

УДК 632.952

Т. А. Калинина¹, В. И. Баландина¹, В. В. Герман¹,
К. Л. Обыденнов¹, Т. В. Глухарева^{1,2}

¹Уральский федеральный университет имени первого Президента России Б.Н. Ельцина,
620078, Россия, г. Екатеринбург, ул. Мира, 28,
t.a.kalinina@urfu.ru,

²Институт органического синтеза им. И.Я. Постовского, УрО РАН,
620990, Россия, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской/Академическая, 20/22

СИНТЕЗ И ФУНГИЦИДНАЯ АКТИВНОСТЬ НОВЫХ АМИДОВ 1,2,3-ТИАДИАЗОЛИЛ- И 2,3-ДИХЛОРИЗОТИАЗОЛИЛКАРБОНОВЫХ КИСЛОТ

Ключевые слова: фунгицидная активность, системная устойчивость растений, фитопатогенные грибы, 1,2,3-тиадиазол, изотиазол, ацилаланины, амиды, анилины.

До 80% потери урожая сельскохозяйственных растений связана с грибковыми заболеваниями растений. Использование фунгицидов для защиты растений не всегда является эффективным из-за распространения резистентности у фитопатогенных грибов. Перспективными средствами защиты растений являются элиситоры, индуцирующие системную устойчивость растений (СПУ) [1] к патогенам. Объединение в одной молекуле структурных фрагментов, ответственных за различные виды активности, позволит получить соединения, потенциально способные проявлять двойное действие и защищать растение комплексно.

Целью работы являлся синтез комбинированных молекул (рис. 1), содержащих 1,2,3-тиадиазол-5-ил или 3,4-дихлоризотиазол-5-ил карбонильные фрагменты (остатки синтетических активаторов системной устойчивости растений изотианила и тиадинала), а также фрагмент *N*-арилаланина (токсофорную группу ацилаланиновых фунгицидов, например, фуралаксила и металаксила).

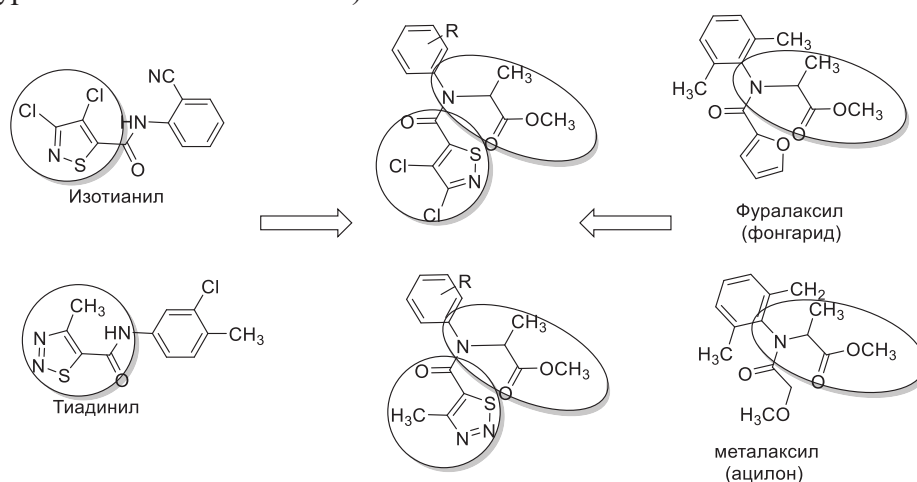


Рисунок 1. Синтез комбинированных молекул

Производные анилина **1a-d** алкилировали метил-2-хлорпропионатом в присутствии йодида калия и карбоната калия в сухом ДМФА. Синтез целевых соединений (рис. 2)

проводили *N*-ацилированием соединений **3a-d** хлорангидридом 4-метил-1,2,3-тиадиазол-5-илкарбоновой кислоты или 3,4-дихлоризотиазол-5-илкарбоновой кислоты в присутствии триэтиламина в сухом бензоле.

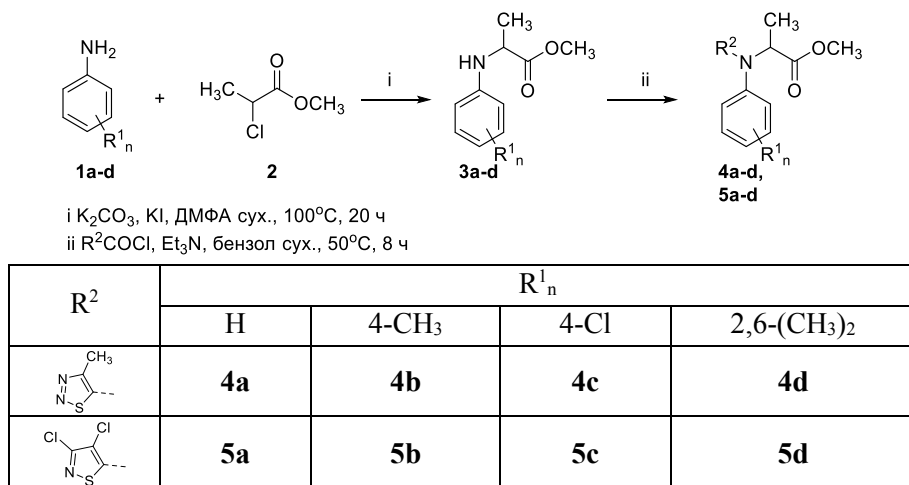


Рисунок 2. Синтез целевых (**4a-d** и **5a-d**) соединений

Для полученных соединений **4a-d** и **5a-d** *in vitro* была исследована фунгицидная активность в отношении 7 штаммов фитопатогенных грибов методом подавления грибка [2]. Вещества (в-ва) были изучены в концентрации 0,1 мг/мл. Полученные данные представлены в таблице. Наибольшую активность проявили производные 2,3-дихлоризотиазола **5a-c**, в отношении *B. cinerea*, *R. solani* и *S. sclerotiorum*.

Таблица

Степень ингибирования роста грибов для соединений **4a-d** и **5a-d**

В-ва	A.s.	B.c.	C.c.	F.s.	P.i.	R.s.	S.s.
4a	19,19±1,44	16,99±1,88	11,61±0,80	5,56±1,63	7,44±1,58	37,63±0,41	13,15±4,22
4b	14,08±0,60	33,78±1,78	16,56±1,40	2,10±1,24	10,13±0,94	32,47±3,71	15,13±5,62
4c	13,54±2,54	50,60±1,42	31,01±1,82	6,17±0,74	14,62±1,30	20,62±1,02	22,01±6,30
4d	10,60±1,70	33,09±2,49	14,71±1,41	12,82±0,25	8,06±0,50	30,88±0,74	15,42±0,79
5a	37,08±0,23	69,11±0,53	33,06±0,97	18,59±0,90	33,44±1,75	68,43±1,16	61,60±1,74
5b	33,22±0,39	55,20±0,69	33,16±0,95	17,54±0,21	34,15±1,32	59,38±1,09	58,04±0,95
5c	38,14±1,13	65,62±0,76	29,24±0,60	20,15±1,10	35,64±0,57	67,44±1,92	60,01±1,10
5d	17,95±0,59	35,80±3,56	7,77±1,41	3,22±2,09	13,79±3,80	29,66±1,47	23,38±2,37

A.s. – *Alternaria solani*; B.c. – *Botrytis cinerea*; C.c. – *Colletotrichum coccodes*; F.s. – *Fusarium solani*; P.i. – *Phytophthora infestans*; R.s. – *Rhizoctonia solani*; S.s. – *Sclerotinia sclerotiorum*.

Таким образом, были получены новые соединения, объединяющие в своей структуре фрагменты синтетических активаторов СПУ растений и фунгицидов группы ацилаланинов и исследована их фунгицидная активность. В дальнейшем планируется определить полумаксимальную ингибирующую концентрацию для наиболее активных соединений **5a-c**, а также изучить способность полученных веществ стимулировать СПУ растений.

Работа выполнена при финансовой поддержке РФФИ, проект № 18-316-20018.

Список литературы

1. Bektas Y., Eulgem T. // *Frontiers in Plant Science*. 2015. Vol. 5. 804.
2. Obydenov K. L., Khamidullina L. A., Galushchinskiy A. N. et al. // *Journal of Agricultural and Food Chemistry*. 2018. Vol. 66. P. 6239–6245.