



СОЮЗ СОВЕТСКИХ  
СОЦИАЛИСТИЧЕСКИХ  
РЕСПУБЛИК

для служебного пользования экз. № 00101

(19) **SU** (11) **1513863** **A1**

(51) 4 C 07 D 249/14, A 01 N 43/64

ГОСУДАРСТВЕННЫЙ КОМИТЕТ  
ПО ИЗОБРЕТЕНИЯМ И ОТКРЫТИЯМ  
ПРИ ГНТ СССР

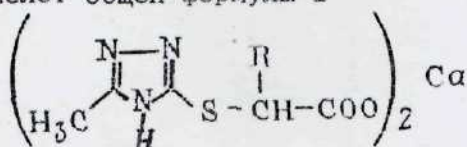
# ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

## К АВТОРСКОМУ СВИДЕТЕЛЬСТВУ

1  
(21) 4388979/23-04  
(22) 01.02.88  
(71) Запорожский медицинский институт и Украинская опытная станция масличных культур  
(72) И.А.Мазур, Е.Г.Кныш, Л.Г.Черковская, В.П.Георгиевский, В.Р.Стец, П.Д.Щербак, Д.И.Никитчин и Н.Д.Зленко  
(53) 547.792.3 (088.8)  
(56) Авторское свидетельство СССР № 1455612, кл. C 07 D 249/14, 1987.

2  
(54) КАЛЬЦИЕВЫЕ СОЛИ 3-МЕТИЛ-1,2,4-ТРИАЗОЛИЛ-5- $\alpha$ -ТИОКАПРОНОВОЙ ИЛИ 3-МЕТИЛ-1,2,4-ТРИАЗОЛИЛ-5- $\alpha$ -ТИОМАСЛЯНОЙ КИСЛОТ, ОБЛАДАЮЩИЕ РОСТСТИМУЛИРУЮЩЕЙ АКТИВНОСТЬЮ В ОТНОШЕНИИ СЕМЯН ПОДСОЛНЕЧНИКА  
(57) Изобретение касается замещенных гетероциклических веществ, в частности Са-солей 3-метил-1,2,4-триазолил-5- $\alpha$ -тиокапроновой (или тиомасляной) кислот, обладающих рострегулирующей активностью в отношении семян подсолнечника, что может быть использовано в сельском хозяйстве. Цель - создание более активных веществ указанного класса. Синтез ведут нагреванием СаСО<sub>3</sub> и соответствующей кислоты в среде воды до прекращения выделения СО<sub>2</sub>. Выход, %: т.пл., °С, brutto-ф-ла, а) 81, 193-195°С, С<sub>18</sub>Н<sub>28</sub>Н<sub>6</sub>С<sub>2</sub>О<sub>4</sub>Са, б) 97,7, 170-172, С<sub>14</sub>Н<sub>20</sub>Н<sub>6</sub>С<sub>2</sub>О<sub>4</sub>Са. Новые вещества активнее аналогов на 78 и 12%. 1 табл.

Изобретение относится к сельскому хозяйству, в частности к новым биологически активным соединениям, а именно к кальциевым солям 3-метил-1,2,4-триазолил-5- $\alpha$ -тиокапроновой и 3-метил-1,2,4-триазолил-5- $\alpha$ -тиомасляной кислот общей формулы I



где I а) R-C<sub>4</sub>H<sub>9</sub>=н,  
I б) R-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>,

37-89

обладающим ростстимулирующей активностью в отношении семян подсолнечника.

Предлагаются новые производные 1,2,4-триазола, обладающие повышенной ростстимулирующей активностью в отношении семян подсолнечника по сравнению со структурными аналогами.

Следующие примеры иллюстрируют способ получения новых соединений.

Пример 1. Кальцевая соль 3-метил-1,2,4-триазолил-5- $\alpha$ -тиокапроновой кислоты.

**РПФ**

(19) **SU** (11) **1513863** **A1**



Смесь 4,5 г (0,02 моль) 3-метил-1,2,4-триазалил-5- $\alpha$ -тиокапроновой кислоты и 1,0 г (0,01 моль) безводного карбоната кальция в 30 мл воды нагревают до прекращения выделения пузырьков газа ( $\text{CO}_2$ ). Раствор фильтруют, фильтрат упаривают на кипящей водяной бане. Образовавшийся осадок сушат, перекристаллизовывают из 20 мл этанола.

Выход 3,86 г (81%). Белый кристаллический порошок, растворим в воде, этаноле, нерастворим в гексане, эфире, температура разложения (т.разл.) 193-195°C.

Найдено, %: С 43,4, Н 5,5, N 16,7, S 12,16.

$\text{C}_{18}\text{H}_{28}\text{N}_6\text{S}_2\text{O}_4\text{Ca}$ .

Вычислено, %: С 43,5, Н 5,7, N 16,9, S 12,9.

ИК-спектр: 4150  $\text{cm}^{-1}$  (NH), 1725  $\text{cm}^{-1}$  (CO).

Пример 2. Кальциевая соль 3-метил-1,2,4-триазалил-5- $\alpha$ -тиомасляной кислоты.

Смесь 4,0 г (0,02 моль) 3-метил-1,2,4-триазалил-5- $\alpha$ -тиомасляной кислоты и 1,0 г (0,01 моль) безводного карбоната кальция в 30 мл воды нагревают до прекращения выделения пузырьков газа ( $\text{CO}_2$ ). Раствор фильтруют, фильтрат упаривают на кипящей водяной бане. Образовавшийся маслообразный продукт затирают смесью ацетона и эфира в соотношении 2:1. Выделенный продукт сушат и перекристаллизовывают из этанола.

Выход 4,3 (97,7%). Белые кристаллы, растворимы в воде, этаноле, нерастворимы в гексане, эфире, т.разл. 170-172°C.

Найдено, %: С 38,0, Н 4,6, N 18,9, S 14,3.

$\text{C}_{14}\text{H}_{20}\text{N}_6\text{S}_2\text{O}_4\text{Ca}$ .

Вычислено, %: С 38,2, Н 4,68, N 19,1, S 14,5.

ИК-спектр: 4050  $\text{cm}^{-1}$  (NH), 1720  $\text{cm}^{-1}$  (CO).

ЛД<sub>50</sub> предлагаемых соединений равна (ЛЕ-148) - 1500 (1200-1900) мг/кг,

(ЛЕ-149) - 1480 (1000-2100) мг/кг, а ЛД<sub>50</sub> прототипа (ТЕ-49) - 1020 (790-1370) мг/кг.

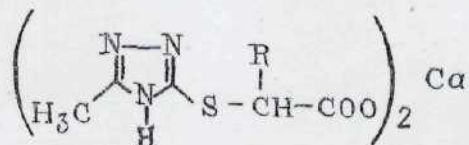
Для изучения ростстимулирующей активности новых соединений в отношении семян подсолнечника были проведены испытания по следующей методике.

В качестве объекта исследования были взяты пять групп семян подсолнечника (по 30 семян в каждой группе). Семена трех групп помещают в 0,001%-ный раствор исследуемых соединений (см. таблицу) и после обильного смачивания оставляют на 2 ч для томления. Семена четвертой группы аналогично обрабатывают в 0,001%-ным раствором дифенилмочевины, а пятой группы - водой. Затем семена помещают на влажную фильтровальную бумагу в чашки Петри и проращивают в термостате при 15-17°C. Через 7 сут измеряют длину проростка от гипокотилия до семядолей. Результаты исследований представлены в таблице.

Представленные данные свидетельствуют о том, что новые соединения I а и I б по силе ростстимулирующей активности превосходят ближайший структурный аналог на 78 и 12% соответственно.

#### Ф о р м у л а и з о б р е т е н и я

Кальциевые соли 3-метил-1,2,4-триазалил-5- $\alpha$ -тиокапроновой или 3-метил-1,2,4-триазалил-5- $\alpha$ -тиомасляной кислот общей формулы



где I а) R -  $\text{C}_4\text{H}_9$ =н,  
б) R -  $\text{C}_2\text{H}_5$ ,

обладающие ростстимулирующей активностью в отношении семян подсолнечника.

Соединение	Ростстимулирующая активность, длина проростка от шпкотиля до семядолей	
	мм	%
I а	68,3 ± 0,8	226
I б	48,3 ± 1,2	160
Структурный аналог - 1-(β-фенилэтил)-4-[3- -(5-нитро-2-фурил)- аллилиденамино]-1,2-4- триазолийбромид	44,7 ± 0,6	148
Дифенилмочевина	31,4 ± 0,7	104
Вода (контроль)	30,2 ± 1,2	100

Редактор Е.Хорина      Составитель Г.Коннова  
 Техред М.Дидык      Корректор В.Кабаций

Заказ 1893/ДСП      Тираж 181      Подписное

ВНИИПИ 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

