



СОЮЗ СОВЕТСКИХ
СОЦИАЛИСТИЧЕСКИХ
РЕСПУБЛИК

для служебного пользования ЭКЗ №

300080

(19) **SU** (11) **1545523 A1**

(51) 5 C 07 C 257/00, A 01 N 37/52

ГОСУДАРСТВЕННЫЙ КОМИТЕТ
ПО ИЗОБРЕТЕНИЯМ И ОТКРЫТИЯМ
ПРИ ГНТ СССР

ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

К АВТОРСКОМУ СВИДЕТЕЛЬСТВУ

(21) 4365592/23-04

(22) 18.01.88

(71) Институт органической химии
АН УССР

(72) Л.И.Рейдалова, Н.К.Майданович,
А.Д.Синица, Г.С.Степура, В.И.Мицко,
В.В.Оглезнева и В.С.Петренко

(53) 547.707(088.8)

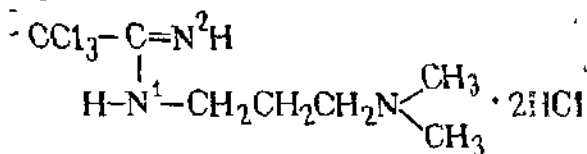
(56) Авторское свидетельство СССР
№ 682201, кл. А 01 N 5/00, 1979.

(54) ДИХЛОРГИДРАТ N'-3-(ДИМЕТИЛАМИНО)-
ПРОПИЛТРИХЛОРАЦЕТАМИДИНА, ОБЛАДАЮЩИЙ
РОСТРЕГУЛИРУЮЩЕЙ АКТИВНОСТЬЮ

(57) Изобретение касается замещенных

аминов, в частности дихлоргидрата
N'-3-(диметиламино)-пропилтрихлор-
ацетамида, обладающего рострегули-
рующей активностью, что может быть
использовано в сельском хозяйстве.
Цель - создание более активного и ме-
нее токсичного соединения указанного
класса. Синтез ведут реакцией три-
хлорацетонитрила с 3-диметиламинопро-
пиламином в среде эфира. Выход 82%,
т.кип. 84-85°C/0,4 мм рт.ст., брутто-
ф-ла C₇H₁₄Cl₃N₃. Новое вещество мало-
токсично (LD₅₀ = 1050 мг/кг) и обес-
печивает увеличение урожая картофеля
на 38 ц/га. 5 табл.

Изобретение относится к новому
производному N'-алкилтрихлорацетамид-
инов, конкретно к дихлоргидрату
N'-3-(диметиламино)пропилтрихлорацет-
аמידина, содержащему у аминного азота
диметиламинопропильную группу фор-
мулы I



обладающему рострегулирующей актив-
ностью, которое может быть использо-
вано в сельском хозяйстве.

Пример 1. N'-3-(диметиламино)-
пропилтрихлорацетамидин. К раствору
14,4 (0,1 моль) трихлорацетонитрила
в 20 мл эфира прибавляют по каплям
3-диметиламинопропиламин 1 ч при 30-
34°C. Через 3 ч после удаления низко-
7-90

кипящих продуктов остаток перегоняют.
Т.кип. 84-85°C/0,04 мм рт.ст. Выход
20,4 г (82%). Состав и строение полу-
ченного N'-3-(диметиламино)пропилтри-
хлорацетамида подтверждены данными
элементного анализа (Cl, N) и ИК-спек-
тров.

ИК-спектр, ν , см⁻¹ (т.сл.): 640
(C-Cl), 1630 (C=N).

Найдено, %: C 26,42; H 5,14;
Cl 43,37; N 17,05.

C₇H₁₄Cl₃N₃.

Вычислено, %: C 26,29; H 5,00;
Cl 43,25; N 17,03.

Дихлоргидрат N'-3-(диметиламино)-
пропилтрихлорацетамида. Через раст-
вор 14,6 г (0,059 моль) N'-3-(дике-
тиламино)пропилтрихлорацетамида
в 70 мл эфира барботируют сухой хло-
ристый водород в течение 1 ч. Соль
отфильтровывают, промывают эфиром,

№ **SU** (11) **1545523 A1**



сушат на воздухе и кристаллизуют из спирта. Выход 16,0 г (90%), т.пл. 208°C (с разложением).

Состав и строение полученного дихлоргидрата подтверждены данными элементного анализа (C, H, Cl, N), ИК- и ПМР-спектров.

ИК-спектр, $\bar{\nu}$, см⁻¹, (табл.): 660 (C-Cl), 1715 (C=N), 2440-2710 (NH₂=NH₂).

Спектр ПМР, δ , м.д.: 2,38, т, 2H, (CH₂), 2,93, д, 6H, N(CH₃)₂, 3,86, м, 2H, CH₂N(CH₃)₂, 3,78, т, 2H, (N-CH₂), 8,4, с, 1H, (NH), 8,86, с, 1H, (=NH).

Найдено, %: Cl 55,47; N 13,11.

C₇H₁₆Cl₂N₂.

Вычислено, %: Cl 55,55; N 13,14.

ИК-спектры, $\bar{\nu}$, см⁻¹ (т.сл.) сняты на приборе "UR-20". Спектр ПМР, δ , м.д., записан на приборе "Tesla BS-467", 60 МГц (ГМДС - внешний стандарт).

Пример 2. Рострегулирующая активность соединения (I) на пшенице и на овсе (опыт лабораторный). Изучение рострегулирующей активности соединения I проводят в чашках Петри по методу Т.А.Сергеевой с модификациями. В чашки Петри на фильтровальную бумагу раскладывают семена и вносят растворы соединений определенной концентрации. Выдерживают чашки в термостате в течение 3-х дней при температуре воздуха 22-24°C. Через 4 дня определяют всхожесть семян и измеряют длину корней, стеблей и листьев. Вначале высчитывают среднюю длину корня, стебля или листа по каждой чашке, а затем среднюю арифметическую по повторностям опыта. Ошибка средней арифметической колеблется от 0,9 до 1,2%. Статистическую обработку данных проводят по примеру А.В.Соколова. Повторность опытов пятикратная, в каждой чашке 10-11 растений. Контроль - вариант опыта, содержащий только воду. Эталонном служит гумат натрия. Данные опытов представлены в табл. 1.

Установлено, что соединение I обладает рострегулирующим действием в концентрациях 0,001-0,0001% и по уровню действия на стебли растений превосходит гумат натрия и прототип, проявляя ингибирующий эффект на пшенице в концентрации 0,01% и стимулирующий (на овсе и пшенице) в концентрациях 0,001-0,0001%.

Пример 3. Эффективность применения соединения I на картофеле (сорт Гатчинский, обработка клубней предпосадочная).

Опыт полевой. Почва - дерново-подзолистая, легкосуглинистая. Размер опытных делянок 25 кв м. Предпосадочную обработку клубней проводят путем кратковременного намачивания их в течение нескольких секунд в растворах препарата I соответствующих концентраций 1,0 и 10,0 мг на 1 л. Контролем служит вариант опыта, в котором клубни картофеля обрабатывают водой. В качестве эталонов служит биферан и ивин-ян. Повторность опытов шестикратная.

Данные опытов представлены в табл. 2.

Установлено, что оптимальной нормой расхода соединения I является 1,0 мг на 1 л. Препарат в данной дозировке повысил урожай клубней картофеля сорта Гатчинский на 39 ц/га и по уровню действия превосходил ивин-ян и биферан.

Пример 4. Эффективность применения препарата I на картофеле сорта Гатчинский методом опрыскивания в фазе бутонизации. Опыт полевой. Почва - дерново-подзолистая, легкосуглинистая. Размер опытных делянок 25 кв м. Внекорневое опрыскивание растений картофеля в фазе бутонизации проведено ранцевым опрыскивателем из расчета 400 л водного раствора препарата на 1 га. Контролем служит вариант опыта без обработки препаратами. В качестве эталона служит квартазин. Повторность опытов шестикратная.

Данные опыта представлены в табл. 3.

Установлено, что соединение I в концентрации 10 мг на 1 л обеспечивает прибавку урожая клубней картофеля 51 ц/га и по уровню действия превосходит квартазин.

Пример 5. Эффективность применения соединения I на картофеле сорта Гатчинской методом опрыскивания растений в фазе бутонизации. Опыт полевой. Почва - дерново-подзолистая, легкосуглинистая.

Условия проведения опыта аналогичны описанным в примере 4. Контролем служит вариант опыта без обработки препаратами. В качестве эталона служит квартазин.

Данные опыта представлены в табл. 4.

Установлено, что оптимальная норма расхода соединения I 10 мг на 1 л. Препарат обеспечивает прибавку урожая картофеля 24 ц/га и по уровню действия превосходит квартазин. В среднем за 2 года прибавка урожая картофеля от применения соединения I составила 38 ц/га.

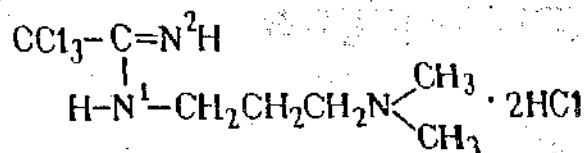
Пример 6. Токсикологическая оценка соединения I. Острую токсичность изучают в лабораторных опытах путем перорального введения изотонических растворов соединения белым мышам (масса 18-21 г, самцы и самки). Учет гибели животных проводят спустя 24 ч после введения препарата. Статистическую обработку экспериментальных данных проводят по методу Литчфильда и Уилкоксона в модификации Рота. Ре-

зультаты опытов представлены в табл. 5.

Установлено, что дихлоргидрат N'-(3-диметиламино)пропилтрихлорацетамидина относится к малотоксичным препаратам.

Ф о р м у л а и з о б р е т е н и я

Дихлоргидрат N'-(3-диметиламино)-пропилтрихлорацетамидина формулы I:



20 обладающий рострегулирующей активностью.

Т а б л и ц а 1

Рострегулирующая активность соединения I на пшенице и овсе

Соединение	Концентрация, %	Длина частей растений			
		в см к контролю		в % к контролю	
		корень	стебель	корень	стебель
Пшеница					
Контроль - вода	-	9,5	10,4	100	100
Соединение I	0,01	7,8	3,0	82,1 ± 0,1	28,8 ± 0,3
То же	0,001	9,2	10,4	96,8 ± 0,1	100
—	0,0001	10,7	10,7	112,6 ± 0,2	112,6 ± 0,2
Эталон - гумат натрия	0,01	9,9	10,3	104,2 ± 0,5	99,0 ± 0,4
	0,001	9,4	10,0	98,9 ± 0,1	96,1 ± 0,2
То же	0,0001	9,8	10,5	103,1 ± 0,2	100,9 ± 0,4
Аналог по структуре	0,01	8,4	3,6	88,0 ± 0,3	35,1 ± 0,4
То же	0,001	9,4	10,4	99,0 ± 0,2	100
—	0,0001	9,6	10,6	101,2 ± 0,4	102 ± 0,3
Овес					
Контроль - вода	-	8,0	6,0	100	100

Продолжение табл. 1.

Соединение	Концент- рация, %	Длина частей растений			
		в см к контролю		в % к контролю	
		корень	стебель	корень	стебель
Соединение I	0,001	7,4	7,3	92,5 ± 0,3	121,6 ± 0,5
То же	0,0001	8,4	7,6	105,0 ± 0,5	126,7 ± 0,2
Гумат натрия	0,001	7,9	5,9	98,9 ± 0,1	96,1 ± 0,3
То же	0,0001	8,2	6,1	103,1 ± 0,1	100,9 ± 0,2
Аналог по структуре	0,001	1,0	4,5	12,5 ± 0,2	75,0 ± 0,5
То же	0,0001	7,0	7,2	87,0 ± 0,3	120,0 ± 0,6

Т а б л и ц а 2.

Эффективность применения соединения I на картофеле методом пред-
посадочной его обработки

Варианты опыта	Концент- рация, мг/л	Урожай клубней, ц/га			
		опыт 1		опыт 2	
		среднее из двух опытов			
		ц/га	% к конт- ролю	ц/га	% к конт- ролю

Контроль - обра-
ботка клубней

водой	-	243	-	340	-	291	-
Соединение I	10,0	285	+42	371	+31	328	+37
Соединение I	1,0	282	+39	372	+32	327	+36
Эталон - биферан	100,0	274	+31	361	+21	318	+27
Эталон - ивин-ян	1,0	263	+20	357	+17	310	+19

HCP_{0,95}
7,0 9,5

Т а б л и ц а 3

Эффективность применения соединения I на картофеле
сорта Гатчинский методом опрыскивания в фазе
бутонизации растений

Варианты опыта	Концентрация, мг/л	Урожай клубней	
		ц/га	± к контролю
Контроль без об- работки препара- тами	-	262	-
Соединение I	10,0	313	+51
Эталон - квар- тазин	2500,0	295	+33
HCP _{0,95}		7,0	-

Т а б л и ц а 4

Эффективность применения соединения I на картофеле
методом опрыскивания растений в фазе бутонизации

Варианты опыта	Концентрация, мг/л	Урожай клубней	
		ц/га	± к контролю
Контроль без об- работки препара- тами	-	486	-
Соединение I	10	510	+24
Эталон - квартазин HCP _{0,95}	2500	465 4,5	-21

Т а б л и ц а 5

Токсичность соединения I для
теплокровных животных*

Соединения	ЛД ₅₀ , мг/кг (дове- рительные границы)
Соединение I	1050 (921-1197)
Гумат натрия (эталон)	>1000
Ивин-ян (эталон)	4550 (3920-5300)
Биферан (эталон)	4500 (3846-5265)
Прототип	35 (29-42)
Аналог	100-200

* токсичность определяют внутрими-
шечно.

Редактор Т.Иванова Составитель Н.Куликова
Техред М.Ходанич Корректор Э.Лончакова

Заказ 353/ДСП Тираж 109 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

