

## Спрямований пошук регуляторів росту та гербіцидів в ряду {2-(3-R)-1H-1,2,4-тріазол-5-іл]феніл}амінів та їх конденсованих аналогів

*Проведено дослідження {2-(3-R)-1H-1,2,4-тріазол-5-іл]феніл}амінів та їх конденсованих аналогів на всхожість насіння, довжину ростка, масу ростка, масу стебла та масу кореню пшениці, ячменю та кукурудзі. Встановлено, що найбільшу рістстимулюючу активність серед досліджених сполук проявляють речовини 1.5, 1.7, 4.5 та 6.2, а найбільш виражену гербіцидну активність проявила сполука 5.4.*

*The research of seeds germination, sprout length, mass sprout, stem weight and root weight of wheat, barley and corn of {2-(3-R)-1H-1,2,4-triazolo-5-yl]phenyl}amines and their condensed analogues was carried out. It is shown that the substances 1.5, 1.7, 4.5 and 6.2 showed the most growth stimulant activity and the most pronounced herbicidal active showed compound 5.4.*

В останні десятиліття, вичерпавши можливості інтенсивного внесення органічних і мінеральних добрив, аграрна наука пішла шляхом створення стимуляторів – препаратів, які сприяють посиленою переробки та засвоєнню поживних речовин рослинами (у тому числі з добрив та ґрунту). Вони знаходять все більше поширення насамперед в економічно розвинених країнах. Застосування стимуляторів росту рослин сприяє активізації ростових процесів рослин, підвищенню їх стійкості до несприятливих біотичних і абіотичних факторів, підвищенню продуктивності рослин і поліпшенню якості зерна. В останні роки об'єктами дослідження є стимулятори нового покоління з високою біологічною активністю, норми внесення яких дуже малі. Інтенсивний пошук регуляторів росту та гербіцидів серед різних класів органічних сполук. Превіліюваними структурами є різноманітні гетероциклічні системи (піридин, імідазол, триазин, піразолін, хінолін, піразол). Крім того, як регулюючу так і фунгіцидну активність проявляють похідні тріазолу, серед яких виявлені триадимефон (1-[4-хлорфеноксі]-3,3-диметил-1-[1H-1,2,4-тріазол-1-іл]-2-бутанон) – високоактивний системний фунгіцид проти кількох грибкових захворювань [1,2]. Деякі тріазоли, зокрема паклобутразол ([2RS, 3RS]-1-[4-хлорфеніл]-4,4-диметил-2-[1,2,4-тріазол-1-іл]-пентан-3-ол) та ХЕ-1019 ([E]-1-[4-хлорфеніл]-4,4-диметил-2-[1,2,4-тріазол-1-іл]пентен-3-ол) – активні інгібітори росту широкого діапазону видів рослин [1,2]. Виходячи з цього, цікавими об'єктами для дослідження рістстимулюючої активності є {2-(3-гетерил)-1H-1,2,4-тріазол-5-іл]феніл}аміни та конденсовані аналоги одержані на їх основі, до складу молекул яких входять ряд гетероциклічних систем (пірол, індол, фуран, бензофуран, тіофен та бензотіофен).

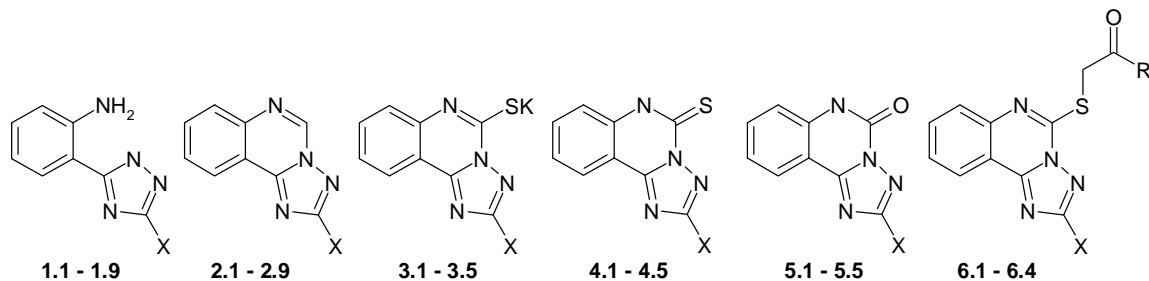
*Метою роботи є дослідження {2-(3-R)-1H-1,2,4-тріазол-5-іл]феніл}амінів та конденсованих аналогів синтезованих на їх основі на всхожість насіння, довжину ростка, масу ростка, масу стебла та масу кореню пшениці, ячменю та кукурудзи.*

### Матеріали та методи дослідження.

Об'єктами для досліджень обрано ряд {2-(3-R)-1H-1,2,4-тріазол-5-іл]феніл}амінів та їх конденсованих аналогів (рис. 1).

*Рістстимулююча та гербіцидна активність синтезованих 2-(3-R)-1H-1,2,4-тріазол-5-іл]феніл}амінів та їх конденсованих аналогів оцінювалась на пшениці (сорт «Победа 50»), ячмені (сорт «Одесский 100») та кукурудзі (сорт «Коллективный-181СВ»). Концентрація водних розчинів препаратів складала 0,00002 %, для цього наважку 0,2 г розчиняли у 20 мл спирту етилового та доводили водою до 1 л, потім з отриманого розчину відбирали 1 мл та ще раз доводили водою до 1 л. Насіння пророщували у чашках Петрі по 10 шт. В якості*

грунту використовувався «Коко-грунт» – грунт з кокосового волокна для гідропоніки, в кількості 9 г на одну чашку Петрі. Насіння пророщували в боксі при температурі 20°C, відносній вологості повітря 60-80% та штучному освітленні (лампи «Флора»). Полив розчином досліджуваних речовин проводили через добу, норма витрати води – 40 мл на одну чашку Петрі. Контрольні насіння поливали водою. Оцінювали всхожість насіння, довжину ростка, масу ростка, а також окремо масу стебла та масу кореню). Довжину та масу проростків визначали на 14-й день при ліквідації досліду.



X = фуран-2-іл (1.1; 2.1; 3.3; 4.3; 5.1; 6.3); тієн-2-іл (1.2; 2.2; 3.5; 4.5; 6.2); 1H-пірол-2-іл (1.3; 2.3); 2,4-(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-3-(COOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)-1H-пірол-2-іл (1.4; 2.4); бензофуран-2-іл (1.5; 2.5; 3.2; 4.2; 5.2; 6.4); бензотієн-2-іл (1.6; 2.6; 3.4; 4.4; 5.3); 1H-індол-2-іл (1.7; 2.7; 3.1; 4.1; 5.4); фуран-3-іл (1.8; 2.8; 5.5; 6.1); тієн-3-іл (1.9; 2.9);

R = азелпан-1-іл (6.1); морфолін-4-іл (6.2); адамантил (6.3); 2-бромбензил (6.4)

Рис. 1. {2-(3-R)-1H-1,2,4-тріазол-5-іл}феніл}амінів та їх конденсовані аналоги

## Результати та їх обговорення

В результаті дослідження рістстимулюючої активності встановлено, що {2-(3-R)-1H-1,2,4-тріазол-5-іл}феніл}амінів та їх конденсовані аналоги у більшості випадках у зазначених концентраціях проявляють дану активність.

Аналізуючи дані середньої довжини стебла пророщених культур, видно деяку закономірність між природою гетероциклічного замісника та рістстимулюючою активністю синтезованих сполук. Так, речовини **2.1-2.9** збільшують середню довжину ростка ячменю (94-119%), винятком є лише сполука **2.3**, яка значно зменшує цей показник у порівнянні з контрольними зразками (65%). В той же час сполуки **2.1-2.9** майже не впливають на пророщування кукурудзи, окрім сполук **2.2** та **2.9**, які проявляють помірну (49% та 46%) інгібуючу активність. При аналізі даних рістстимулюючою активності серед сполук **1.1-1.9** видно, що всі ці речовини значно збільшують середню довжину ростків ячменю та кукурудзи (113-146%), в той же час майже не впливаючи на культуру пшениці. Найактивнішими в цій серії сполук є речовини **1.6** та **1.7**, що містять у свої структурі бензофурановий та індолий залишки відповідно (146% та 139%). Серед сполук **3.1-3.5** виділяється речовина **3.5**, яка пригнічує ріст насіння ячменю на 81%, водночас стимулюючи ріст пшениці на 128%. Інші сполуки цієї серії проявляють помірну рістстимулюючу активність по відношенню до ячменю та пшениці і не впливають на ріст кукурудзи. Речовини **4.1-4.5** не виявили ніякої активності по відношенню до насіння кукурудзи. З даної серії сполук можна виділити лише речовину **4.3**, яка пригнічує ріст ячменю та пшениці (65% та 67% відповідно), а також речовину **4.5**, що збільшила середню довжину ростка ячменю на 168%. У результаті досліджень визначено, що сполука **5.4** проявила гербіцидну активність щодо насіння ячменю (з двох серій експерименту зійшло лише 20% насіння). Інші з речовини з цієї групи майже не проявляють активності щодо протестованих зернових культур. Також майже не впливають на довжину стебла і речовини **6.1-6.4**, окрім сполуки **6.3**, яка є рістстимулятором по відношенню до ячменю та кукурудзи (збільшує довжину стебла на 124%).

Аналіз маси ростків ячменю показав, що досліджувані речовини загалом збільшують як масу ростка в цілому на 109-120%, так і масу стебла та кореня 108-124% та 104-116% відповідно. Винятком є сполуки **2.3**, **3.4**, **4.5**, **5.4**, **6.2**, вони знижують всі масові показники ростка ячменю, в той же час сполука **1.3** значно підвищує всі ці показники та проявляє найбільшу активність (139%) по відношенню до ростків ячменю у порівнянні з іншими сполуками.

Зовсім протилежні результати видно на ростках пшениці. З усіх речовин, які тестували на рістстимулюючу активність, лише сполуки **1.2**, **1.4**, **1.7** та **1.9** збільшують масу ростка. Найбільшу активність виявляє сполука **1.7**, що містить у своїй структурі індолий залишок підвищуючи їх ріст на 121%.

При дослідженні рістстимулюючої активності на кукурудзі отримані результати показують, що найбільш активними є сполуки **1.5** (138%), **1.7** (123%), **3.4** (170%), **4.3** (161%) та **6.2** (160%). Інші досліджувані сполуки не виявляють значно рістстимулюючої активності, або навіть пригнічують ріст кукурудзи (сполуки **2.2**, **2.3**).

Отже, при аналізі взаємозв'язку «будова-дія» встановлено, що найбільшу рістстимулюючу активність серед досліджених сполук проявляють речовини **1.5**, **1.7**, **4.5** та **6.2**, а виражену гербіцидну активність проявила сполука **5.4** (рис. 2).

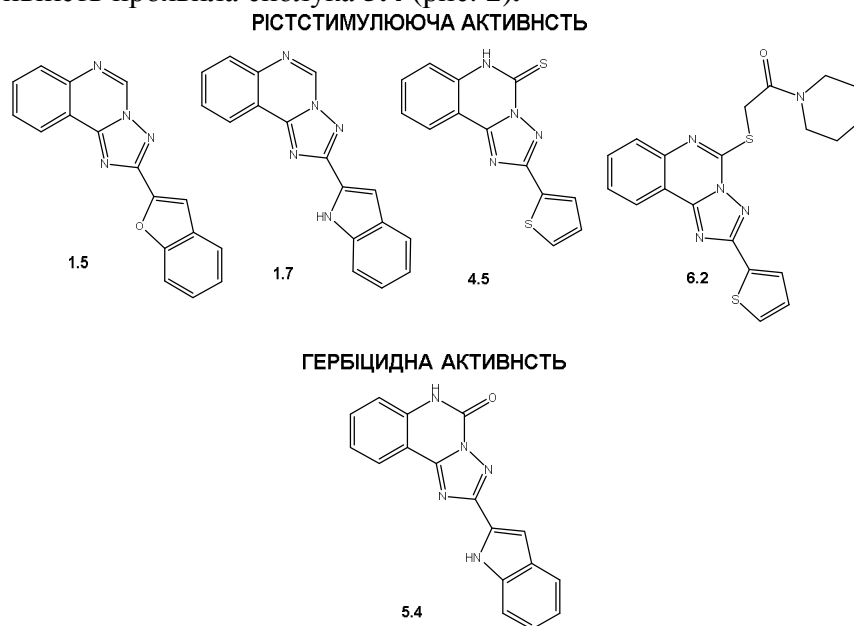


Рис. 2. «Сполуки-лідери» при визначенні рістрегулюючої та гербіцидної активності

## Висновки

1. Показано, що {2-(3-*R*)-1*H*-1,2,4-триазол-5-іл}феніл}амінів та їх конденсовані аналоги проявляють рістстимулюючу та гербіцидну активність.
2. Встановлено, що найбільшу рістстимулюючу активність серед досліджених сполук проявляють речовини **1.5**, **1.7**, **4.5** та **6.2**.
3. Виявлено, що найбільшу гербіцидну активність проявила речовина **5.4** (2-(1*H*-індол-2-іл)[1,2,4]триазоло[1,5-*c*]хіназолін-5(6*H*)-он).

## Література

1. Davis, T. D., Steffens, G. L. and Sankhla, N. (1988) Triazole Plant Growth Regulators, in Horticultural Reviews, Volume 10 (ed J. Janick), John Wiley & Sons, Inc., Hoboken, NJ, USA.
2. Fletcher RA, G Hofstra and Jian-guo Gao. 1986. Comparative fungitoxic and plant growth regulating properties of triazole derivatives. Plant Cell Physiol. 27:367-371.
3. Indole-3-acetic acid / Herbert E. Johnson and Donald G. Crosby // Organic Syntheses, Vol. 44, p. 64 (1964); Coll. Vol. 5, p.654 (1973).
4. Auxin Biosynthesis and Its Role in Plant Development / Yunde Zhao // Annual review of plant biology, Vol. 61, pp. 49-64
5. Why plants need more than one type of auxin / Sibiu Simon, Jan Petrášek // Plant Science, Volume 180, Issue 3, March 2011, Pages 454-460
6. Investigation of plant growth regulation activity of ([1,2,4]triazolo[1,5-*c*]quinazolin-2-ylsulfanyl) carboxylic acids and amides on Cucumis Sativus L. Roots / Antypenko L. M., Kovalenko S. I., Kornet M. M., Brazhko O. O. // Актуал. питання фармац. та мед. науки та практики: науково-практичний журнал. - Запоріжжя: ЗДМУ, 2012. - N 2. - С. 79-82.