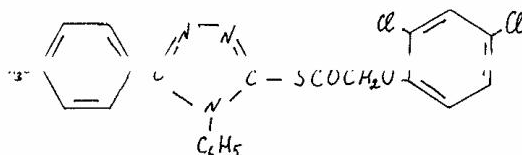


Винахід відноситься до області органічної хімії, конкретно до нової сполуки 5-(4-метилфеніл)-4-феніл-1,2,4-триазол-3-тіо)ефіру 2,4-дихлорфеноксіцтової кислоти формули (I):



яка має високу ефективність в боротьбі з одно- і дводольними бур'янами і як гербіцид може бути застосована у сільському господарстві.

Відомо використання в якості гербіциду 2,4-Д [1], який є найбільш близьким до запропонованої сполуки (I) за хімічною структурою. 2,4-Д прийнятий нами в якості базової сполуки.

Загальними ознаками запропонованої сполуки (I) і гербіциду 2,4-Д є те, що вони відносяться до одного класу хімічних сполук - похідних 2,4-дихлорфеноксіцтової кислоти, мають гербіциди і властивості і відносяться до малотоксичних сполук.

Відмінні ознаки:

Запропонована сполука (I) є складним ефіром, який включає фрагменти 2,4-дихлорфеноксіцтової кислоти і заміщеного 1,2,4-триазолтіолу.

Базова сполука 2,4-Д за хімічним складом є 2,4-дихлорфеноксіцтовою кислотою.

Запропонована сполука (I) є менш токсичною для теплокровних тварин, ніж 2,4-Д.

Запропонована сполука (I) діє на одно- і дводольні види бур'янів на відміну від 2,4-Д, який ефективний лише проти дводольних рослин.

Задачею винаходу являється створення нового гербіциду -5-(4-метилфеніл)-4-феніл-1,2,4-триазол-3-тіо)ефіру 2,4-дихлорфеноксіцтової кислоти, який мав би вищу фітотоксичність та був менш токсичний до теплокровних, ніж базова сполука 2,4-Д.

Задача винаходу досягається синтезом 5-(4-метилфеніл)-4-феніл-1,2,4-триазол-3-тіо)ефіру 2,4-дихлорфеноксіцтової кислоти, який є високоефективним гербіцидом для боротьби з одно і дводольними бур'янами і має значно більшу активність, ніж відомий гербіцид 2,4-Д.

Синтез нової сполуки загальної формули (I) здійснюється реакцією хлорангідриду 2,4-дихлорфеноксіцтової кислоти та натрієвих солей 4,5-диарм-1,2,4-триазолт і од і в-3.

Винахід ілюструється наступними прикладами.

Приклад 1. Синтез 5-(4-метилфеніл)-4-феніл-1,2,4-триазол-3-тіо)ефіру 2,4-дихлорфеноксіцтової кислоти (сполука I).

Суміш із еквімолярних кількостей хлорангідриду 2,4-дихлорфеноксіцтової кислоти та натрієвих солей 4,5-диарил-1,2,4-триазолтіолів-3 в розчині бензолу нагрівають при інтенсивному перемішуванні в реакторі з оберненим холодильником на протязі 20-30 хвилин. Після охолодження суміші відділяють осад хлориду натрію, залишок бензолу упарюють в вакуумі водоструйного насосу.

Залишок закристалізовується, його відфільтровують, промивають бензолом і сушать.

Так, одержано 5-(4-метилфеніл)-4-феніл-1,2,4-триазол-3-тіо) ефіру 2,4-дихлорфеноксіцтової кислоти (сполука 1).

Температура топл. 192-4°C. Розраховано S 6,76%.

C₂₃H₁₇Cl₂N₃O₂. Знайдено S 8%.

Білий кристалічний порошок, без запаху. Добре розчинний в диметилсульфоксиді, мало розчинний у ацетоні, воді. Сполука (I) добре зберігається при температурі 20°C. Водні розчини сполуки (I) зберігають гербіцидні властивості на протязі не менше 30 діб.

Приклад 2. Вегетаційні дослідження гербіцидної активності 5-(4-метилфеніл)-4-феніл-1,2,4-триазол-3-тіо)ефіру 2,4-дихлорфеноксіцтової кислоти (сполука I).

Рослини ячменю "Одеський-100" і редьки олійної сорту "Радуга" пророщували в вегетаційних умовах на суміші ґрунт : пісок в співвідношенні 1:1. рН (KCl) 5,9 [21, вміст гумусу 1,5% [2].

Вивчали активність сполук при до- і післясходовому застосуванні.

При досходовому застосуванні потрібну кількість сполуки (I) спочатку розчиняли в диметилсульфоксиді (ДМСО), а потім доводили дистильованою водою до 50мл (кінцева концентрація ДМСО не більше 1%). Сполуки вносили в об'ємі 50мл розчинника на посудину.

При післясходовому застосуванні надземні частини сходів рослин віком 7 діб витримували зануреними в водні розчини сполук, що досліджуються, (кінцева концентрація ДМСО не більше 1%) на протязі 5 хвилин при 20°C.

Ступінь пригнічення рослин визначали візуально в порівнянні з контролем: 100% - контрольні рослини без застосування препаратів, 0% - повна загибель рослин в дослідах з гербіцидами. Повторність - 6-кратна. Результати дослідів статистичне оброблені за Доспеховим [3].

Таблиця 2

Вивчення гербіцидної активності 5-(4-метилфеніл)-4-феніл-1,2,4-триазол-3-тіо) ефір 2,4-дихлорфеноксіцтової кислоти (I) і базової сполуки 2,4-Д.

Варіанти дослідів	Ячмінь	Редька олійна
	Фітотоксичність (% до контролю)	
Контроль	Досходове застосування з заробкою у ґрунт	
	100 ^a	100 ^a

N1 10кг/га	0 ^б	0 ^б
N1 1кг/га	0 ^б	0 ^б
N1 0,1кг/га	37 ^в	5 ^б
N1 0,01кг/га	95 ^а	45 ^в
ДМСО 1%	100 ^а	101 ^а
Післясходове застосування		
Контроль	100 ^а	100 ^а
N1 10кг/га	0 ^б	0 ^б
N1 1кг/га	0 ^б	0 ^б
N1 0,1кг/га	39 ^в	5 ^б
N1 0,01кг/га	99 ^а	34 ^в
ДМСО 1%	100 ^а	101 ^а
2,4-Д 10кг/га	81 ^г	0 ^б
1кг/га	100 ^а	2 ^б
0,1кг/га	103 ^а	69 ^г
0,01кг/га	108 ^а	95 ^а

Примітки. Однаковими буквами позначені варіанти, які не відрізняються при 0,05 рівні значимості.

Як свідчать наведені в табл.2 дані, запропонована сполука (I) в дозах і кг/га і вище повністю пригнічує ріст одно- і дводольних видів рослин. В дозі 0,1 і 0,01 кг/га сполука (I) пригнічує переважно дводольні види.

Застосований в якості розчинника ДМСО не оказував фітотоксичної дії.

Запропонована сполука (I) значно переважає по активності 2,4-Д при застосуванні по сходах.

Запропонована сполука (I) також ефективна при застосуванні до сходів на відміну від 2,4-Д, яких відомий як виключно післясходовий гербіцид.

Приклад 3. Вивчення гострої токсичності сполуки (I) (5-(4-метилфеніл)-4-феніл-1,2,4-триазол-3-тіо) ефіру 2,4-дихлорфеноксіоцтової кислоти).

Токсичність сполуки (I) вивчали в гострих дослідах стандартним методом [4] на білих мишах самцях та самках вагою 18-20г при пероральному способі введення водних розчинів. Спостереження за піддослідними тваринами проводили на протязі 24 годин. Показником токсичності величина ЛД₅₀ (доза, яка викликає загибель 50% експериментальних тварин, в мг/кг маси). Статистичну обробку проводили за методом Літчфілда і Уіллоксона в модифікації Рота [4].

Вирахована величина ЛД₅₀ сполуки (I) перевищувала 4000мг/кг.

Встановлено, що токсичність запропонованої сполуки (I) для тварин значно нижча, ніж прототипа 2,4-Д - 350-560мг/кг.

Література.

1. Мельников Н.Н., Новожилов К.В., Белан Р.О. и др. Справочник по пестицидам.-М.: Химия, 1985.-352с.
2. Радов А.С., Пустовой И.В., Корольков А.В. Практикум по агрохимии.-М.: Агропромиздат, 1985.-312с.
3. Доспехов Б.А. Методика полевого опыта.-М.: Агропромиздат, 1985.-351с.
4. Бельский М.Л. Элементы количественной оценки фармакологического эффекта.-Л.: Медгиз, 1963.-95с.