



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 75280

(13) C2

(51) МПК (2006)

C07C 13/42

C07C 61/28

C07D 213/89

A01P 21/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД**(54) НОРБОРН-5-ЕН-2-КАРБОКСИ-3-КАРБОКСИЛАТ 1-ОКСИД-2,6-ДИМЕТИЛПІРИДИНУ(ІВІНОР) - СТИМУЛЯТОР РОСТУ ТА РОЗВИТКУ РОСЛИН**

1

(21) 20040907390

(22) 09.09.2004

(24) 15.03.2006

(46) 15.03.2006, Бюл. № 3, 2006 р.

(72) Петренко Володимир Степанович, Даниленко Георгій Іванович, Яворовський Петро Петрович, Швартау Віктор Валентинович, Лисенко Віктор Павлович, Гужова Світлана Василівна, Озерова Лідія Володимирівна, Лозинський Мирон Онуфрійович

(73) ІНСТИТУТ ОРГАНІЧНОЇ ХІМІЇ НАН УКРАЇНИ

(56) Кухарь В.П., Карабанов Ю.В. и др. Новый регулятор роста растений - ивин//Физиологически активные вещества. - 1986, вып. 18, с. 3-14

2

SU 1735286 A1, 23.05.1992

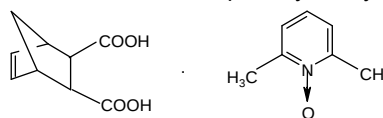
UA 17832, 03.06.1997

DE 100 06 694 A1, 16.08.2001

US 4 622 339, 11.11.1986

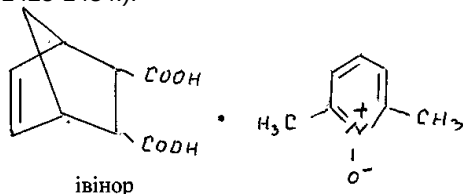
US 4 649 214, 10.03.1987

(57) Норборн-5-ен-2-карбокси-3-карбоксилат 1-оксид-2,6-диметилпіридину наступної структури:



як стимулятор росту та розвитку рослин.

Винахід відноситься до органічної хімії, конкретно до синтезу нового похідного норборнану, норборн-5-ен-2-карбокси-3-карбоксилат 1-оксид-2,6-диметилпіридину, що виявляє рістрегулюючу активність, наступної формули ^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.):



івінор

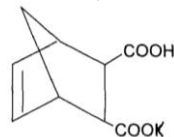
Норборн-5-ен-2-карбокси-3-карбоксилат 1-оксид-2,6-диметилпіридину може бути використаний у біології, сільському господарстві.

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



3

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.

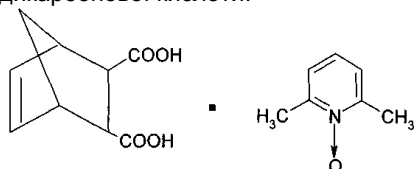
(13) C2

(11) 75280

(19) UA

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-єн-2-карбокси-3-карбоксилату 1-оксид-2,6-диметилпіридину (івінору), який одержується реакцією 1-оксид-2,6-піридину та норборн-5-єн-2,3-дикарбонової кислоти.



івінору

Аналогами названої структури є норборн-5єн-2-карбокси-3-карбоксилат калію та 1-оксид-2,6-диметилпіридин. Спільними ознаками аналогів та сполуки, що заявляється, є норборн-5-єн-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 плодоягідних та декоративних рослин.

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

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

Суміш 0,36г (0,003моль) 1-оксид-2,6-піридину

та 0,55г норборн-5-єн-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 (δ ДМСО,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 івінору на однодольних рослинних тестоб'єктах.

Дія препаратів івінору, еталону α -нафтилоцтової кислоти та індивідуальних препаратів івіну та ендікової 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 досліді чотириохкратна. 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 досліді. Отримані експериментальні дані усереднені і представлені в таблиці 1.

Таблиця 1

Результати лабораторних досліджень препарату івінору, 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	Івінору: 0,0001	82,8 ^o	112,1 ^o	110,1 ^o
3	Івін: 0,0001	78,9 ^b	83,8 ^a	106,1 ^b
4	Нортіол : 0,0001	97,4 ^a	103,7 ^a	105,2 ^b
5	Ендікова кислота: 0,0001	84,2 ^o	106,6 ^r	102,9 ^a
6	Еталон (α -нафтилоцтова кислота): 0,0001	94,6 ^o	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 івінору на дводольних рослинних тестоб'єктах.

Дія препаратів івінору, еталону α -нафтилоцтової кислоти та індивідуальних препаратів івіну та ендікової кислоти вивчалась на рос-

линах 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 повторили тричі. Результати приведені в таблиці 2.

Таблиця 2

Результати лабораторних досліджень
препарату івінор, 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	Івінор: 0,0001	121 ^b	130 ^b	115 ^b
3	Івін: 0,0001	101 ^a	104 ^a	98 ^a
4	Нортіол: 0,0001	106 ^b	108 ^b	106 ^b
5	Ендікова кислота: 0,0001	98 ^a	103 ^a	96 ^a
6	Еталон (α-нафтилоцтова кислота): 0,0001	98 ^a	94 ⁱ	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 івінору на одно- та дводольних видах рослин у досить низькій концентрації (0,0001%). При цьому дія івінору як стимулятора росту проявляється як на підвищенні вмісту сухих речовин кореневої системи, так і на підвищенні загального вмісту сухих речовин рослин в дослідках.

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

Гостра токсичність препарату івінор вивчалась в лабораторних дослідках на білих мишах самцях і самках масою 20-22г шляхом перорального введення водних розчинів препарату з допомогою зонда. Облік результатів дослідів 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 івінор, прототипів та еталонів

№	Препарат	ЛД ₅₀ , мг/кг
1	Івінор	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 івінор 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. Бельский М.Л. Элементы количественной оценки фармакологического эффекта. -Л.: Медгиз, 1963-95с.