

УДК 632.954 : 547.87

В.В. ШВАРТАУ<sup>1</sup>, Л.М. МИХАЛЬСЬКА<sup>1</sup>, О.І. МАЙБОРОДА<sup>2</sup>, В.М.БРИЦУН<sup>3</sup>

<sup>1</sup>Інститут фізіології рослин і генетики НАН України

<sup>2</sup>Київський національний університет технологій та дизайну

<sup>3</sup>Інститут органічної хімії НАН України

Ел. пошта: [Schwartau@ifrg.kiev.ua](mailto:Schwartau@ifrg.kiev.ua)

## **4-АМІНО-6-R-4,5-ДИГІДРО-3-ФЕНАЦИЛТІО-1,2,4-ТРИАЗИН-5-ОНИ ЯК СИНЕРГІСТИ ГЕРБІЦИДНОЇ ДІЇ ПОХІДНИХ АРИЛОКСИФЕНОКСИПРОПІОНОВОЇ КИСЛОТИ**

Встановлено, що синтезовані нами 4-аміно-6-R-4,5-дигідро-3-фенацилтіо-1,2,4-триазин-5-они є синергістами післясходових грамініцидів класу арилоксифеноксипропіонової кислоти. За гербіцидною дією вони близькі до комерційного гербіциду метрибузину. За механізмом дії отримані сполуки можна віднести до класу інгібіторів фотосинтезу.

*Ключові слова:* Фізіологічно активні речовини, грамініциди, синергізм.

### **ВСТУП**

Інгібітори фотосинтезу широко використовуються в сучасному рослинництві як гербіциди. До цього класу сполук відносяться 3-алкілтіо-4-аміно-4,5-дигідро-6-R-1,2,4-триазин-5-они, наприклад 4-аміно-6-(*трет*-бутил)-4,5-дигідро-3-метилтіо-1,2,4-триазин-5-он (зенкор, метрибузин) [4, 8, 9]. Метрибузин є одним з найбільш активних гербіцидів – інгібіторів фотосинтезу, що, як вважають, зумовлено високим рівнем розчинності препарату в воді (1200 мг/л) і величиною  $pI_{50}$  – 6,5-6,7 [6].

Раніше ми дослідили взаємодію 4-аміно-6-R-2,3,4,5-тетрагідро-3-тіо-1,2,4-триазин-5-онів (**1a,б**) з  $\omega$ -галогенкетонами в лужному середовищі і показали, що продуктами цієї реакції, в залежності від будови замісника R в положенні 6 триазинового кільця, є 4-аміно-6-R-4,5-дигідро-3-фенацилтіо-1,2,4-триазин-5-они (**2a-e**) або 8H-3-(*m*-бутил)-7-феніл-1,2,4-триазино[3,4-*b*]-[1,3,4]тіадіазин-4-он (**3**) [1]. Також було встановлено, що сполукам (**2a-e**) притаманна висока гербіцидна активність і низька токсичність на теплокровних [1].

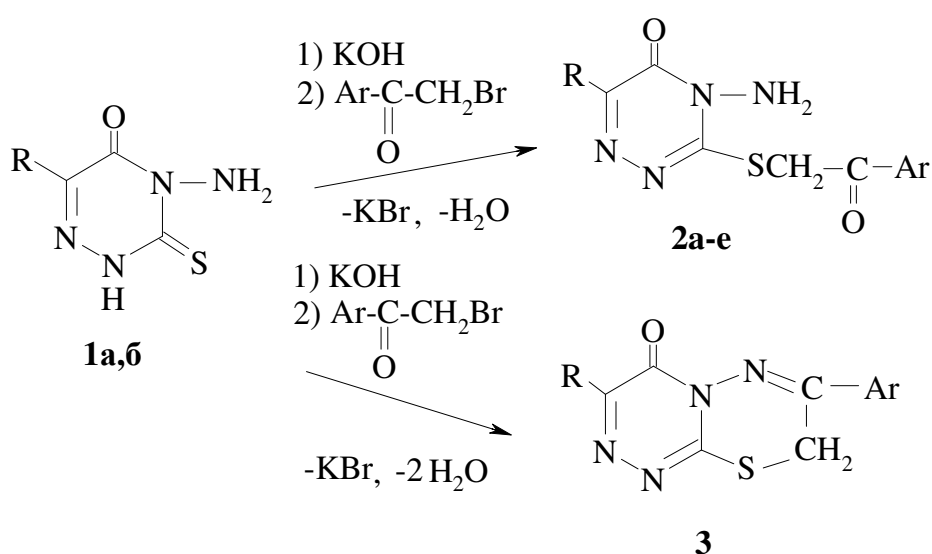


Рис. Структурні формули нових похідних 4-аміно-6-R-2,3,4,5-тетрагідро-3-тіо-1,2,4-триазин-5-ону.

1: R = CH<sub>3</sub> (а), (CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>C (б);

2: R = (CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>C (а), CH<sub>3</sub> (б-е); Ar = *n*-CH<sub>3</sub>OC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (б), 4-НО-3,5-[(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>C]<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>2</sub> (в), *n*-ClC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (а, г), *m*-NO<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (д), C<sub>6</sub>H<sub>5</sub> (е);

3: R = (CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>C, Ar = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>;

Відомо [7], що синергічні суміші гербіцидів представляють інтерес як з теоретичної, так і з суто практичної точки зору.

Метою даної роботи є дослідження впливу 4-аміно-6-R-4,5-дигідро-3-фенацилтіо-1,2,4-триазин-5-онів (**2a-e**) і 8H-3-(*m*-бутил)-7-феніл-1,2,4-триазино[3,4-*b*]-[1,3,4]тіадіазин-4-он (**3**) на фітотоксичність проти злакових після-

ходових гербіцидів класу похідних арилоксифеноксипропіонової кислоти.

### УМОВИ ТА МЕТОДИ ДОСЛІДЖЕНЬ

Досліди проводили згідно методик [2, 5]. Об'єктами дослідження були ячмінь (*Hordeum vulgare* L. *sensu lato*) сорту Одеський 100 та редька олійна (*Raphanus sativus* L.) сорту Радуга як модельні види бур'янів за рівнем чутливості до гербіцидів. Рослини вирощували в вегетаційних умовах на суміші лугового ґрунту та піску у співвідношенні 1:1. Вміст гумусу 1,5 %, рН (KCl) 6,0. Температура повітря вдень – 20-22 °С, вночі – 18-20 °С. Вологість ґрунтової суміші підтримували на рівні 60% від повної вологоємності.

В якості стандарту використовували 95% зенкор виробництва Росії. В дослідах використовували фуроре-супер (фенаксапроп-*n*-етил), масляно-водна емульсія, 69 г/л, фірми Штефес-Агро, Німеччина. Дози наведені за діючою речовиною: зенкор – 0,5 мг/посудину, фенаксапроп – 0,1 мг/посудину. Внесення нових похідних триазину (див. рис.) та зенкору здійснювали до посіву рослин у ґрунт. Сходи рослин обприскували фуроре-супер.

Температури плавлення, спектри ЯМР <sup>1</sup>H, дані елементного аналізу, а також токсичність сполук **2a-e** і **3** наведені в нашій попередній роботі [1].

Рівень фітотоксичності визначали у 14-денних рослин за змінами вмісту маси сухої речовини надземної частини. Результати статистично оброблені за методом [3]. Повторність у досліді 6-кратна.

### РЕЗУЛЬТАТИ ТА ОБГОВОРЕННЯ

Показано, що нові похідні триазинів фітотоксичні, але поступаються за гербіцидною активністю зенкору. Сполука **3** неактивна проти дводольного виду. Обприскування фенаксапропом по фону зенкору зумовило синергічне посилення фітотоксичності суміші. Активність фенаксапропу до одно- та дводольного видів посилювалася по фону сполук **2a**, **2д**, **2e**. Деяке інгібування рівня фітотоксичності спостерігалось по відношенню до

злакового виду по фону сполук **2б-2г**, а до дводольного – по фону сполуки **3**. В подальшому даний антагонізм у взаємодії гербіцидів нівелювався. Найбільш швидко загинули рослини ячменю при застосуванні сумішей сполук **2а, 2д, 3** та зенкору з феноксапропом. Слід відзначити більш високу варіабельність посилення фітотоксичності сумішей триазинів з зенкором на ячмені у порівнянні із посиленням активності сумішей на дводольному виді.

Відомо, що форма ацетил-КоА-карбоксилази, що інгібується грамініцидами, локалізована у пластидах. Інгібування ферменту селективними інгібіторами класу арилоксифеноксипропіонової кислоти блокує синтез жирних кислот на стадії утворення малоніл-КоА та потік вуглецю до мембран. Тому, дослідження гербіцидної активності сумішей R-4,5-дигідро-3-фенацилтіо-1,2,4-триазин-5-онів та грамініцидів мають значення при вивченні взаємозв'язку синтезу ліпідів та фізіологічної активності хлоропластів.

Наведені дані є основою для подальшого спрямованого пошуку гербіцидів та синергістів гербіцидів в класі похідних 4-аміно-6-R-2,3,4,5-тетрагідро-3-тіо-1,2,4-триазин-5-ону.

## ВИСНОВКИ

1. Нові похідні 4-аміно-6-R-4,5-дигідро-3-фенацилтіо-1,2,4-триазин-5-ону є потенційними синергістами протизлакових гербіцидів класу арилоксифеноксипропіонової кислоти. Визначена можливість посилення фітотоксичності сумішей препаратів по відношенню як до однодольних, так і до дводольних однорічних рослин.
2. Встановлено, що похідні 4-аміно-6-R-4,5-дигідро-3-фенацилтіо-1,2,4-триазин-5-они є перспективними для пошуку нових речовин з гербіцидною активністю.

### ЛІТЕРАТУРА

1. Брицун В.М., Швартау В.В., Базавова І.М., Єсипенко А.М., Петренко В.С., Лозинський М.О. Синтез та дослідження гербіцидної активності нових похідних 4-аміно-6-*R*-2,3,4,5-тетрагідро-3-тіо-1,2,4-триазин-5-ону // Журнал органічної та фармацевтичної хімії. – 2004. – **15**, 1(5). – С.35–38.
2. Брицун В.М., Швартау В.В., Петренко В.С., Лозинський М.О. Синтез та дослідження гербіцидної активності арилсульфамідів ізоніпекотинової кислоти // Фізіологічно активні речовини. – 2000. – №2, (30). – С.10–13.
3. Доспехов Б.А. Методика полевого опыта. – М.: Агротехиздат, 1985. – 351 с.
4. Мельников Н.Н. Пестициды. – М.: Химия, 1987. – 660с.
5. Радов А.С., Пустовой И.В., Корольков А.В. Практикум по агрохимии. – М.: Агротехиздат, 1985. – 312 с.
6. Федтке К. Физиология и биохимия действия гербицидов. – М.: Агропромиздат, 1985. – 223 с.
7. Швартау В.В. Регуляція активності гербіцидів за допомогою хімічних сполук. – К.: Логос, 2004. – 223 с.
8. Пат. США 4386953, МКИ C07D 253/06; A01N 043/64. Herbicidally active substituted 6-halogeno-tert.-butyl-1,2,4-triazin-5-ones / Kranz E., Findeisen K., Schmidt R., Eue L. – June 7, 1983.
9. The Pesticide Manual / Ed. C. Tomlin. – United Kingdom: BCPC Publications, 1994. –1350 p.

Таблиця. Вплив нових сполук – інгібіторів фотосинтезу на фітотоксичність феноксапропу

Сполука, 0,5 мг/ посудину	Маса сухої речовини надземної частини рослин, г/посудину			
	без додавання феноксапропу		з додаванням феноксапропу, 0,1 мг/посудину	
	Ячмінь	Редька олійна	Ячмінь	Редька олійна
Контроль	4,1	5,2	1,5	5,3
Зенкор	1,6	1,1	1,2	0,8
2а	3,0	2,0	1,0	2,0
2б	3,0	2,0	1,9	2,4
2в	3,1	2,0	1,9	2,3
2г	3,1	1,9	1,9	1,4
2д	2,9	2,4	1,2	2,3
2е	2,6	2,3	1,4	2,9
3	2,4	5,2	1,2	6,5
НІР <sub>0,95</sub>	0,2	0,2	0,15	0,15

**4-АМИНО-6-R-4,5-ДИГИДРО-3-ФЕНАЦИЛТИО-1,2,4-ТРИАЗИН-5-ОНЫ  
КАК СИНЕРГИСТЫ ГЕРБИЦИДНОГО ДЕЙСТВИЯ ПРОИЗВОДНЫХ  
АРИЛОКСИФЕНОКСИПРОПИОНОВОЙ КИСЛОТЫ**

В.В. Швартау<sup>1</sup>, Л.М. Михальская<sup>1</sup>, О.И. Майборода<sup>2</sup>, В.М. Брицун<sup>3</sup>

<sup>1</sup>Институт физиологии растений и генетики НАН Украины

<sup>2</sup>Киевский национальный университет технологий и дизайна

<sup>3</sup>Институт органической химии НАН Украины

*Эл. почта: [Schwartau@ifrg.kiev.ua](mailto:Schwartau@ifrg.kiev.ua)*

Установлено, что синтезированные нами 4-амино-6-R-4,5-дигидро-3-фенацилтио-1,2,4-триазин-5-оны являются синергистами послевсходовых граминицидов класса арилоксифеноксипропионовой кислоты. По гербицидному действию они близки к коммерческому гербициду зенкору. По механизму действия полученные соединения можно отнести к классу ингибиторов фотосинтеза.

**4-AMINO-6-R-4,5-DIHYDRO-3-PHENACYLTHIO-1,2,4-TRIAZIN-5-ONES  
AS SYNERGISTS OF HERBICIDAL ACTIVITY OF  
ARYLOXYPHENOXYPROPYONIC ACID DERIVATIVES**

V.V. Schwartau<sup>1</sup>, O.I. Mayboroda<sup>2</sup>, V.M. Britsun<sup>3</sup>

It has found, that synthesized 4-amino-6-R-4,5-dihydro-3-phenacetylthio-1,2,4-triazin-5-ones are the synergists of aryloxyphenoxypionate graminicides. New compounds herbicidal activity is close to that of commercial herbicide zencor. The synthesized compounds act as a photosynthesis inhibitors.