

DE-511: UNA TRIAZOLOPIRIMIDINA SULFONANILIDE PER IL DISERBO DEI CEREALI TIPO FRUMENTO, DEL MAIS E DEL RISO.

M. RE, L. BACCI, R. BAROTTI, S. BONVICINI, A. CARONE, N. DALLA VALLE, M. GUIDUCCI, E. TESCARI

DowElanco Italia S.r.l.

RIASSUNTO

DE-511 (nome comune ISO: metosulam) è una molecola erbicida appartenente alle triazolopirimidine, famiglia chimica scoperta dalla DowElanco Inc. di Indianapolis (Indiana - U.S.A.). Sono sensibili alla attività erbicida di DE-511 le dicotiledoni e le monocotiledoni non graminacee, annuali e perennanti, nelle quali la molecola blocca la biosintesi degli amminoacidi a catena ramificata, agendo da inibitore dell'enzima ALS. La molecola presenta un profilo tossicologico ed ecotossicologico molto favorevole.

DE-511 è risultato avere efficacia erbicida nei confronti di numerose infestanti dei cereali tipo frumento, per i quali si propongono dosi di applicazione in post-emergenza di 10-15 g/ha p.a.; del mais, per il quale sono previste dosi di applicazione in pre-emergenza di 20-30 g/ha p.a.; infine del riso, in cui hanno dato soddisfacenti risultati dosi di applicazione comprese fra 40 e 75 g/ha p.a., in pre-semina ed in post-emergenza.

SUMMARY

DE-511: A TRIAZOLOPYRIMIDINE SULFONANILIDE AS SELECTIVE HERBICIDE FOR WINTER CEREALS, MAIZE AND RICE.

DE-511 (common name ISO: metosulam) is an herbicide molecule of the chemical family triazolopyrimidine sulfonanilides, discovered by DowElanco Inc. of Indianapolis (Indiana -U.S.A.). Dicots and non grass monocots, annual and perennial, are sensitive to DE-511, that inhibits ALS enzyme in the branched chain amino acid synthesis. The molecule has a favourable toxicological and environmental profile.

DE-511 resulted to have herbicidal efficacy versus many weeds infesting: winter cereals where 10-15 g/ha a.i. in post-emergence are the proposed application rates; maize, where application rates of 20-30 g/ha a.i. in pre-emergence provided the best results; rice, in which both pre-sowing and post-emergence applications gave interesting results at rates ranging from 40 to 75 g/ha a.i..

Introduzione

DE-511 è una molecola erbicida appartenente alla famiglia chimica delle triazolopirimidine sulfonanilidi, scoperta dalla DowElanco Inc. di Indianapolis (Indiana - U.S.A.).

Attiva sia in pre-emergenza che in post-emergenza, la molecola è risultata avere efficacia erbicida nei confronti di numerose specie dicotiledoni e monocotiledoni non graminacee: fra queste specie molte sono infestanti di grande diffusione.

DE-511 è in corso di sviluppo in Italia e nei Paesi della Comunità Europea, come diserbante selettivo per cereali autunno-vernini, mais e riso.

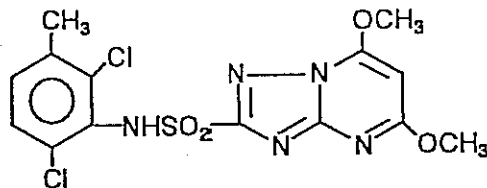
Le caratteristiche chimico-fisiche, tossicologiche ed ecotossicologiche di DE-511 e la sua attività biologica sono descritte in questo lavoro. Viene inoltre riportato un riassunto dei risultati della sperimentazione condotta sino ad oggi.

Caratteristiche chimico-fisiche

Nome comune (ISO): Metosulam

Nome chimico (IUPAC): N-(2,6-dicloro-3-metilfenil)-5,7-dimetossi [1,2,4] triazolo [1,5-] pirimidina-2-sulfonamide

Formula di struttura:



Formula empirica: $C_{14}H_{13}Cl_2N_5O_4S$

Peso molecolare: 418,264

Stato fisico: solido; polvere di colore crema-marrone

Punto di fusione: 210-211,5°C

Solubilità in acqua: 200 mg l⁻¹ (a 20°C; pH 7,5)

Solubilità in tamponi acquosi: 100 mg l⁻¹ (a 20°C; pH 5,0)

700 mg l⁻¹ (a 20°C; pH 7,0)

5600 mg l⁻¹ (a 20°C; pH 9,0)

Costante di dissociazione: pKa = 4,8

Tensione di vapore: 9×10^{-15} mm Hg (a 25°C)

Coefficiente di partizione n-ottanolo/acqua:

a 20°C	Acqua distillata:	log Po/W = 0,9778
	Soluzione tamponata pH5:	" = 2,12
	Soluzione tamponata pH7:	" = 2,46
	Soluzione tamponata pH9:	" = 3,08

DE-511 non è infiammabile, non è ossidante, non è esplosivo.

Caratteristiche tossicologiche

Tossicità acuta

DL50 orale ratto (Fischer 344): $> 5000 \text{ mg Kg}^{-1}$ peso corporeo

DL50 dermale coniglio (NZW): $> 2000 \text{ mg Kg}^{-1}$ peso corporeo

Per inalazione ratto (Fischer

344) CL50 alla massima

concentrazione ottenibile: $> 1,9 \text{ mg l}^{-1}$

Irritazione dermale coniglio: nessuna

Irritazione oculare coniglio: inferiore ai valori richiesti
per la classificazione CEE

Tossicità cronica

NOEL: 10 mg Kg^{-1} die peso corporeo (90 giorni ratto)

Mutagenicità: DE 511 è classificato come NON MUTAGENO (negativo
in cinque prove di mutagenicità in vitro/in vivo).

Caratteristiche ecotossicologiche

Effetti sugli uccelli

Tossicità orale acuta

Anatra selvatica: DL50 $> 2000 \text{ mg/Kg}$

Quaglia della Virginia: DL50 $> 2250 \text{ mg/Kg}$

Tossicità a breve termine

Anatra selvatica: CL50 $> 5620 \text{ ppm}$

Quaglia della Virginia: CL50 $> 5620 \text{ ppm}$

Effetti sugli organismi acquatici

Tossicità acuta nei pesci

Trota arcobaleno: non tossico

Lepomis macrochirus (Bluegill): non tossico

Tossicità subacuta

Trota arcobaleno: NOEL $24,4 \text{ mg/l}$ a 21 giorni

Tossicità acuta per la Daphnia magna: non tossico

Riproduzione della Daphnia magna: NOEL $2,28 \text{ mg/l}$ a 21 giorni

Effetti su altri organismi

Tossicità acuta per le api: DL50 $> 50 \mu\text{g.ape}^{-1}$

Tossicità da contatto: NOEL $> 100 \mu\text{g/ape}^{-1}$

DL50 $> 100 \mu\text{g/ape}^{-1}$ a 48 ore

Insetti pronubi: non acutamente tossico

Tossicità per i lombrichi: CL50 $> 1000 \text{ ppm}$

Metabolismo nelle piante, nel terreno, negli animali

Studi condotti su frumento con DE-511 marcato con C^{14} hanno
mostrato, a seguito di un'applicazione all'inizio della levata

del cereale (stadio BBCH = 30) di 100 g/ha p.a. ed a campionamenti fatti 14 giorni dopo il trattamento, che il prodotto caduto sulla porzione aerea delle piante viene assorbito in proporzione inferiore al 2%. DE 511 è stato rinvenuto nelle piante di frumento tal quale o, in piccola parte, trasformato in due soli metaboliti: il 3-idrossimetil- fenil derivato ed il corrispondente glicoside. A maturazione nella granella è stata rinvenuta una radioattività pari a 0,01% di quella applicata; nella paglia tale radioattività era pari a 0,125% di quella applicata. Tali valori, espressi in termini di equivalenti di DE-511 corrispondono a 0,005 ppm e 0,05 ppm rispettivamente.

La degradazione di DE-511 nel terreno, avviene prevalentemente per via microbiologica, mentre l'idrolisi chimica non è fenomeno di grande rilievo. La degradazione di DE-511 non è quindi dipendente dall'alcalinità del suolo. Sei prove condotte in diverse località europee su diversi terreni hanno indicato un'emivita media di DE-511 nel terreno di 20 giorni (3-47 giorni) (Snel et al. - 1993).

Nell'acqua, DE-511 è risultato stabile all'idrolisi ($T=25^{\circ}\text{C}$) a valori di pH compresi fra 5 e 9 (Snel et al. - 1993).

Ulteriori studi con DE-511 marcato sono stati condotti per definire il metabolismo della molecola in carne e latte vaccini: ipotizzando che il cereale immaturo rappresenti il 100% della dieta delle bovine, sono stati somministrati in due razioni giornaliere 16 Kg fieno/animale die per 4 settimane. Il foraggio era stato trattato affinché ai 4 gruppi di animali oggetto del test venissero somministrate dosi giornaliere di DE-511 pari a 0, 2, 6 e 20 mg/animale die, rispettivamente.

In nessuno dei quattro gruppi si sono ottenuti residui di DE-511 rilevabili analiticamente (NOP: 0,01 mg/l).

Potenziale residuale

Numerose prove condotte in diversi paesi della Comunità Europea hanno mostrato che DE-511 non determina fenomeni di fitotossicità da residui quando l'avvicendamento colturale faccia seguire colture dicotiledoni. In Italia sei prove a blocchi randomizzati hanno confermato questi risultati su bietola, girasole e soia di II raccolto.

Attività biologica e selettività

DE 511 blocca la divisione cellulare mediante inibizione dell'enzima ALS (acetolattato sintetasi) che catalizza la prima tappa nella biosintesi degli amminoacidi a catena ramificata valina ed isoleucina, essenziali per la crescita delle piante (Gerwick et al. - 1990).

La molecola viene assorbita sia dai semi in germinazione sia della pianta emerse: in queste ultime penetra sia per via radicale che per via fogliare.

Clorosi, decolorazione e necrosi sono i sintomi dell'attività erbicida di DE-511 nelle piante emerse.

La morte delle piante sensibili sopraggiunge 2-4 settimane dopo il trattamento, benché l'attività di crescita venga interrotta già nelle ore immediatamente successive all'applicazione. DE-511 è risultato essere selettivo per frumento tenero e duro, orzo, triticale, avena e segale, riso, mais e graminacee da

prato. La molecola non ha manifestato alcuna attività erbicida di rilievo nei confronti delle più comuni specie graminacee infestanti le suddette colture.

Spettro di azione

DE-511 ha dimostrato di avere attività erbicida nei confronti di un ampio spettro di infestanti dicotiledoni e monocotiledoni non graminacee annuali e perennanti, normalmente presenti nelle colture di cereali autunno-vernini, di mais e di riso.

Suddivise secondo l'ambiente culturale di maggiore diffusione, sono riportate di seguito le specie infestanti di maggiore interesse sensibili a DE-511.

Le tabelle sono state costruite aggregando i risultati di numerose prove sperimentali impostate a blocco randomizzato con 3 o 4 ripetizioni eseguite in Italia negli anni 1990-1993; le prove sono state condotte nelle aree italiane più vocate alle colture in esame utilizzando una formulazione sperimentale contenente 100 g/l di DE-511 in sospensione concentrata.

Efficacia erbicida di DE-511 applicato in pre-semina e post-emergenza su riso in ambiente italiano 8 settimane dopo l'applicazione (1991-1993)

Specie infestante	Dose di applicazione		
	Pre-semina 40 g/ha p.a.	Post-emergenza 60 g/ha p.a. 75 g/ha p.a.	
<i>Alisma plantago-aquatica</i>	+++	+++	+++
<i>Ammania coccinea</i>	ND	+++	+++
<i>Bulboschoenus maritimus</i>	+++	++	+++
<i>Bidens tripartita</i>	ND	+++	+++
<i>Butomus umbellatus</i>	+++	++	+++
<i>Cyperus difformis</i>	ND	+	++
<i>Heteranthera limosa</i>	ND	+++	+++
<i>Heteranthera reniformis</i>	-	+	+
<i>Lindernia pyxidaria</i>	ND	+++	+++
<i>Schoenoplectus mucronatus</i>	+++	+++	+++
<i>Sparganium erectum</i>	ND	++	+++

L'efficacia erbicida è espressa in termini di contenimento percentuale dell'infestazione rispetto al testimone non trattato.

>90% contenimento: +++

75-90% contenimento: ++

50-75% contenimento: +

<50% contenimento: -

Dato non disponibile: ND

Efficacia erbicida di DE-511 applicato in
post-emergenza su cereali allo stadio di sviluppo
della coltura di ZD25-30 (1990-1993)

Specie infestante	Dose di applicazione g/ha p.a.	
	10	15
<i>Aphanes arvensis</i>	++	+++
<i>Arabidopsis thaliana</i>	+++	+++
<i>Fallopia convolvulus</i>	++	+++
<i>Capsella bursa-pastoris</i>	+++	+++
<i>Cerastium arvense</i>	++	++
<i>Chrysanthemum segetum</i>	++	++
<i>Cirsium arvense</i>	—	+
<i>Daucus carota</i>	+++	+++
<i>Fumaria officinalis</i>	+	++
<i>Galium aparine</i>	++	++(+)
<i>Lamium spp.</i>	++	+++
<i>Matricaria chamomilla</i>	++	+++
<i>Papaver rhoeas</i>	+	+
<i>Polygonum aviculare</i>	++	+++
<i>Sinapis arvensis</i>	+++	+++
<i>Stellaria media</i>	+++	+++
<i>Veronica persica</i>	++	++
<i>Veronica hederifolia</i>	++	++
<i>Viola arvensis</i>	+	+
<i>Viola tricolor</i>	—	—

L'efficacia erbicida è espressa in termini di contenimento percentuale dell'infestazione rispetto al testimone non trattato.

>90% contenimento: +++

75-90% contenimento: ++

50-75% contenimento: +

<50% contenimento: —

Efficacia erbicida di DE-511 applicato in pre-emergenza
su mais in ambiente italiano 35 giorni dopo l'applicazione
(1991-1993)

Specie infestante	Dose di applicazione	
	20 g/ha p.a.	30 g/ha p.a.
<i>Abutilon theophrasti</i>	—	—
<i>Amaranthus retroflexus</i>	++	+++
<i>Fallopia convolvulus</i>	+	+
<i>Chenopodium album</i>	++	+++
<i>Chenopodium polyspermum</i>	+++	+++
<i>Galinsoga parviflora</i>	+++	+++
<i>Linaria minor</i>	+++	+++
<i>Matricaria chamomilla</i>	+++	+++
<i>Polygonum aviculare</i>	—	+
<i>Polygonum persicaria</i>	+++	+++
<i>Solanum nigrum</i>	+++	+++

L'efficacia erbicida è espressa in termini di contenimento percentuale dell'infestazione rispetto al testimone non trattato.

>90% contenimento: +++

75-90% contenimento: ++

50-75% contenimento: +

<50% contenimento: —

Conclusioni

DE-511 è risultato essere una molecola erbicida che bene può inserirsi nei programmi di diserbo delle colture graminacee più diffuse in Italia: la sua selettività, la sua efficacia contro infestanti dicotiledoni e monocotiledoni non graminacee di grande diffusione sia in applicazioni di pre-semina/pre-emergenza che di post-emergenza, l'assenza di effetti residuali sulle colture in rotazione sono stati verificati e riferiti in questo articolo.

La molecola è tuttora oggetto di studio in particolar modo per quel che concerne la sua miscibilità con altri principi attivi e l'inserimento in programmi di diserbo tecnologicamente avanzati.

Lavori citati

- Gerwick B.C., Subramanian M.V., Loney-Gallant V.I. (1990). Mechanism of Action of the 1,2,4-triazolo (1,5-a) pyrimidines. Pestic. Sci. 29, 357-364.

- Snel M., Watson P.A., Gray N.R., Kleschick W.A., Carson C.M. (1993). DE-511, a new low-rate triazolopyrimidine sulfonanilide herbicide for control of broad-leaved weeds in cereals and maize. Mededelingen Fac. Landbouwwetenschappen Univ. Ghent 58(3a), 845-852.