



СОЮЗ СОВЕТСКИХ
СОЦИАЛИСТИЧЕСКИХ
РЕСПУБЛИК

ДЛЯ СЛУЖЕБНОГО ПОЛЬЗОВАНИЯ ЭКЗ № 000068

№ SU (11) 1702635 A1

(51)5 С 07 С 227/02, 229/36,
А 01 N 37/06

ГОСУДАРСТВЕННЫЙ КОМИТЕТ
ПО ИЗОБРЕТЕНИЯМ И ОТКРЫТИЯМ
ПРИ ГНТ СССР

ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

И АВТОРСКОМУ СВИДЕТЕЛЬСТВУ

1

2

(21) 4741197/04

(22) 26.07.89

(71) Днепропетровский химико-технологический институт и Институт химической физики АН СССР

(72) А.В.Присяник, А.С.Москаленко, К.В.Янова, Л.И.Баранова и Р.Г.Костяновский

(53) 547.233.07(088.8)

(56) Патент Японии № 62-164064, кл. С 07 С 69/593, 1976.

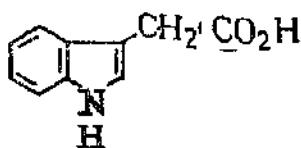
Шамшури А.А., Кример М.З. Физико-химические свойства пестицидов. - Справочник, М., Химия, 1976.

(54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ ИНГИБИТОРА ПРОРАСТАНИЯ СЕМЯН ГОРОХА, ОВСА, КУКУРУЗЫ

(57) Изобретение относится к аминокислотам, в частности к получению К-соли α -метил-амино- β -метоксикарбониллакриловой кислоты - ингибитора прорастания семян гороха, овса и кукурузы, и может быть использовано в сельском хозяйстве. Цель - повышение активности ингибитора. Синтез ведут реакцией эквимольных количеств диметилового эфира метиламинофумаровой кислоты и гидроксидов калия в метаноле. Полученный ингибитор замедляет рост корней и стеблей на 20-70%. 1 табл.

Изобретение относится к области сельского хозяйства, а именно к способу получения ингибитора для прорастания семян гороха, овса и кукурузы.

Для подавления роста бобовых применяют холин и его соли. Известно применение в качестве средства для ингибирования роста растений β -индолилуксусной кислоты (гетероауксин, ИУК) формулы



Недостатком этого средства является низкая ростингибирующая активность на семена гороха, высокая токсичность для теплокровных (ЛД₅₀ гетероауксина для белых мышей составляет 250-

48-91

450 мг/кг), сложность технологии производства.

Целью изобретения является повышение активности ингибитора и уменьшение его токсичности.

Пример 1. К раствору 16,3 г (0,1 моль) диметилового эфира метиламинофумаровой кислоты в 10 мл метанола приливают раствор 5,6 г (0,1 моль) едкого кали в 30 мл метанола, взбалтывают и оставляют стоять при комнатной температуре в течение 1 ч. Выпавший осадок фильтруют и кристаллизуют из метанола. Выход продукта 14,0 г (71%). Получают продукт в виде бесцветных мелких игол с т.пл. 241°C.

C₆H₈NO₄K. Мол.мас. 197,236.
Найдено, %: С 36,72; Н 4,12;
К 6,96.



№ SU (11) 1702635 A1

Вычислено, %: С 36,54; Н 4,09;
П 7,10.

Спектр ПМР¹H снят в CD₃OD на спектрометре Bruker WP 401, частота 400 Гц, внутренний стандарт ГМДС.

Спектр ПМР, δ , м.д.:
П СН₃, 2,68 (с.); СО₂СН₃ 3,55 (с.);
Н-С=4,30 (с.).

Пример 2. Изучение ростингибирующей активности описываемого вещества при прорастании семян гороха.

Опыты проводят в чашках Петри, на дно которых укладывают круги фильтровальной бумаги. В каждую чашку вносят по 5 мл испытуемых растворов определенной концентрации, на поверхность обработанной фильтровальной бумаги помещают по 10-25 семян. Повторность опытов трехкратная. Контролем служит вариант опыта без обработки веществами, в качестве эталонов взяты широко применяемые в сельском хозяйстве гетероауксин эталон ИУК, хлорхолинхлорид эталон ТУР. Опытные чашки Петри выдерживают в вытяжном шкафу при 21-23°C с подсветкой люминесцентными лампами в течение 5-10 дней, после чего производят замеры длины корней и стеблей опытных растений. Ошибка средней арифметической величины опытов не превышает 1,3%.

Препарат применяют в виде водного раствора в концентрациях 0,01-0,001%.

Пример 2. Изучение ростингибирующей активности препарата при прорастании семян овса.

Препарат применяют в виде водного раствора в концентрациях 0,001-0,0001%.

Опыты проводят по п. 2. Учет данных проводят на 10 сут. Результаты опытов представлены в таблице.

Пример 3. Изучение ростингибирующей активности препарата при прорастании семян кукурузы.

Препарат применяют в виде водного раствора в концентрациях 0,001-0,0001%.

Опыты проводят по п. 2. Учет данных проводят на 7-е сутки. Результаты опытов представлены в таблице.

Пример 4. Изучение токсичности ингибитора, получаемого по описываемому способу.

Токсичность для теплокровных ингибитора определяют стандартным методом на мышах и крысах (самках и самцах) путем однократного внутрижелудочного введения в организм животных. Учет гибели животных производят через 24 часа после введения в желудок. Результаты опытов представлены в виде среднесмертной дозы препарата (ЛД₅₀). Статистическую обработку проводят методом Литчфильда и Уилкоксона в модификации Рота.

В результате проведенных испытаний установлено, что препарат при однократном внутрижелудочном поступлении в организм теплокровных относится к малотоксичным веществам ЛД₅₀ для мышей и крыс >1000 мг/кг.

В высоких концентрациях (50% раствор) препарат обладает местнораздражающим действием на кожу и кожно-резорбтивным эффектом.

В концентрациях ниже 10% препарат не оказывает местно-раздражающего действия на слизистые оболочки и кожу. Таким образом, ингибитор, получаемый по описываемому способу ингибирует рост корней и стеблей гороха, овса и кукурузы на 20-70% больше по сравнению с известными эталонами ТУР и ИУК.

Ф о р м у л а и з о б р е т е н и я

Способ получения ингибитора прорастания семян гороха, овса, кукурузы, отличающийся тем, что, с целью повышения активности ингибитора, диметиловый эфир метиламинофумаровой кислоты подвергают взаимодействию с гидроксидом калия в метаноле..

Ростингибирующая активность вещества, получаемого по описываемому способу
на 7 сут

Вариант	Концентрация, %	Длина частей растений			
		см		% к контролю	
		корень	стебель	корень	стебель
На горохе					
Описываемый ингибитор	0,1	0,25	0,7	50±0,5	50±0,3
	0,001	0,30	1,1	60±0,4	79±0,4
	0,0001	0,50	1,5	100±0,6	107±0,5
Эталон-	0,01	0,45	1,2	90±0,3	86±0,7
ТУР	0,001	0,45	1,3	90±0,4	93±0,6
	0,0001	0,50	1,5	100±0,5	107±0,6
Эталон-	0,01	0,35	0,8	70±0,2	60±0,7
ИУК	0,001	0,45	1,2	90±0,4	86±0,9
	0,0001	0,64	1,9	128±0,5	136±1,2
Контроль	-	0,50	1,4	100	100
На овсе					
Описываемый ингибитор	0,01	2,3	2,1	45±0,3	54±0,3
	0,001	2,7	2,4	54±0,3	62±0,3
	0,0001	3,4	3,3	67±0,3	85±0,5
Эталон-	0,01	3,4	2,6	67±0,5	66±0,3
ТУР	0,001	4,7	3,4	92±0,5	87±0,3
	0,0001	4,8	3,8	94±0,7	98±0,6
Эталон-	0,01	2,4	2,2	47±0,3	56±0,4
ИУК	0,001	3,0	2,5	59±0,4	64±0,5
	0,0001	4,5	3,5	88±0,6	90±0,5
Контроль	-	5,1	3,9	100	100
На кукурузе					
Описываемый ингибитор	0,01	2,4	0,2	54±0,2	29±0,5
	0,001	2,9	0,2	66±0,2	29±0,5
	0,0001	3,5	0,3	80±0,4	43±0,6
Эталон-	0,01	3,2	0,4	73±0,7	57±0,5
ТУР	0,001	4,2	0,6	95±1,0	86±0,4
	0,0001	4,3	0,6	98±0,6	86±0,9
Эталон-	0,01	2,4	0,5	54±0,2	71±0,3
ИУК	0,001	3,5	0,5	80±0,2	71±0,3
	0,0001	3,7	0,5	84±0,2	86±0,3
Контроль	-	4,4	0,7	100	100

Редактор Л. Герасимова Составитель Л. Иоффе
Техред М. Дидык Корректор Л. Пилипенко

Заказ 4580/ДСП

Тираж

Подписное

ВНИИТИ Государственного комитета по изобретениям и открытиям при ГКНТ СССР
113035, Москва, Ж-35, Раушская наб., д. 4/5

Производственно-издательский комбинат "Патент", г. Ужгород, ул. Гагарина, 101

