



УКРАЇНА

(19) UA (11) 56467 (13) A

(51) 7 C07D487/10, A01N43/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ДЕКЛАРАЦІЙНОГО ПАТЕНТУ
НА ВИНАХІДВИДАЄТЬСЯ ПІД
ВІДПОВІДАЛЬНІСТЬ
ВЛАСНИКА
ПАТЕНТУ

(54) ІМУНОМОДУЛЯТОР

1

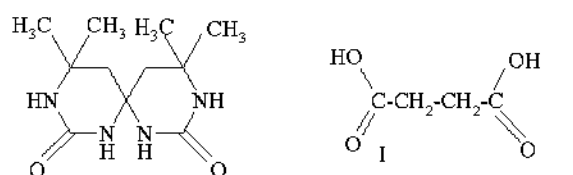
2

(21) 2002064553

(22) 04 06 2002

(24) 15 05 2003

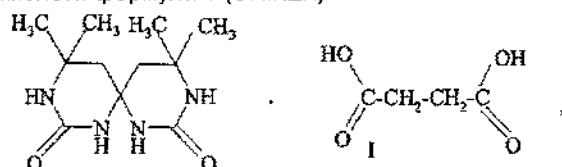
(46) 15 05 2003, Бюл №5, 2003 р

(72) Єресько Володимир Андрійович, Сніговий
Володимир Семенович(73) ІНСТИТУТ ЗЕМЛЕРОБСТВА ПІВДЕННОГО
РЕГІОНУ УКРАЇНСЬКОЇ АКАДЕМІЇ АГРАРНИХ
НАУК(57) Моносіль 6,6,6¹,6¹-тетраметил-2,2¹-діоксо-4,4¹-
спіробі(гексагідропіримідину) янтарної кислоти
(спікел) формули I

яка стимулює імунну систему рослин

Винахід відноситься до сільськогосподарства, а саме, до застосування органічних сполук для стимуляції імунної системи рослин. Аналогом по дії є імуноцитопіт, який володіє захисною, лікувальною та системною активністю з вираженим рострегулюючим ефектом (патенти Росії 2075933, 2075934 від 27 03 1997р). До певних вад цього препарату потрібно віднести не технологічність виробництва та особливі умови збереження, а також нижчі показники по приросту урожаю с/г рослин. Відомо сполука 6,6,6¹,6¹-тетраметил-2,2¹-діоксо-4,4¹-спіробі(гексагідропіримідин), має вищу рострегулюючу активність до зернових (А с 1628255 від 15 10 1990р), проте вона не підвищує стійкість до захворювань.

Задачею винаходу є пошук нових сполук у ряду азотмістких гетероциклів, які стимулюють імунну систему рослин. Ця задача досягається новою сполукою - моносіллю 6,6,6¹,6¹-тетраметил-2,2¹-діоксо-4,4¹-спіробі(гексагідропіримідин) янтарної кислоти формули 1 (СПІКЕЛ)



яка стимулює імунну систему рослин

Це приводить до того, що покращуються такі показники як енергія росту, підвищення схожості

та стійкість до захворювань від мікробів та грибків.

Цю сполуку одержують взаємодією 6,6,6¹,6¹-тетраметил-2,2'-діоксо-4,4¹-спіробі(гексагідропіримідин) (2) з янтарною кислоту (3) у органічному розчині при t – 25 - 80°C. Ця сполука представляє собою безколірну, кристалічну речовину, розчинну у воді та спирті, тяжко розчинну у ацетоні, ефірі, хлороформі. Дослиди на рослинах проводились в інституті землеробства південного регіону УААН у 1997-2001рр. Нижче доведені приклади які ілюструють запропонований імуномодулятор.

Приклад 1. До розчину 11,8г (0,1Моль) препарату 3 у 100мл ацетону при кімнатній температурі та перемішуванні додають 25,8г (0,1Моль) препарат 2. Через добу осадок 1 відфільтровують та перекристалізують із спирту. Вихід 33,48г (93,2%), т пл 223 - 225°C. Знайдено % С - 50,11, Н - 7,20, N - 15,46 C₁₇H₂₆N₄O₆.

Обчислено % С - 50,27, Н - 7,31, N - 15,63

Приклад 2. До розчину 11,8г (0,1 Моль) препарату 3 у 100мл ацетону при кипінні додають 25,8г (0,1Моль) препарат 2. Реакційну суміш кип'ятять 30 хвилин і зоставляють на ніч. Осадок 1 відфільтровують та перекристалізують із спирту. Вихід 35г (97%) Т пл 223 - 225°C. Речовина не дає депресії у змішаній пробі плавлення зі зразком, отриманим у прикладі 1.

Приклад 3. До розчину 11,8г (0,1Моль) препарату 3 у 100мл спирту при перемішуванні добав-

(13) A

(11) 56467

(19) UA

ляють 25,8г (0,1Моль) препарату 2 Потім реакційну суміш доводять до кипіння та зоставляють на ніч Осадок 1 відфільтровують та перекристалізують із спирту Вихід 34,6г (96,9%) Тпл 223 - 225°C Речовина не дає депресії у змішаній пробі плавлення зі зразком, отриманим у прикладі 1

Приклад 4 Вплив імуномодулятора (спікел) на врожай озимої пшениці

Дослід польовий, методика загальноприйнята, об'єкт дослідження озима пшениця сорту "Херсонська-86" Озима пшениця була оброблена препаратами напіввологим методом Площа облікової ділянки 50кв м, повторність чотирьохкратна У якості еталона застосовували Імуноцитопг у рекомендованій дозі Результати дослідів приведені у табл 1

Таблиця 1

Препарат	Доза препарату, г/т насіння	Кількість сходів, шт/м	Кількість рослин після зими шт/м	Перезимовало рослин %	Врожай ц/га, у % до контролю
Контроль - На - КМЦ	-	375	220	61,6	25,4
Еталон Імуноцитопг	1 тбл (0,3г)	387	233	60,2	26,2/103,71
Запропонований	1	398	232	58,3	26,2/103,71
імуномодулятор	10	375	261	69,6	29,4/115,7
(спікел)	20	376	242	64,4	27,9/109,84
НСР _{0.5}		21,5			2,1

Таким чином, оптимальною дозою імуномодулятора (спікел) для обробки насіння озимої пшениці становить 10г на 1 тону

Приклад 5 Вплив імуномодулятора (спікел) на врожай озимого ячменю

Дослід польовий, методика загальноприйнята, об'єкт дослідів озимий ячмінь сорту Росава Перед

висівом насіння оброблялись препаратом напіввологим методом Площа облікової ділянки 0,25га, повторність трикратна У якості еталона застосовували імуноцитопг у рекомендованій дозі Агротехніка загальноприйнята Результати дослідів приведені у табл 2

Таблиця 2

Препарат	Кустистість	Висота стебла см	Довжина колосу см	Кількість зерновок	Врожай ц/га, у % до контролю	Пораження коренів глинями
Контроль	3-4	90-112	4,9-5,1	42-45	29,6	83
Еталон імуноцитопг	3-4	90-100	5,0-5,2	44-46	30,6/3,4	79
Запропонований імуномодулятор						
10г/т	5-6	75-80	5,5-5,9	52-54	43,1/47,7	33
1г/т	4-5	85-90	5,5-5,7	52-54	42,2/44,9	54
0,1г/т	3-4	90-95	5,0	44-46	30,6/3,4	83
НСР _{0.5}	2	11	0,7	7	3,2	21

Таким чином, оптимальна доза імуномодулятора (спікел) для обробки насіння озимого ячменю становить 1 - 10г на 1 тону

Приклад 6 Вплив імуномодулятора (спікел) на врожай ярого ячменю

Дослід напіввиробничий, площа 16га, у контролі 1га Об'єкт дослідів ярий ячмінь сорту одеський 151 Перед висівом насіння оброблялись препаратом із розрахунку 1г на 1т посівного матеріалу напіввологим методом На контролі врожай ярого ячменю склав 21,4ц/га, у досліді - 31,2ц/га, що

становить у відсотках 45,8%

Приклад 7 Вплив імуномодулятора (спікел) на врожай вівса

1 Обробка насіння напіввологим способом

Дослід польовий, методика загальноприйнята, об'єкт дослідів овес сорту "Кубанський" В якості еталонів застосовували імуноцитопг у рекомендованій дозі Площа облікової ділянки 100кв м, повторність дослідів чотирьохкратна Результати дослідів приведені у табл 3

Таблиця 3

Препарат	Доза препарату г/т	Врожай ц/га	Додаток врожаю	
			ц/га	%
Контроль	-	20,1	-	-
Еталон імуноцитопг	1 тбл, (0,3)	20,4	+0,3	+1,49
Запропонований імуномодулятор	1	20,5	+0,4	+1,99
	2	21,3	+1,2	+5,9
	5	18,6	-1,5	-7,4

2 Обробка вегетуючих рослин

Перед початком викидання мітелки рослини оброблялись водним розчином препарату із розрахунку 400л/га. Площа облікової ділянки 100кв м ,

повторність досліду чотириохкратна. В якості еталона застосовували імуноцитопіт у рекомендованій дозі. Результати дослідів приведені у таблиці 4

Таблиця 4

Препарати	Доза препарату		Врожайність ц/га	Додаток врожаю	
	г/л	г/га		ц/га	%
Контроль - вода		-	8,3	-	-
Еталон - імуноцитопіт		0,3	8,6	0,3	3,6
Запропонований імуномодулятор	0,1	40	18,6	10,3	124
НСР _{0.5}				2,3	

Таким чином, оптимальною дозою імуномодулятора (спікел) для обробки вегетуючих рослин вівса становить 40г на 1 гектар

Приклад 9 Вплив імуномодулятора(спікел) на врожай кукурудзи

Дослід польовий, методика загальноприйнята, об'єкт досліду кукурудза - гібрид Молдавський 215. Перед висівом насіння оброблялось препаратами напіввологим методом. Площа облікової ділянки 50кв м, повторність чотириохкратна. Результати дослідів приведені у табл. 5

Таблиця 5

Препарат г/т	Польова схожість %	Врожай					
		Зеленої маси		Сухой маси		Початків	
		ц/га	%	ц/га	%	ц/га	%
Інкустація (фон)	88 0	418		88 8		63 7	
Еталон - імуноцитопіт	85 6	456 2	109 1	102 0	114 1	70,2	110 1
Запропонований імуномодулятор							
1	87 4	454 1	108 6	98 2	110 3	96 3	150 0
10	91 0	458 0	109 5	108 1	122 1	70 4	110 5
20	88 0	437 6	104 6	138 1	155 0	103 4	162 3
НСР _{0.5}		21		9,6		19	

Таким чином, оптимальна доза імуномодулятора(спікел) для обробки насіння кукурудзи становить 1 і 20г на 1 тону

Приклад 10 Вплив імуномодулятора (спікел) на врожай сої

Дослід польовий, методика загальноприйнята,

об'єкт досліду - соя. Перед висівом насіння оброблялись препаратами напіввологим методом. Площа облікової ділянки 50кв м, повторність досліду чотириохкратна. У якості еталона застосовували імуноцитопіт у рекомендованій дозі. Результати дослідів приведені у табл. 6

Таблиця 6

Препарат	Доза препарату г/т	Врожай	Прибавка врожаю	
			ц/га	%
Контроль - вода	-	13	-	-
Еталон - імуноцитопіт	1 табл. (0.3)	14 1	1 1	8 5
Запропонований імуномодулятор	1	15 0	2 0	15 4
	0.1	16 0	3 0	23 0
	0.01	15 1	2 1	15 5
НСР _{0.5}		1,2		

Таким чином, оптимальною дозою імуномодулятора(спікел) для обробки насіння сої становить 0,1г на 1 тону

Приклад 11 Вплив імуномодулятора (спікел) на врожай соняшнику

Дослід польовий, методика загальноприйнята,

об'єкт досліду соняшник сорту Харківський. Перед висівом насіння оброблялись препаратами напіввологим методом. Площа облікової ділянки 50кв м, повторність чотириохкратна. У якості еталона використовували імуноцитопіт у рекомендованій дозі. Результати дослідів приведені у табл. 7

Таблиця 7

Препарат г/т	Схожість %	Маса 1000шт. насіння		Врожай ц/га	Додаток врожаю	
		г	% до к		ц/га	% до к
Контроль	81	47,7	-	12,6	-	-
Імуноцитопт 1 таблетка (0,3)	79	51,8	109	14,9	2,3	18,1
Запропонований Імуномодулятор 1	87	49,2	103,0	17,2	4,6	36,5
НСР _{0,5}		1,2		2,3		

Таким чином, оптимальна доза імуномодулятора (спікел) для обробки насіння соняшнику становить 1 г на 1 тону

Приклад 12 Вплив імуномодулятора (спікел) на врожай цукрового буряку. Дослід польовий, методика загальноприйнята. Об'єкт дослідження -

цукровий буряк сорту Ольгівська однонасінна. Перед висівом насіння оброблялись препаратами напіввологим методом. Площа облікової ділянки 25 кв м, повторність чотирьохкратна. Результати дослідів приведені у таблицях 8,9

Таблиця 8

Препарат г/т	Маса 1-го корене-пліду		Маса ботви з 1-ї рослини		Врожай		Цукор %	Сбір цукру	
	г	%	г	%	ц/га	%		ц/га	%
Контроль (вода)	535,3		693,0		440,0		16,1	70,8	
Запропонований Імуномодулятор									
400	560,3	104,6	458,0	66,0	449,0	102,0	16,0	71,9	1,55
200	530,5	99,1	500,0	72,15	428,0	97,27	16,3	69,8	-1,4
100	563,2	105,2	526,0	75,90	439,0	99,77	16,1	70,4	-0,6
40	560,8	104,8	640,0	92,35	425,0	96,59	16,5	70,1	-0,1
4	520,5	97,23	490,0	70,70	459,0	104,3	16,2	74,2	4,80
1	540,4	100,9	520,0	75,03	478,0	108,6	16,4	78,4	10,
0,1	530,1	99,02	511,0	73,74	448,0	100,8	16,3	73,0	3,14

Таблиця 9

Показники	Варіанти							
	Контроль	Спікел г/т насіння						
		вода	400	200	100	40	4	1
Динаміка появи сходів шт. на 1 т. м								
8-ий день	12	12	13	14	12	15	16	15
10-ий день	16	15	17	18	17	19	21	20
12-ий день	18	16	19	19	19	21	22	21
13-ий день	18	15	20	19	19	21	22	20
14-ий день	17	15	19	18	18	20	21	20
Польова схожість	60,0	50,0	66,7	63,3	63,3	70,0	74,0	71,0
Маса 100 рослин г	55,4	52,3	48,0	54,1	58,5	59,8	60,1	58,6
Пораження рослин коренем, %	22,9	21,6	27,1	28,8	25,9	11,5	11,3	11,9
Густота насаджень рослин на період збирання тис./га	85,6	77,7	81,0	77,4	75,8	88,4	89,1	87,1

Таким чином, оптимальною дозою імуномодулятора (спікел) для обробки насіння цукрового буряку становить 1 г на 1 тону

Приклад 13 Дослідження токсичності та мутагенності імуномодулятора. В якості тест-об'єкту використали насіння цибулі сорту "Луганський", які пророщували у чашках Петрі при т. 26 - 28°C. Давлені препарати кінчиків коренів готували по загальноприйнятій методикі. На них оцінювали ін-

тенсивність клітинного ділення, рівень сумарного білкового синтезу, кількість аберацій та друп цитологічні характеристики популяцій клітин кореню (усього 10 параметрів). Дані були отримані на репрезентативних об'єктах вибірок, котрі забезпечили 95%-ну надійність. Аналіз фактичного матеріалу довів, що усі досліджені концентрації препарату не приводять до суттєвого підвищення інтенсивності білкового синтезу. Рівень аберацій

при їх дії не був вище ніж контрольний. Таким чином, імуномодулятор (спікел) не токсичний і не

має мутагенних властивостей