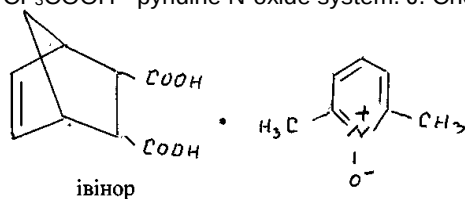
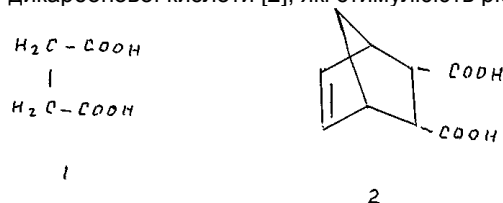


Винахід відноситься до органічної хімії, конкретно до синтезу нового похідного норборн-5-ен-2-карбокси-3-карбоксилат 1-оксид-2,6-диметилпіридину, що виявляє рістрегулюючу активність, наступної формули ^x (x Структурна формула та назва сполуки, що заявляється, наведена з урахуванням новітніх поглядів на основність піридин-1-оксидів, напр. U. Bohmer, G. Zundel. Broad single minimum proton potential in CF₃COOH - pyridine N-oxide system. J. Chem. Soc. 1985, 81 (6), 1425-1434.):

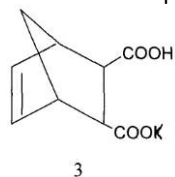


Норборн-5-ен-2-карбокси-3-карбоксилат 1-оксид-2,6-диметилпіридину може бути використаний у біології, сільському господарстві.

В літературі описано використання у сільському господарстві янтарної кислоти [1], норборн-5-ен-2,3-дикарбонової кислоти [2], які стимулюють ріст кореневої частини рослин.



В той же час показано, що інший препарат, норборн-5-ен-2-карбокси-3-карбоксилат калію (нортіол) [3], впливає на коренеутворення більш активно, ніж згадані вище сполуки

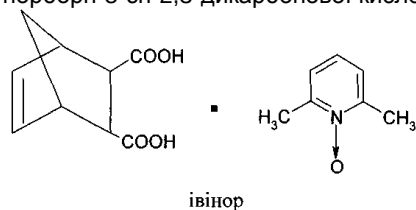


Недоліком наведених вище похідних карбонових кислот є недостатня активність.

Відомо, що 1-оксид-2,6-диметилпіридин [4,5] прискорює розвиток надземної частини рослин, але стимулює ріст коренів в меншій мірі, ніж норборн-5-ен-2-карбокси-3-карбоксилат калію.

Задачею винаходу є створення препарату, який ефективно прискорює ріст як кореневої, так і надземної частини рослин.

Поставлена задача досягається синтезом нової хімічної сполуки, а саме норборн-5-ен-2-карбокси-3-карбоксилату 1-оксид-2,6-диметилпіридину (івіно́ру), який одержується реакцією 1-оксид-2,6-піридину та норборн-5-ен-2,3-дикарбонової кислоти.



Аналогами названої структури є норборн-5-ен-2-карбокси-3-карбоксилат калію та 1-оксид-2,6-диметилпіридин. Спільними ознаками аналогів та сполуки, що заявляється, є норборн-5-ен-2,3-дикарбонової кислоти та 1-оксид-2,6-диметилпіридину, які входять в структуру молекули.

Як еталон обрана α-нафтилоцтова кислота, яку використовують в сільському господарстві для стимуляції коренеутворення при вирощуванні живців плодовогогідних та декоративних рослин.

Сполука, що заявляється, та спосіб її одержання в літературі не описані. Винахід ілюструється наступними прикладами:

Приклад 1. Синтез норборн-5-ен-2-карбокси-3-карбоксилату 1-оксид-2,6-диметилпіридину (івіно́ру).

Суміш 0,36г (0,003моль) 1-оксид-2,6-піридину та 0,55г норборн-5-ен-2,3-дикарбонової кислоти розчиняють в 10мл метанолу, витримують 2год. при кімнатній температурі та випаровують у вакуумі без нагрівання. Залишок кристалізують з ацетону. Вихід 0,55г (60,4 %), Т.топл. 118-119°C. ПМР (бДМСО,м.ч.): 11,794 s (2H, COOH), 7,334 q (3H, Py), 6,104 d (2H, CH=CH), 3,190 d (2H, norb.), 3,003 d (2 H, norb.), 2,364 s (CH₃), 1,303 m (CH₂).

Приклад 2. Лабораторні дослідження рістрегулюючої дії препарату івіно́р на однодольних рослинних тестоб'єктах.

Дія препаратів івіно́р, еталону α-нафтилоцтової кислоти та індивідуальних препаратів івіну та ендикової кислоти вивчалась на рослинах озимої пшениці сорту "Безоста" за методикою Сергєєвої Т.А. [6] на агарі. Наважку 10г агар-агару вносили в 1,0л води, підігрівали до повного розчинення і охолоджували до 35-40°C. Приготований агар-агар доливали в кожну чашку Петрі в кількості 37мл. На застиглий агар-агар в кожну чашку Петрі висівали по 15 зерен пшениці. Дослідні чашки Петрі покривали кришками, розміщували на 3 доби в термостат при температурі 24-26°C. В контрольні чашки Петрі замість речовини вносили по 1мл води. Потім в чашки Петрі добавляли розчин агар-агару. Повторність у дослідах чотирьохкратна. Досліди повторювали тричі.

Далі чашки Петрі з проростками пшениці виймали з термостата і витримували на денному світлі при кімнатній температурі ще протягом 5 діб. Облік результатів здійснювали на дев'ятий день після закладки досліду. Отримані експериментальні дані усереднені і представлені в таблиці 1.

Таблиця 1

Результати лабораторних досліджень препарату
івінон, прототипів та еталонів на рослинах пшениці озимої

№ п/п	Препарат, концентрація (%)	Висота стебла до 1-го листка (%)	Маса сухих речовин коренів (%)	Маса сухих речовин на варіанті (%)
1	Контроль (вода)	100 ^a	100 ^a	100 ^a
2	Івінон: 0,0001	82,8 ^b	112,1 ^b	110,1 ^b
3	Івін: 0,0001	78,9 ^a	83,8 ^a	106,1 ^a
4	Нортіол : 0,0001	97,4 ^a	103,7 ^a	105,2 ^a
5	Ендікова кислота: 0,0001	84,2 ^b	106,6 ^f	102,9 ^a
6	Еталон (α-нафтилоцтова кислота): 0,0001	94,6 ^b	100,2 ^a	102,3 ^a

Примітка. Однаковими буквами позначені варіанти, що не відрізняються при 0,95 рівні значущості.

Приклад 3. Лабораторні дослідження рістрегулюючої дії препарату івінон на дводольних рослинних тестоб'єктах.

Дія препаратів івінон, еталону α-нафтилоцтової кислоти та індивідуальних препаратів івіну та ендікової кислоти вивчалась на рослинах квасолі. Зелені живці квасолі від 10 добових рослин на 12 годин поміщали у водні розчини препарату. Живці переносили на воду, яку міняли через добу. Визначали кількість та довжину коріння. Повторність у досліді шестикратна. Досліди повторяли тричі. Результати приведені в таблиці 2.

Таблиця 2

Результати лабораторних досліджень
препарату івінон, прототипів та еталонів на рослинах квасолі

№ п/п	Препарат, концентрація (%)	Довжина коренів, у % до контролю	Кількість коренів, у % до контролю	Маса сухих речовин коріння, у % до контролю
1	Контроль (вода)	100 ^a	100 ^a	100 ^a
2	Івінон: 0,0001	121 ^b	130 ^b	115 ^b
3	Івін: 0,0001	101 ^a	104 ^a	98 ^a
4	Нортіол: 0,0001	106 ^a	108 ^a	106 ^a
5	Ендікова кислота: 0,0001	98 ^a	103 ^a	96 ^a
6	Еталон (α-нафтилоцтова кислота): 0,0001	98 ^a	94 ^f	97 ^a

Примітка. Однаковими буквами позначені варіанти, що не відрізняються при 0,95 рівні значущості.

Наведені дані (таблиці 2, 3) свідчать про високу рістстимулюючу дію івінону на одно- та дводольних видах рослин у досить низькій концентрації (0,0001%). При цьому дія івінону як стимулятора росту проявляється як на підвищенні вмісту сухих речовин кореневої системи, так і на підвищенні загального вмісту сухих речовин рослин в досліді.

Приклад 4. Токсичність нового препарату івінон, прототипів і еталонних препаратів.

Гостра токсичність препарату івінон вивчалась в лабораторних дослідіах на білих мишах самцях і самках масою 20-22г шляхом перорального введення водних розчинів препарату з допомогою зонда. Облік результатів дослідіу проводився через 24 години з моменту введення речовини. Статистична обробка результатів проводилась за методом Літчфілда і Уїлкоксона в модифікації Рота [7] (таблиця 3).

Таблиця 3

Гостра токсичність нового
препарату івінон, прототипів та еталонів

№	Препарат	ЛД ₅₀ , мг/кг
1	Івінон	3000,0
2	Івін (прототип)	1700 (1400-2050)
3	Нортіол	2950,0
4	Ендікова кислота (прототип)	2850,0
5	α-нафтилоцтова кислота (еталон)	1070 (930-1230)

Таким чином встановлено, що новий препарат івінон являється малотоксичною сполукою для теплокровних тварин і в той же час проявляє високу рістстимулюючу дію на рослинах.

ЛІТЕРАТУРА

1. Применение регуляторов роста в растениеводстве. Справочник-Кишинев: Штиинца.-1981.-160 с.
2. Баскаков Ю.А. Карбоновые кислоты и их производные в качестве регуляторов роста растений. -М.: НИИТЭХИМ- 1981.-26с.

3. Даниленко Г.И., Рейдалова Л.И., Бузаш В.М. и др. Норборн-5-ен-эндо-цис-2-карбокси-3-карбоксилаты калия, натрия и аммония, обладающие рострегулирующей активностью. -А.с. СССР 1571984.-15.02.1990.
4. Мельников Н.Н., Новожилов К.В., Белан С.Р. и др. Справочник по пестицидам. -М.: Химия, 1985.-352с.
5. Кухарь В.П., Карабанов Ю.В., Павленко А.Ф. и др. Новый регулятор роста растений - ивин // Физиологически активные вещества.- 1986, вып. 18.-С.3-14.
6. Сергеева Т.А. Методика лабораторных испытаний гербицидов // Защита растений.-1963- №2.-С.42-43.
7. Беленький М.Л. Элементы количественной оценки фармакологического эффекта. -Л.: Медгиз, 1963-95с.