

СИНТЕЗ ДЕФОЛИАНТНЫХ АКТИВНЫХ ВЕЩЕСТВ (XH-23-24)

Х.И.Нурбаев

Самаркандский государственный медицинский университет
кафедра биологической химии

Аннотация. В данной работе рассматриваются дефолиантная, фунгицидная и бактериологическая свойства производных пиримидинового ряда. Показано дефолиантная эффективность их применения как гоммоза, так корневой гнили хлопчатника.

Ключевые слова: дефолиант, синтез, 2-амино -3-н-бутил-6-метилпиримидинон-4, 2-амино-3-н-пентил-6-метилпиримидинон-4

SYNTHESIS OF DEFOLIANT ACTIVE SUBSTANCES XH-23, XH-24

Abstract. This paper discusses the defoliant, fungicidal and bacteriological properties of pyrimidine derivatives. The defoliant effectiveness of their use as gummosis and root rot of cotton is shown.

Keywords: defoliant, synthesis, 2-amino-3-n-butyl-6-methylpyrimidinone-4, 2-amino-3-n-pentyl-6-methylpyrimidinone-4.

Пиримидиновые основания играют огромную роль в жизненных процессах. Они входят в состав нуклеиновых кислот, витаминов, алкалоидов, и широко распространены в природе. Соединения пиримидинового ряда являются одним из наиболее важных гетероциклических систем в связи с высокой эффективностью лекарственных препаратов на их основе [1]. Производные пиримидина также используются в качестве дефолиантов, гербицидов, фунгицидов, красителей, ускорителей, стабилизаторов, средств для отбеливания ткани.

Действие дефолиантов связано с интенсивным образованием в растении этилена-природного регулятора роста, способствующего формированию у

листьев отделительного слоя. Механизм дефолиантов во всех случаях связан с изменением в заемного расположения составляющих тело частиц вещества. Дефолиация эластомеров происходит в основном в результате изменений конформации макромолекул и связано преимущественно с изменением энтропии системы. Для расширения спектра действия и повышения активности гербицидов часто используют их смеси, выпускаемые промышленностью или приготовляемые на месте применения. Избирательность гербицидов в наибольшей мере обусловлена биохимическими факторами, в частности неодинаковой способностью различных растений разлагать гербицидов или связывать его сообразованием не токсичных веществ. Гербицидная активность веществ обусловлена их способностью проникать в те или иные части

растения, перемещаться в нем, влиять на процессы жизнедеятельности растения, а так же подвергаться метаболизму под действием ферментов или других веществ, содержащихся в растении и почве, с образованием менее (или более) токсичных продуктов. Активность пестицидов зависит от их способности проникать в организм, передвигаться в нём к месту действия и подавлять жизненно важные процессы, от количества пестицидов (измеряется дозой в мг на весь организм или единицу его веса либо концентрацией действующего вещества в рабочем растворе) и времени его воздействия. Избирательность пестицидов зависит от различий в биохимических процессах, ферментах и субстратах у организмов разных видов и, следовательно, от неодинаковой их способности к поглощению пестицидов и детоксикации, а также от применяемых доз [2].

Изучение реакции метилирования солей 2-амино-6-метилпиримидинона-4 показало, что она идёт в основном по атому азота в положение -3 и только в некоторых случаях был обнаружен продукт алкилирования атома кислорода у С-4 2-амино-4-метокси-6-метилпиримидин (выходы до 5-10%). На основании сказанного выше представлял интерес изучение алкилирования 2-амино-6-метилпиримидинона -4 с различными алкилгалогенидами. Исследование этой

реакции с н-бутил-, -гексилбромидами и н -гептилиодидом показало, что во всех случаях происходит образование продуктов 04- алкилирования 2-амино-4-алкокси-6-метилпиримидинов.

Синтезированные соединения были переданы на испытания в научно-исследовательский институт защита растений Республики Узбекистан (НИИЗР РУз) и лабораторию фитотоксикологии института химия растительных веществ Республики Узбекистан (ИХРВ АН РУз) в качестве фунгицидов, бактерицидов, дефолиантов. Испытания препаратов против вертицеллезного и фузариозного увядания (*Verticilium dahliae*, *Fusarium oxysporum*), корневой гнили (*Rhizactonia solani*) и гоммоза (*Xantamonas malva searum*) хлопчатника в УЗ НИИЗР показали, что среди 24 проверенных соединений самыми эффективными оказались препараты, условно названные ХН-7, ХН-8, ХН-9, ХН-10 против *Fusarium oxysporum* и *Verticilium dahliae*. ХН-7 подавляет *Verticilium dahlia* на 75%, *Fusarium oxysporum* на 82%, *Rhizactonia solani* на 88%, *Xantamonas malva* на 90%, а ХН-8 на 92, 75, 98, 92% соответственно [3-4].

Анализ результатов испытания показывает, что в ряду продуктов алкилирования 2-оксо-, -тиоксо-, -аминопиримидинонов-4 высокую фунгицидную и бактерицидную активность, препараты ХН-7, ХН-8 проявляют высокий активность.

Результаты опытов показали, что среди испытанных препаратов значительную дефолирующую активность показали 2-нонилтио-6-фенилпиримидинон-4 и 2-пентилтио-6-метилпиримидинон-4. Листья на кустах хлопчатника был'и полусухие от красноватого до бурого оттенков

Таблица 1.

Дефолиантная и фунгицидная активности производные пиримидинов -
4(30мг/л)

Шифр	Название вещества	Fusarium oxyspru m	Verticiliu m dahlia	Rhizactoni a solani	Xantamonas malvacearu m
ХН-7	2-амино-3-н-бутил- 6- метилпиримидион -4	82	75	88	90
ХН-8	2-амино-3-н- Пентил-6- метилпиримидион -4	75	92	98	92
ХН-9	2-амино-3-н- гексил-6- метилпиримидион -4	39	41	52	26
ХН- 10	2-амино-3-н- гептил-6- метилпиримидион -4	27	38	59	33
ХН- 11	2-амино-3-н-октил- 6- метилпиримидион -4	38	23	32	45
ХН- 12	2-амино-3-н-нонил- 6- метилпиримидион -4	51	36	41	24

ХН-23	2-н-октилтио-6-Фенил пиррими-Динон-4	42	72	83	76
ХН-24	2-н-нонилтио 6-фенилпирилию Димон-4	49	80	75	62

Таблица 2.

Результаты учета всхожести семян, корневой гнили, гоммоза и урожай хлопка – сырца (опыт полевой, экспериментальная база НИИЗ РУз)

№	Варианты	В процентах						Урожай ц/га	Прибавка Урожая ц/га
		Всхожесть семян	Корневая гниль	Гоммоз					
				Семяолая	Листовая	Стеблевая	Каробочная		
1	Контроль-семена зараженная непрогривленная	38,2	6,3	33,0	27,2	8,7	7,3	26,2	-
2	Эталон –семена зараженного гоммозом, протравленные Никамизолоном (700г/100кг)	64,3	2,8	3,3	2,8	0,9	1,4	31,8	5,6
3	Семена, зараженные гоммозом, протравленные ХН-20 (500гр/100кг)	68,9	3,0	3,4	3,0	1,3	1,2	31,9	5,7
4	Семена, зараженная гоммозом, протравленные ХН-21 (500гр/100кг)	69,5	2,5	3,2	2,9	1,0	1,5	33,8	6,6

Общая методика реакций алкилирования С4-С, в различных растворителях.

В трехгорловую колбу, снабженную капельной воронкой, механической мешалкой и обратным холодильником с хлоркальциевой трубкой помешают 10 ммоль 2-оксо-, -тиоксо-, селеноксо-, -амино-, -метилтиопиримидинона-4. Вещество растворяют или суспендируют в 45 мл абсолютного растворителя и при перемешивании прибавляют 0,06 г (2,5 ммоль) гидрида натрия. в образовавшийся раствор натриевой соли соединения при Перемешивают 30 минут и перемешивании по каплям прибавляют 11 ммоль алкилирующего агента

в 2 мл растворителя. Реакционную смесь перемешивают при комнатной температуре 24 часа или нагревании на кипящей водяной бане 4 часа.

-

По окончании реакции содержимое колбы разлагают 150 мл холодной воды. Образовавшийся осадок отфильтровывают, промывают водой, сушат и определяют количество алкилпродукта методом ПМР-спектроскопии.

Выводы

Таким образом, в результате наших исследований показано, что из продуктов алкилирования 2-оксо-, -тиоксо-, аминопиримидинонов-4 высокую фунгицидную и бактерицидную активность имеют препараты ХН-23, ХН-24 и проявляют высокую активность. из испытанных препаратов значительную дефолирующую активность имели 2-нонилтио-6-фенилпиримидинон-4 и 2-пентилтио-6- фенилпиримидинон-4, которые могут быть использованы в народном и сельском хозяйстве.

Литература

1. Нурбаев, Х. И., Орипов, Э. О., Абдуллаев, Н. Д., & Шахидояттов, Х. М. (1997). Алкилирование 2-оксотииоксо-пиримидинонов-4. Химия природ. соед, 35-36.
2. Нурбоев, Х. И., & Джалилов, М. У. ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПИРИМИДИНОВОГО РЯДА И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В МЕДИЦИНЕ.
3. Нурбаев, Х. И., & Муртазаева, Н. К. (2022). Изучение Реакции Алкилирования 2-Тииоксо-6-Фенилпиримидин-4-Она С Высшимиалкилгалогенидами. Central Asian Journal of Medical and Natural Science, 3(2), 443-447. <https://doi.org/10.17605/cajmns.v3i2.692>
4. Нурбоев, Х. И. . (2023). Реакция Алкилирования Пиримидинового Кольца С Различными Алкилгалогенидами. AMALIY VA TIBBIYOT FANLARI

ILMIY JURNALI, 2(5), 45–49. Retrieved from
<https://www.sciencebox.uz/index.php/amaltibbiyot/article/view/6965>

5. Asatullo ug'li, T. D., Uzakovich, J. M., & Kenjayevich, B. A. (2022). Study of Changes in Calciferol in Eggs in Depending on the Season of the Year. Middle European Scientific Bulletin, 24, 310-314.

6. Саттарова, Х. Г., Сувонкулов, У. Т., Халиков, К. М., Ахмедов, А. С., & Тошмуродов, Д. А. (2021). Применение «местных антигенов» в иммунологической диагностике эхинококкоза. In VOLGAMEDSCIENCE (pp. 592-593).

7. Asatullo O'g'li, T. D. (2024, February). CRITERIA AND FACTORS OF TEACHING BIOCHEMISTRY ON THE BASIS OF AN INTEGRATIVE APPROACH IN HIGHER MEDICAL EDUCATION INSTITUTIONS. In International Scientific and Current Research Conferences (pp. 3-6).

8. Saidmurodova Z.A., & Toshmurodov D.A. (2021). NUKLEIN KISLOTALAR KIMYOSI, ULARNING TUZILISHI VA ANAMIYATI. Вестник магистратуры, (2-1 (113)), 10-12.

9. Нурбаев Х.И. (2023). АЛКИЛИРОВАНИЯ 2-ЗАМЕЩЕННЫХ АМИНОПИРИМИДИН-4-ОНА С ВТОРИЧНЫМ БУТИЛЙОДИДОМ. Innovations in Technology and Science Education, 2(7), 232–236. Retrieved from <https://humoscience.com/index.php/itse/article/view/346>

10. Келдиёрова Ш., Тошмуродов Д., & Аликулов Б. (2020). ОБЗОР СОВРЕМЕННЫХ ИССЛЕДОВАНИЙ ПО ФЕРМЕНТАТИВНОМУ ГИДРОЛИЗУ ЛИГНОЦЕЛЛЮЛОЗОСОДЕРЖАЩЕГО СЫРЬЯ. Вестник науки, 1 (3 (24)), 96-102.

11. Nurbaev, H. I. (2023). Synthesis of Starting Compounds and Their Alkylation Reactions in Different Solvents. Scholastic: Journal of Natural and Medical Education, 2(3), 55-58.

12. Nurbaev H.I. (2023). Synthesis of selenium-containing alkyl products. Texas Journal of Engineering and Technology, 17, 33–35. Retrieved from <https://zienjournals.com/index.php/tjet/article/view/3385>