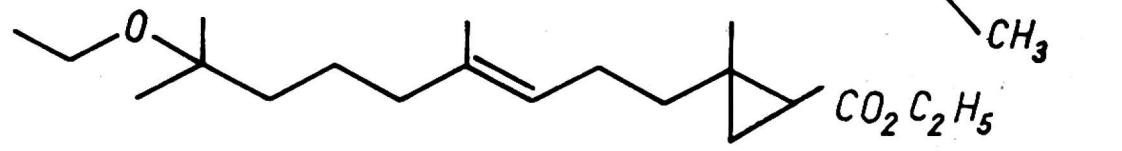
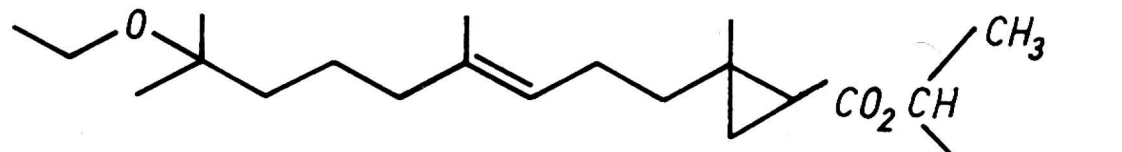
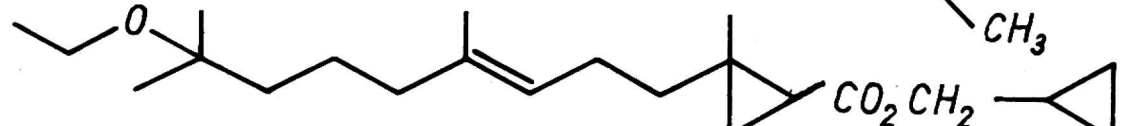

Acetonowe roztwory związków hormonopodobnych w zakresie dawek od 0,0001 do 1 µg/owada nanoszono na larwy w III stadium rozwoju oraz

TABELA 1

Zestawienie estrów kwasów 11-metoksy- i 11-etoksy-2,3-metylenofarnezenowych stosowanych do badania aktywności morfogenetycznej wobec muchy domowej

TABLE 1

Esters of 11-methoxy and 11-ethoxy-2,3-methylenefarnesenic acid used to evaluate the morphogenetic activity against the house-fly

Symbol	Związek — Compound
1 a	 CO_2CH_3
1 b	 $CO_2C_2H_5$
1 c	 $CO_2CH(CH_3)_2$
2 a	 $CO_2C_2H_5$
2 b	 $CO_2CH(CH_3)_2$
2 c	 CO_2CH_2 

na 0-4-godzinne poczwarki much domowych. Stosowano po 5 dawek każdego związku.

Aktywność określano na podstawie zachodzących różnic morfogenetycznych obserwowanych w okresie od podania związku do następnych linii owada. Procenty osobników zdeformowanych i ulegających zahamowaniu w dalszej metamorfozie, nanoszono na papier logarytmiczno-probitowy w celu odczytania ED_{50} — dawki powodującej 50% efektywności danego związku hormonomimetycznego.

Otrzymane wartości ED_{50} dla poszczególnych związków przedstawiono w tabeli 2. Wynika z niej, że wszystkie nowe, zsyntetyzowane związki pochodne kwasu 2,3-metylenofarnezenowego o działaniu podobnym do hormonów juwenilnych, okazały się drobnymi inhibitorami rozwoju much domowych. Szczególnie wysoką aktywnością wyróżniły się dwa związki oznaczone symbolami 2a i 2b, dla których wartości ED_{50} wynosiły odpo-

TABELA 2

Aktywność związków hormonopodobnych wyrażona ED₅₀ w µg/owada wobec muchy domowej *M. domestica* L.

TABLE 2

Activity of hormono-mietic compounds expressed in ED₅₀ in µg/insect against the house-fly *M. domestica* L.

Symbole związków hormonomimetycznych Symbol of hormono- mimetic compounds	Mucha domowa <i>M. domestica</i> L. House-fly <i>M. domestica</i> L.	
	larwy larvae treated	poczwarki pupae treated
<i>1a</i>	0.5	0.001
<i>1b</i>	0.025	0.001
<i>1c</i>	0.01	0.01
<i>2a</i>	0.001	0.00001
<i>2b</i>	0.0001	0.001
<i>2c</i>	0.01	0.1

wiednio dla traktowanej larwy poniżej 0,001 i 0,0001 µg/owada, a dla poczwarki 0,00001 i powyżej 0,0001 µg/owada.

Badane związki wykazywały na ogół wyższą aktywność w odniesieniu do poczwarek aniżeli larw muchy domowej.

Adres autorów:

00-791 Warszawa, Chocimska 24

LITERATURA

1. Styczyńska, B., Kocór, M., Sobótka, W., Sterzycki, R.: *Roczn. PZH*, 25, 363-369, 1974.
2. Kocór, M., Sobótka, W., Sterzycki, R., Styczyńska, B.: Syn-teza i aktywność morfogenetyczna pochodnych 2,3-metyleno-fornezolu i kwasu 2,3-metyleno-farnezenowego. — *Roczn. Chemii*, (w przygotowaniu do druku).

2,3-METHYLENEFARNESENIC ACID DERIVATIVES AS JUVENILE HORMONE ANALOGUES AGAINST THE HOUSE-FLY (*MUSCA DOMESTICA* L.)

by

B. STYCZYŃSKA, R. STERZYCKI AND W. SOBÓTKA

The above-mentioned compounds were tested for biological activity against the house-fly. The acetonic solutions of the assayed compounds were topically applied on the III stage larvae or on 0-4 hr pupae. The doses applied varied from 0.0001

to 1 $\mu\text{l/insect}$. The activity was expressed in ED_{50} units. All compounds tested displayed juvenile hormone activity and showed satisfactory inhibitory action against the house-fly. Two of the assayed compounds, viz. ethyl and isopropyl esters of 11-ethoxy-2,3-methylenefarnesenic acid, possess very high activity (expressed in ED_{50}): 0.001 and 0.0001 for larvae, and 0.00001 and 0.0001 $\mu\text{l/insect}$ for pupae, respectively.