

УДК 632.954 : 547.87

ДОСЛІДЖЕННЯ ФІТОТОКСИЧНОСТІ НОВИХ ПОХІДНИХ

4-АМІНО-6-R-2,3,4,5-ТЕТРАГІДРО-3-ТІО-1,2,4-ТРИАЗІН-5-ОНУ

В.В.Швартау Л.В.Озерова, О.І.Майборода*, В.С.Петренко**

Інститут фізіології рослин і генетики НАН України

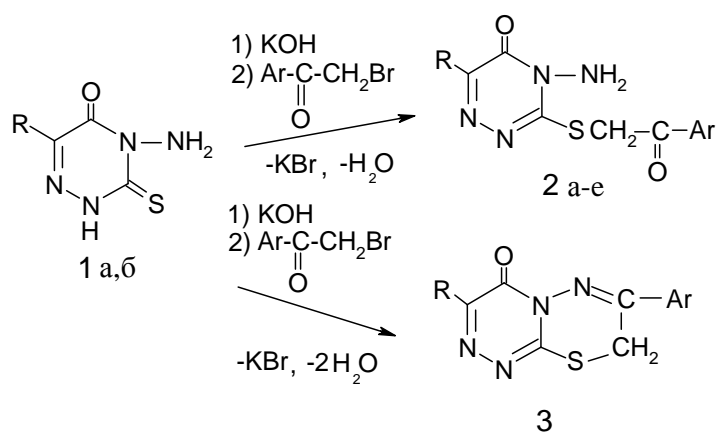
*Київський національний університет технологій та дизайну

**Інститут органічної хімії НАН України

Синтезовано ряд нових похідних 4-аміно-6-R-2,3,4,5-тетрагідро-3-тіо-1,2,4-триазін-5-ону, і знайдено, що вони близькі до метрибузину за гербіцидними властивостями, а також синергічно посилюють фітотоксичність інгібітору ацетил-КоА-карбоксилази – грамініциду феноксапроп-п-етилу.

Гербіциди - інгібітори фотосинтезу широко використовуються в сучасному рослинництві. До цього класу сполук відносяться 3-алкілтіо-4-аміно-4,5-дигідро-6-R-1,2,4-триазін-5-они, наприклад 4-аміно-6-(*трет*-бутил)-4,5-дигідро-3-метилтіо-1,2,4-триазін-5-он (зенкор, метрибузин) [1-3]. 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 [4].

Раніше ми дослідили взаємодію 4-аміно-6-R-2,3,4,5-тетрагідро-3-тіо-1,2,4-триазін-5-онів (**1a,б**) з ω -галогенкетонами в лужному середовищі і показали, що продуктами реакції, в залежності від будови замісника R в положенні б триазинового кільця, є 4-аміно-6-R-4,5-дигідро-3-фенацилтіо-1,2,4-триазін-5-они (**2a-e**) або 8H-3-(*трет*-бутил)-7-феніл-1,2,4-триазіно[3,4-*b*][1,3,4]тіадіазін-4-он (**3**) [5]. Також було встановлено, що сполукам (**2a-e**) притаманна висока гербіцидна активність і низька токсичність для теплокрівних.



- 1: R = CH₃ (а), (CH₃)₃C (б);
 2: R = (CH₃)₃C (а), CH₃ (б-е); Ar = *n*-CH₃OC₆H₄ (б), 4-HO-3,5-[(CH₃)₃C]₂C₆H₂ (в),
n-ClC₆H₄ (а, г), *m*-NO₂C₆H₄ (д), C₆H₅ (е);
 3: R = (CH₃)₃C, Ar = C₆H₅;

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-триазіно[3,4-*b*][1,3,4]тіадіазін-4-ону (**3**) на фітотоксичність протизлакових посходових гербіцидів класу похідних арилоксифеноксипропіонової кислоти.

Відомо [6], що синергічні суміші гербіцидів представляють інтерес як з теоретичної, так і з суто практичної точки зору. Нами показано, що підвищення фітотоксичності феноксапропу при додаванні 4-аміно-6-R-4,5-дигідро-3-фенацилтіо-1,2,4-триазин-5-онів (**2**) спостерігається для всіх фітотоксичних сполук і, передусім, для **2г**, який раніше нами за впливом на зміни рівня варіабельної флюоресценції хлорофілу (F_v/F_{max}) ідентифікований як найбільш активний в досліді інгібітор фотосинтезу [5]. Для сполук, які не мають гербіцидної активності, підвищення фітотоксичності похідного арилоксифеноксипропіонової кислоти не спостерігалось.

Відомо, що ацетил-КоА-карбоксилаза рослин є ключовим ферментом синтезу жирних кислот. 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.

З даних таблиці видно, що досліджувані сполуки в суміші з феноксапропом ефективні переважно для класу однодольних рослин (ячмінь). Найкращий показник має триазин **2a**, який зменшує масу сухої речовини наземної частини ячменю в 3 рази (навіть перевищує дію зенкору). В той же час сполука **2a** а на ріст двудольної рослини не впливає. Триазин **2г** інгібує ріст рослин обох класів, хоча він діє ефективніше на однодольні, чим на дводольні (маса рослин зменшилися відповідно на 1,2 і 0,5 мг).

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-триазін-5-ону.

Експериментальна біологічна частина

Досліди проводили згідно методик [7, 8]. Результати статистично обробені за методом [9]. Повторність 6-кратна.

В якості стандарту використовували технічний 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.

Температури плавлення, спектри ЯМР ¹H, дані елементного аналізу, а також токсичність сполук **2a-e** і **3** наведені в нашій роботі [5].

Висновки

1. Знайдено, що 4-аміно-6-R-4,5-дигідро-3-фенацилтіо-1,2,4-триазін-5-они є синергістами протизлакових гербіцидів класу арилоксифеноксипропіонової кислоти.
2. На наш погляд похідні 4-аміно-6-R-4,5-дигідро-3-фенацилтіо-1,2,4-триазін-5-они є перспективним для пошуку нових речовин з гербіцидною активністю.

Таблиця

Дослідження впливу 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
НІР _{0,95}	0,2	0,2	0,15	0,15

Література

1. Мельников Н.Н. Пестициды - М.: Изд-во "Химия", 1987. - 660 с.
2. Kranz E, Findeisen K., Schmidt R., Eue L. Eur. Pat. 1982. - 49,416 ; *Chem. Abstr.*- 1982. - 97. - 72392e.
3. The Pesticide Manual // Ed. C. Tomlin. - United Kingdom: BCPC Publications, 1994. - P.1350.
4. Федтке К. Физиология и биохимия действия гербицидов. - М.: Агропромиздат, 1985. – 223 с.
5. Брицун В.М., Швартау В.В., Єсипенко А.М., Петренко В.С., Лозинський М.О. // Журнал органічної та фармацевтичної хімії. - 2004.- Т. 2 (Вип.1).- С.35-38.
6. Швартау В.В. Регуляція активності гербіцидів за допомогою хімічних сполук. – К.: Логос, 2004. – 223 с.
7. Брицун В.М., Швартау В.В., Петренко В.С., Лозинський М.О. // Фізіологічно активні речовини. - 2000. - Т.2 (30). - 10-13.
8. Радов А.С., Пустовой И.В., Корольков А.В. Практикум по агрохимии. - М.: Агрохимиздат, 1985. - 312 с..
9. Доспехов Б.А. Методика полевого опыта. - М.: Агрохимиздат, 1985. – 351 с.