

**ДОСЛІДЖЕННЯ ФІТОТОКСИЧНОСТІ
НОВИХ ПОХІДНИХ 4-АМІНО-6-*R*-4,5-ДИГІДРО-3-
ФЕНАЦИЛТІО-1,2,4-ТРИАЗИН-5-ОНІВ ТА
8Н-3-(*т*-БУТИЛ)-7-ФЕНІЛ-1,2,4-ТРИАЗИНО
[3,4-*b*] [1,3,4]ТІАДІАЗИН-4-ОНУ**

В.В. ШВАРТАУ, О.І. МАЙБОРОДА*, В.С. ПЕТРЕНКО**

*Інститут фізіології рослин і генетики ПАН України
*Київський національний університет технологій та дизайну
**Інститут органічної хімії НАН України*

*Установлено, що ряд фізіологічно активних производних 4-аміно-6-*R*-4,5-дигідро-3-фенацилтіо-1,2,4-триазин-5-онів по гербицидній активності ближче до комерційного гербициду зенкору. По механізму дії синтезовані сполучення можна віднести до класу інгібіторів фотосинтезу. Показано, що фітотоксичні производні 4-аміно-6-*R*-2,3,4,5-тетрагідро-3-тіо-1,2,4-триазин-5-онів є синергістами послівсходових грамініцидів класу арилоксифеноксипропіонової кислоти.*

фізіологічно активні речовини, метрибузин, грамініциди, гербицидна активність, синергізм

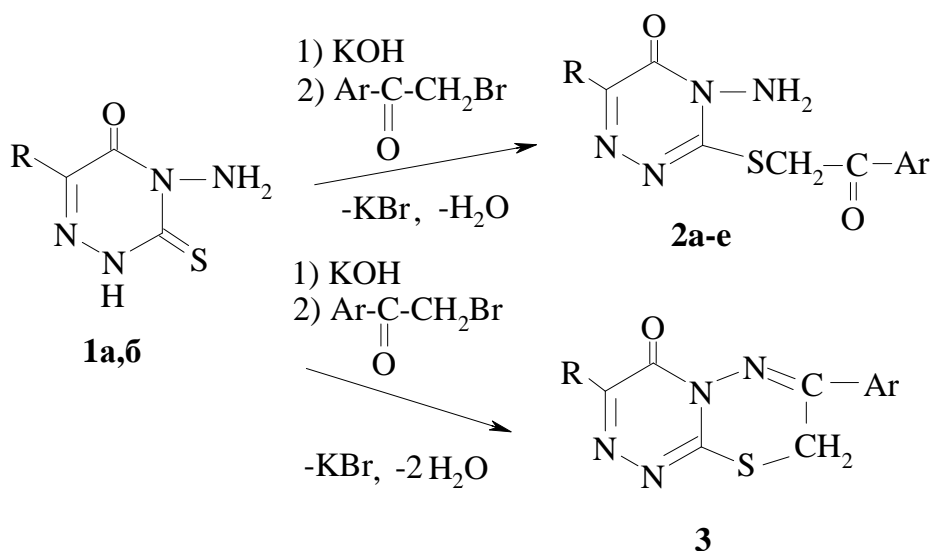
Вступ. Інгібітори фотосинтезу широко використовуються в сучасному рослинництві як гербициди. До цього класу сполучень відносяться 3-алкілтіо-4-аміно-4,5-дигідро-6-*R*-1,2,4-триазин-5-они, наприклад 4-аміно-6-(*трет*-бутил)-4,5-дигідро-3-метилтіо-1,2,4-триазин-5-он (зенкор, метрибузин) [4, 8, 9]. Метрибузин є одним з найбільш активних гербицидів — 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 (1а,б) з ω -галогенкетонами в лужному середовищі і показали, що продуктами реакції залежно 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 (2а-е) або 8Н-3-(*трет*-бутил)-7-феніл-1,2,4-триазіно[3,4-*b*][1,3,4]тіадіазин-4-он (3) [1]. Також було встановлено, що сполукам (2а-е) притаманна висока гербицидна активність і низька токсичність до теплокрівних.

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

Метою даної роботи є дослідження впливу 4-аміно-6-*R*-4,5-дигідро-3-фенацилтіо-1,2,4-триазин-5-онів (2а-е) і 8Н-3-(*трет*-бутил)-7-феніл-1,2,4-триазіно[3,4-*b*] [1,3,4]тіадіазин-4-он (3) на фітотоксичність протизлакових посходових гербицидів класу похідних арилоксифеноксипропіонової кислоти.

Умови та методи досліджень. Досліди проводили згідно з методиками [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 за рівнем чутливості до гербицидів види бур'янів. Рослини вирощували в вегетаційних умовах на суміші лугового ґрунту та піску у співвідношенні 1:1.



1: R = CH₃(a), (CH₃)₃C(б);

2; R - (CH₃)₃C (a), CH₃ (б-е); Ar = *n*-CH₃OC₆H₄ (б), 4-HO-3,5-[(CH₃)₃C]₂C₆H₂ (в), *n*-C₁C₆H₄ (а, г), *m*-NO₂C₆H₄ (д), C₆H₅ (е);

3: R = (CH₃)₃C, Ar - C₆H₅;

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

Вміст гумусу 1,5%, рН (КС1) 6,0. Температура повітря вдень — 20—22°C, вночі — 18—20°C. Вологість ґрунтової суміші підтримували на рівні 60% від повної вологоємності. В якості стандарту використовували 95% зенкор виробництва Росії. В досліді використовували Фуроре-супер (феноксапроп-л-етил), масляно-водна емульсія, 69 г/л, фірми Штефес-Агро, Німеччина. Дози наведені за діючою речовиною: зенкор — 0,5 мг/посулину, феноксапроп — 0,1 мг/посудину. Внесення нових похідних триазину (рис.) та зенкору здійснювали до посіву рослин у ґрунт. Сходи рослин обприскували Фуроре-супер.

Температури плавлення, спектри ЯМР ¹H, дані елементного аналізу, а також токсичність сполук 2а-е 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-разова.

Результати та обговорення. Показано, що нові похідні триазинів фітотоксичні, але поступаються за гербіцидною активністю зенкору. Сполука 3 неактивна проти дводольного виду. Обприскування феноксапропом по фоні зенкору зумовило синергічне посилення фітотоксичності суміші. Активність феноксапропу до одно- та дводольного видів посилювалась по фоні сполук 2а, 2д, 2е. Деяке інгібування рівня фітотоксичності спостерігалось по відношенню до злакового виду по фоні сполук 2б-2г, а до дводольного — по фоні 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 зазначити більш високу варіабельність посилення фітотоксичності сумішей триазинів з зенкором на ячмені порівняно з посиленням активності сумішей на дводольному виді.

Таблиця. Вплив нових сполук — інгібіторів фотосинтезу на фітотоксичність феноксапропу

Сполука, (0,5 мг/ посудину)	Маса сухої речовини надземної частини рослин, г/посудину			
	без 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
Н'Ро,95	0,2	0,2	0,15	0,15

Відомо, що форма ацтил-КоА-карбоксилази, що інгібується грамініцидами локалізована у пластидах. Інгібування ферменту селективними інгібіторами класу арилоксифеноксипропіонової кислоти блокує синтез жирних кислот на стадії утворення мало-ніл-КоА та потік вуглецю до мембран. Тому дослідження гербіцидної активності сумішей К-4,5-дигідро-3-фенацилто-1,2,4-триазін-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-К-2,3,4,5-тетрагідро-3-тіо-1,2,4-триазін-5-ону.

Висновки

1. Нові похідні 4-аміно-6-К-4,5-дигідро-3-фенацилтіо-1,2,4-триазін-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-К-4,5-дигідро-3-фенацилтіо-1,2,4-триазін-5-они є перспективними для пошуку нових речовин з гербіцидною активністю.

Бібліографічний список

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-К-2,3,4,5-тетрагідро-3-тіо-1,2,4-триазін-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. — 660 с.
5. Радов А.С., Пустовой Й.В., Корольков А.В. Практикум по агрохимии. — М.: Агротехиздат, 1985. — 312 с.
6. Федтке К. Физиология 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; AOIN 043/64. Herbicidaly active substituted 6-halogeno-tert.-butyl-1,2,4-triazin-5-ones/ Kranz E.,Findeisen K., Schmidt; K., Eue L. — June 7, 1983.
9. *The Pesticide Manual* / Ed. C. Tomlin.-- United Kingdom: BCPC Publications, 1994. -1350 p.

V.V.Schwartau, O.I. Mayboroda, V.S. Petrenko
SYNTHESIS AND INVESTIGATION ON HERBICIDAL
ACTIVITY OF NEW DERIVATES OF 4-AMINO-6-R-4,5-DIHY-
DRO-3-PHENACYLTHIO-1,2,4-TRIAZIN-5-ONES AND
8H-3-(T-BUTYL)-7-PHENYL-1,2,4-TRIAZIN[3,4-b]-
[1,3,4]THIADIAZIN-4-ONE

It has found, that a number of derivatives of 4-amino-6-R-4,5-dihydro-3-phenacylthio-1,2,4-triazin-5-ones are potent herbicides. New compounds herbicidal activity is close to that of commercial herbicide zen-cor. The synthesized compounds act as a photosynthesis inhibitors. The 4-amino-6-R-2,3,4,5-tetrahydro-3-thio-1,2,4-triazin-5-ones are perspective synergists of aryloxyphenoxypropionate graminicides