ATTI Giornate Fitopatologiche
1988, 3, 361-370

IMAZETAPIR (AC 263.499), NUOVO ERBICIDA DI PRE E POST-EMERGENZA DELLA SOIA E DI ALTRE LEGUMINOSE.

A.DAMIANO, C.GUBBIOTTI, D.MAGNANI, M.VIGLIETTA
Cyanamid Italia S.p.A. - Divisione Fitofarmaci

P R E M E S S A

L'Imazetapir (AC 263.499) è un nuovo erbicida messo a punto nei Laboratori di ricerca dell'AMERICAN CYANAMID CO. a Princeton, New Jersey (U.S.A.).

L'AC 263.499 è selettivo per la soia e per altre colture leguminose, quali pisello, fagiolo, fava, favino, lupino, cece, lenticchia, trifoglio ed erba medica. Esso può venire distribuito in pre-semina con incorporamento su soia oppure in pre-emergenza su soia e sulle altre leguminose; su queste colture è possibile impiegarlo anche in post emergenza, che è l'unico intervento consigliabile per il trifoglio e l'erba medica, le quali devono essere trattate quando hanno sviluppato almeno 3-4 foglie trifogliate, se all'impianto, o prima del ricaccio negli anni successivi.

Le proprietà dell'AC 263.499 furono descritte per la prima volta da M.LOS et al. e da T.MALEFYT et al. nel 1984 ed il prodotto è stato già impiegato negli Stati Uniti in applicazioni commerciali limitate grazie ad un permesso di vendita preliminare alla registrazione.

PROPRIETA' CHIMICO-FISICHE

Nomi chimici: acido (±)-2-]4,5-diidro-4-metil-4-(1-metil-etil)-5-osso-1H-imidazol-2-ile]-5-etil-3-piridincarbossilico (Chem.Abstracts),

oppure

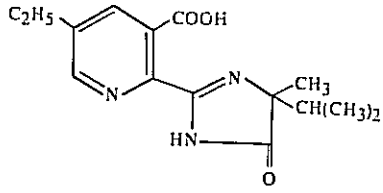
acido (±)-5-etil-2-(4-isopropil-4-metil-5-osso-2-immidazolin-2-ile)-nicotinico (IUPAC).

Famiglia chimica: immidazolinoni.

Marchi commerciali ed altre denominazioni: PURSUIT* (USA e Canada); PIVOT* (Sud America); AC 263.499, CL 263.499.

Nome comune: Imazetapir (ANSI, BSI, proposto ISO).

Formula di struttura:



Formula empirica: $C_{15}H_{19}N_3O_3$

Peso molecolare: 289,34

Stato fisico e odore: solido di colore da biancastro a marrone chiaro con odore leggermente pungente.

Pressione di vapore: inferiore a $1x10^{-7}$ mm Hg a 60°C (il prodotto è stabile e non sublima a temperatura ambiente).

Coefficiente di ripartizione n-ottanolo/acqua (a 25°C): 11 a pH 5, 31 a pH 7, 16 a pH 9 (questi bassi valori indicano che l'AC 263.499 non ha tendenza ad accumularsi nell'ecosistema: per confronto l'analogo coefficiente del DDT è pari a 562.000).

* Trademark American Cyanamid Co.

Solubilità: solubile in alcuni solventi organici; la solubilità in acqua distillata a 25°C è intorno a 1,4 g/l.

Formulazioni: l'Imazetapir viene formulato come soluzione acquosa del suo sale ammonico, contenente differenti concentrazioni dell'acido equivalente secondo le aree geografiche. In Europa verrà probabilmente sviluppata quella con 100 g p.a/l opportunamente addizionata di bagnante per l'eventuale uso in post-emergenza.

DATI TOSSICOLOGICI ED AMBIENTALI

La tossicità del principio attivo Imazetapir, e del suo formulato principale AC 263,499, verso gli animali in genere ed in particolare verso i mammiferi, si è dimostrata molto bassa per esposizione sia in forma acuta che in forma cronica.

Si prevede che in sede di registrazione in Italia al prodotto potrà essere attribuita la attuale IV CLASSE tossicologica ovvero la futura III CLASSE, raggruppante anch'essa gli antiparassitari a minore pericolosità secondo i dettami della Direttiva CEE 78/631 di imminente recepimento.

TOSSICITA' ACUTA

A. Mammiferi

- DL50 orale: Ratti, ambo i sessi: più alta di 5.000 mg/kg p.v.
  Topi, femmine: più alta di 5.000 mg/kg p.v.
  Conigli, femmine: più alta di 5.000 mg/kg p.v.
- DL50 dermale: Conigli, ambo i sessi: più alta di 2.000 mg/kg p.v. per il principio attivo; più alta di 5.000 mg/kg p.v. per il formulato
- Irritazione: Occhi: su coniglio il principio attivo risulta irritante con ristabilimento completo in 7 giorni, mentre il formulato non è irritante

Pelle: su coniglio il principio attivo risulta moderatamente irritante mentre il formulato è non irritante.

- Inalazione: Ratti, ambo i sessi: per il principio attivo la CL50 fu più alta della massima concentrazione ottenibile (3,27 e 4,21 mg/l, analitica e gravimetrica rispettivamente) e per il formulato lo stesso (maggiore di 2,67 mg/l analitica).

B. Animali non mammiferi

Il prodotto si è dimostrato pochissimo tossico per gli uccelli (DL50 orale acuta: più alta di 2.150 mg/kg p.v; CL50 nella dieta per 8 giorni: più alta di 5.000 mg/kg p.v.), per i pesci (CL50 per 96 ore: da 240 a 420 mg/l) e per gli artropodi (CL50 per 48 ore su Daphnia magna e DL50 su Apis mellifica ambedue più alte di 100 mg/l o per ape rispettivamente).

TOSSICITA' CRONICA

Gli studi di tossicità a medio termine nella dieta, di teratogenesi e di mutagenesi hanno evidenziato che gli animali di laboratorio non presentano alcun effetto anche se sottoposti a dosi molto alte (10.000 ppm ai cani e ai ratti per 90 giorni) ed inoltre che il prodotto non è teratogeno a dosi più alte di 1.000 mg/Kg p.v/giorno sui conigli e più alte di 1.125 mg/Kg p.v/giorno sui ratti, né mutageno secondo una batteria di 6 saggi specifici.

METABOLISMO E RESIDUI

L'Imazetapir è metabolicamente inerte per gli animali e non si accumula nel sangue o nei tessuti: entro due giorni dalla somministrazione esso viene eliminato per le normali vie fisiologiche (urine, feci, sudore) senza subire trasformazioni all'interno dell'organismo.

Capre in lattazione e galline ovaiole alimentate per una settimana consecutiva con dosaggi di Imazetapir 50 volte superiori al livello di esposizione massimo (tenendo conto del residuo accettabile di 0,1 ppm proposto per i se

mi di soia e calcolando un contenuto del 25% di tali semi nel mangime delle capre e del 50% in quello delle galline) hanno mostrato di non accumulare alcun residuo nel latte, nella carne o nelle uova.

Nelle piante di soia l'Imazetapir è rapidamente metabolizzato in composti non attivi, tanto che la selettività è completa ed i residui riscontrati nella granella dopo il trattamento rimangono sempre al di sotto del limite di sensibilità del metodo analitico (0,1 ppm), che costituisce anche il livello massimo di residuo accettabile proposto per il prodotto.

Il meccanismo di azione nelle infestanti suscettibili è stato ampiamente studiato per l'Imazetapir e gli altri immidazolinoni (D.L.SHANER et al., 1984). Essi causano anomalie nella sintesi proteica inibendo l'enzima sintetasi acetoidrossiacida (in inglese siglato AHAS) che presiede alla prima reazione nella catena di biosintesi degli amminoacidi alifatici a struttura ramificata valina, leucina ed isoleucina: ciò porta ad interferenze nella crescita cellulare sino a vere a proprie necrosi ed alla morte finale delle piante sensibili all'erbicida.

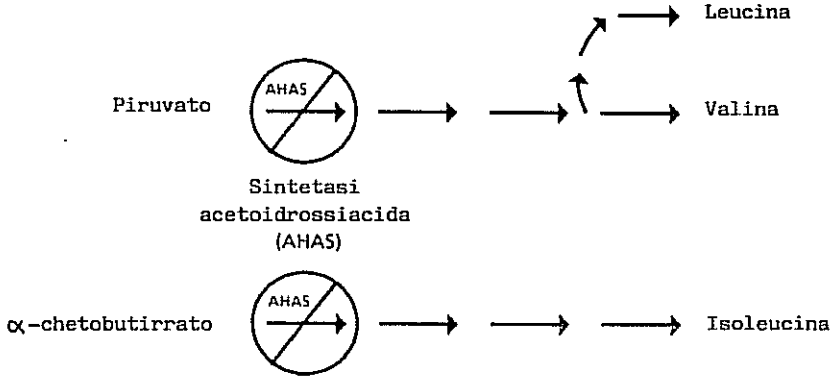


Figura 1 - Inibizione da parte dell'Imazetapir del processo di biosintesi di amminoacidi a catena ramificata

Il meccanismo di biosintesi dei tre amminoacidi citati avviene solo nelle piante mentre non si verifica negli animali; l'estrema specificità d'azione nei suoi riguardi, comune a tutti gli immidazolinoni, concorre quindi a spiegare la bassissima tossicità dimostrata da questo tipo di composti verso gli organismi animali in genere.

COMPORTAMENTO NEL TERRENO

In condizioni di campo l'AC 263.499 può rimanere attivo nel terreno per diverse settimane o alcuni mesi in funzione delle condizioni climatiche, delle dosi, del metodo e dell'epoca di applicazione: periodo di siccità, basse temperature e limitate lavorazioni tendono a prolungare la permanenza dell'Imazetapir nel terreno.

Il prodotto viene degradato principalmente per azione microbica, per assorbimento da parte delle piante e per fotolisi in presenza di acqua, mentre è stabile all'idrolisi in assenza di luce.

SELETTIVITA' ED ATTIVITA' ERBICIDA

Le più diffuse varietà di soia coltivate nei principali paesi produttori del mondo sono risultate resistenti all'AC 263.499 anche a dosi maggiorate rispetto a quelle comunemente consigliate, sia che il prodotto fosse stato distribuito in pre-semina con incorporamento, in pre-emergenza o in post-emergenza.

Infatti la soia e le altre colture leguminose citate, come si è accennato anche sopra, possiedono la capacità di metabolizzare e detossificare rapidamente l'Imazetapir al contrario delle infestanti sensibili dove tale processo non avviene o è molto più lento. In esse l'AC 263.499 viene prontamente assorbito dalle radici o dalle foglie ed è quindi traslocato per via xilematica o floematica, accumulandosi nei punti di accrescimento meristematico. In genere la conseguente azione dell'AC 263.499 non è particolarmente veloce o appariscente, giacché le infestanti non ancora nate possono emergere ma arrestano il loro sviluppo alle primissime foglie e quindi muoiono, mentre quelle già nate smettono immediatamente di crescere, possono subire arrossamenti o clorosi, distorsioni, emissioni di getti avventizi o necrosi più o meno accentuati e nel giro di qualche settimana anch'esse muoiono; in ambedue i casi tuttavia la competizione verso la coltura cessa quasi subito a seguito del trattamento. Una sufficiente umidità del terreno o un leggero

interramento dopo la distribuzione dell'AC 263.499 assicurano la migliore efficacia.

Le dosi di impiego consigliate variano fra 75 e 100 g p.a/ha in acqua sufficiente ad assicurare una uniforme distribuzione.

Le principali infestanti sensibili all'AC 263.499 sono quelle di seguito elencate. Per alcune specie la sensibilità erbicida varia con il momento dell'intervento: così Chenopodium, Polygonum aviculare e Portulaca appaiono meglio controllate se trattate in pre-emergenza, mentre Abutilon, Anagallis e Xanthium sono più facilmente distrutte in post-emergenza. Come si può vedere l'AC 263.499 possiede uno spettro d'azione pressoché completo contro tutte le più pericolose e diffuse infestanti primaverili-estive della soia e delle altre colture citate.

INFESTANTI SENSIBILI

A. DICOTILEDONI

Abutilon theophrasti

Amaranthus spp.

Anagallis arvensis

Chenopodium spp.

Crucifere

Datura stramonium

Fumaria officinalis

Galium aparine

Hibiscus trionum

Lamium spp.

Mercurialis annua

Oxalis spp.

Polygonum spp.

Portulaca oleracea

Solanum nigrum

Spergula arvensis

Stellaria media

Veronica spp.

Xanthium strumarium

B. GRAMINACEE

Digitaria sanguinalis

Echinochloa Crus-galli

Panicum dichotomiflorum

Setaria spp.

Sorghum halepense (da seme)

RIASSUNTO

Vengono descritte le principali caratteristiche chimico-fisiche, tossicologiche, di impatto ambientale ed agronomiche del nuovo principio attivo Imazetapir (siglato AC 263.499) scoperto dalla American Cyanamid Co., USA.

L'Imazetapir appartiene alla classe di erbicidi denominati immidazolinoni e presenta bassissima tossicità verso gli animali in genere, scarsa tendenza ad accumularsi nell'ecosistema, meccanismo d'azione specifico che blocca la biosintesi degli amminoacidi valina, leucina ed isoleucina, propria esclusivamente delle piante, e induce disordini nel metabolismo proteico con arresto della crescita, necrosi e morte delle infestanti sensibili. Soia, pisello, fagiolo, fava, favino, lupino, cece, lenticchia, trifoglio ed erba medica non subiscono l'azione dell'Imazetapir perché riescono a metabolizzarlo e degradarlo rapidamente a composti innocui.

L'AC 263.499 può essere distribuito su soia in pre-semina con incorporamento ovvero in pre-emergenza di questa coltura e delle altre leguminose, tranne trifoglio ed erba medica, alla dose di 75-100 g p.a/ha; in post-emergenza alla medesima dose è possibile intervenire su tutte le colture citate al

lo stadio di 3-4 foglie trifogliate o su medica già impiantata prima del ri caccio.

Le erbe sensibili sono quelle più diffuse nella soia e nelle altre legumino se per cui l'AC 263.499 si è dimostrato selettivo.

SUMMARY

IMAZETHAPYR (AC 263,499), NEW PRE AND POST-EMERGENCE HERBICIDE IN SOYBEANS AND OTHER LEGUME CROPS.

The main physical, chemical, toxicological, environmental and biological characteristics of Imazethapyr are described

Imazethapyr (coded AC 263.499) is a new herbicidal active ingredient develo ped by American Cyanamid Co., USA, and belongs to the class of chemicals na med imidazolinones. It shows a very low toxicity for all animals and will not bioaccumulate in the environment. AC 263.499 herbicide kills weeds by a specific mode of action that checks the biosynthesis of three aminoacids, valine, leucine and isoleucine, found only in plants, causing a disruption in protein metabolism which, in turns, leads to cessation of growth, necro- sis, and death. Soybean and other legume plants (peas, Phaseolus beans, broadbeans, horsebeans, lupins, chickpeas, lentils, clover and alfalfa) esca pe Imazethapyr action because they can rapidly metabolize and degrade the herbicide to non-toxic compounds.

AC 263.499 can be applied in soybeans pre-sowing incorporated or, in this crop as well as in all other legumes, except clover and alfalfa, pre-emergen ce at a rate of 75-100 g a.i/ha; at the same rate is however possible to spray all above crops post-emergence when they have developed 3-4 trifolia- te leaves or in implanted alfalfa before regrowth.

Weeds susceptible to AC 263.499 are those more common in soybeans or in all other legume crops for which the product appears to be selective.

BIBLIOGRAFIA

1. M.LOS, P.J.WEPPLO, A.K.RUSSEL, B.L.LENCES, P.L.ORWICK - o-(5-oxo-2-imidazolin-2-yl) arylcarbossilates: a new class of herbicides-4. AC 263,499, a herbicide for use in legumes. - (Abstract) Book of Abstracts: 100th Meeting Am.Chem.Society, Abstract 30 PEST., 1984.

2. T.MALEFYT, P.A.MARC, M.LOS, P.L.ORWICK, K.UMEDA - AC 263.499, a new broad spectrum herbicide for soybeans and other leguminous crops. - (Abstract) WSSA Abstract, 1984 Meet. Wed Sci. Soc. Amer., 24:18, 1984.

3. T.R.PEOPLES, T.WANG, R.R.FINE, P.L.ORWICK, S.E.GRAHAM, K.KIRKLAND - AC 263.499: a new broad spectrum herbicide for use in soybeans and other legumes. - Proceedings 1985 Brit. Crop. Conf. - Weeds, 2:99-106, 1985.

4. D.L.SHANER, P.C.ANDERSON, M.A.STIDHAM - Imidazolinones: potent inhibitors of acetohydroxyacid synthase. - Plant Physiol. 76:545-545, 1984.

5. AMERICAN CYANAMID CO. - Technical Bullettin: IMAZETHAPYR herbicide (AC 263.499). - Agricultural Research Division, Princeton, New Jersey, USA. Release FHT+0255-5M-8706, 1987, 22 pag.