

ОБЛАСТИ ПРАКТИЧЕСКОГО ИСПОЛЬЗОВАНИЯ НЕКОТОРЫХ СИНТЕЗИРОВАННЫХ СОЕДИНЕНИЙ

Изучена возможность использования некоторых синтезированных соединений в качестве биоактивных препаратов. Испытания химических соединений **8, 10, 24б, 26б** на гербицидную активность проводили в лаборатории препаративных форм биологических испытаний ГБУ «Научно-исследовательский технологический институт гербицидов и регуляторов роста растений».

Для приготовления препаративной формы образцов соединений **8, 10, 24б, 26б** использовали ароматический растворитель нефрас А 150/330, в качестве поверхностно-активного вещества – оксиэтилированный изонилфенол – неол АФ9-12. Все образцы препаратов были приготовлены в форме эмульгирующихся концентратов, которые хорошо удовлетворяют требованиям, предъявляемым к эмульгирующимся концентратам пестицидов.

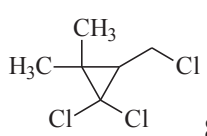
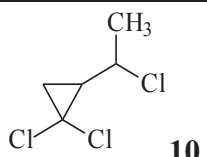
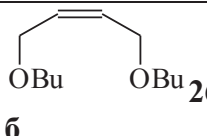
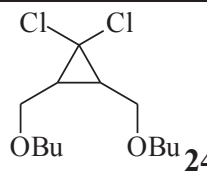
Оценку гербицидной активности концентратов проводили в лабораторных условиях на проростках двудольных (горох) и однодольных (пшеница) растений, которые помещали в чашки Петри, содержащие водные эмульсии препаратов с концентрацией действующих веществ 5 мг/л и 10 мг/л (50 кг/га и 100 кг/га) для гороха и 50 мг/л и 100 мг/л для пшеницы.

В качестве эталона использовали известный гербицид Октапон-экстра, который зарегистрирован и включен в список пестицидов, разрешенных для применения на территории РФ [1]. Чашки Петри выдерживали в термостате в течение 3 суток при температуре 24–25°C, после чего измеряли длину и определяли вес проростков. Степень ингибирования роста и массы определяли в % по отношению к контролю (вариант без химических препаратов). Повторность опытов – трехкратная (таблица 1).

Анализ полученных данных показывает, что синтезированные соединения проявляют умеренную гербицидную активность на проростках двудольных и однодольных растений, тогда как результаты препаратов 10, 24б и 26б по степени подавления роста гороха приближают к эталону. Также отмечена ростостимулирующая активность (ингибирование со знаком плюс) в отношении массы побегов проростков гороха для образца 8, что представляет интерес для его применения в качестве регулятора роста растений.

Большинство из полученных соединений является потенциальными биологически активными веществами, аналоги которых находят широкое применение в области фармацевтики [2].

Таблица 1 – Результаты первичного скрининга соединений 8, 10, 24б, 26б

Препарат	Концентрация, мг/л	Горох		Пшеница	
		Средняя длина побега, мм (% ингибирования)	Средняя масса побега, г (% ингибирования)	Средняя длина побега, мм (% ингибирования)	Средняя масса побега, г (% ингибирования)
Контроль	–	30.9 (–)	0.48 (–)	104.5 (–)	0.19 (–)
	–	37.0* (–)	0.55* (–)	–	–
 8	5	23.8 (23.0)	0.54 (+13)	–	–
	10	22.2 (28.2)	0.52 (+8)	–	–
	50	–	–	44.9 (34)	0.11 (18)
	100	–	–	33.9 (41)	0.10 (23)
 10	5	26.6 (14)	0.45 (6)	–	–
	10	18.5 (40)	0.49 (+4)	–	–
	50	–	–	74.6 (28)	0.15 (23)
	100	–	–	71.9 (31)	0.13 (32)
 26	50	22.0* (41)	0.5* (9)	33.6 (46)	0.08 (32)
	100	20.0* (46)	0.48* (13)	33.1 (47)	0.09 (23)
 24	50	22.4* (40)	0.52* (6)	47.3 (24)	0.09 (19)
	100	16.8* (55)	0.49* (11)	33.6 (46)	0.05 (53)
Эталон – Октапон-экстра	5	15.6 (50)	0.52 (+9)	–	–
	10	10.5 (66)	0.47 (+1)	–	–
	50	11.6* (69)	0.46* (16)	31 (63)	0.04 (64)
	100	9.6* (74)	0.44* (20)	21 (76)	0.03 (73)

Примечание. *Опыты с концентрацией действующих веществ 50 кг/га и 100 кг/га

Для комплексного исследования физиологической активности синтезированных соединений был осуществлен первичный скрининг с помощью компьютерной программы Prediction of Activity Spectra for Substances (PASS), разработанной в Научно-исследовательском институте биомедицинской химии РАМН и позволяющей прогнозировать более 3500 фармакологических эффектов и механизмов действия на основе структурной формулы химического соединения [3].

Таблица 2 – Прогнозируемая фармакологическая активность соединений согласно компьютерной программе PASS

Прогнозируемая активность	Вероятность, P _a / P _i										
	Соединение										
	12	20a	24b	27a	29b	31b	32a	33a	35a	36a	37a
Acylcarnitinehydrolaseinhibitor	0.889	0.626	0.780	0.525	–	0.779	0.780	0.774	0.708	–	–
Sugar-phosphataseinhibitor	0.879	0.700	0.894	0.798	0.896	0.602	0.736	0.567	0.792	0.762	0.822
IgA-specific serine endopeptidase inhibitor	0.858	0.561	0.831	0.527	0.795	0.561	0.659	0.764	0.740	0.761	0.776
Aspulvinonedimethylallyltransferase inhibitor	0.809	0.835	0.781	0.898	0.813	0.642	–	–	0.815	0.866	0.879
Acrocyllindropepsininhibitor	0.885	0.856	0.851	0.785	0.732	0.610	0.748	0.759	0.742	–	–
Phobicdisorderstre- atment	0.860	0.732	0.876	0.759	0.840	0.780	0.878	0.800	0.827	0.841	0.867
Omptininhibitor	0.708	0.578	0.523	0.661	0.539	0.619	0.548	0.693	0.697	0.781	0.826
Antiseborrheic	0.765	0.823	0.625	0.738	–	0.820	–	–	0.668	0.707	0.755
Saccharopepsininhibitor	0.885	0.856	0.851	0.785	0.723	0.610	0.748	0.759	0.742	0.667	0,745
L-glutamatoxidaseinhibitor	0.583	–	–	0.604	–	–	–	–	0.560	0.692	0.785
Taurinedehydrogenaseinhibitor	0.869	0.569	0.507	0.714	0.570	0.731	0.580	0.563	0.708	0.827	0.863
Cardiovascularana- leptic	0.752	0.567	0.487	–	–	0.813	–	–	–	–	–
Chymosininhibitor	–	0.856	0.851	–	–	0.610	0.748	0.759	0.742	0.667	0.745
Antineurotic	0.735	0.759	0.589	–	–	0.690	0.813	0.514	–	–	–

Согласно прогнозу программы PASS (таблица 2) данные вещества являются эффективными ингибиторами, которые способны замедлять протекание ферментативных реакций с вероятностью более 70%. Кроме того, практически все синтезируемые соединения, кроме **29b**, **32b** и **33a**, обладают антисеборейной активностью.

ЛИТЕРАТУРА

1. Государственный каталог пестицидов и агрохимикатов, разрешенных к применению на территории Российской Федерации. – М.: Минсельхоз России, 2011. – С. 224–397.
2. Машковский М. Д. Лекарственные средства: В 2 т. – М.: Новая волна. – 2002. – Т. 1. – С. 448.
3. Poroikov V., Filimonov D. PASS Online. – URL: <http://www.pharmaexpert.ru/PASSOnline/index.php>. – Дата обращения: 16.08.2013.