

Исабаева Меруерт Бердешевна

О БИОЛОГИЧЕСКОЙ АКТИВНОСТИ ПРОИЗВОДНЫХ ГУАНИДИНА

Адрес статьи: www.gramota.net/materials/1/2010/9/18.html

Статья опубликована в авторской редакции и отражает точку зрения автора(ов) по рассматриваемому вопросу.

Источник

Альманах современной науки и образования

Тамбов: Грамота, 2010. № 9 (40). С. 62-64. ISSN 1993-5552.

Адрес журнала: www.gramota.net/editions/1.html

Содержание данного номера журнала: www.gramota.net/materials/1/2010/9/

© Издательство "Грамота"

Информация о возможности публикации статей в журнале размещена на Интернет сайте издательства: www.gramota.net

Вопросы, связанные с публикациями научных материалов, редакция просит направлять на адрес: almanac@gramota.net

Список литературы

1. Вацуро К. В., Мищенко Г. Л. Именные реакции в органической химии. М.: Химия, 1976. 528 с.
2. Газалиев А., Исабаева М., Ибатаев Ж. Тиомочевина в реакции Манниха // Поиск-Изденіс. Серия естественных и технических наук. Алматы, 2008. № 4. С. 28-30.
3. Животова Т. С., Газалиев А. М., Айтпаева З. К. Синтез и строение циклических тиомочевин на основе некоторых диаминов // Изв. НАН РК. Сер. хим. 2004. № 4. С. 31-33.
4. Коваль И. В. Синтез, строение и физико-химические свойства тиолов // ЖОрХ. 2005. Т. 41. № 5. С. 647-664.
5. Методы органической химии / пер. с нем.; под ред. В. М. Родионова. М.: ОНТИ. Т. 3. 677 с.
6. Общая органическая химия / пер. с англ.; под ред. Л. И. Беленького. М.: Химия, 1983. Т. 5. 481 с.

УДК 547.496.3; 547.879

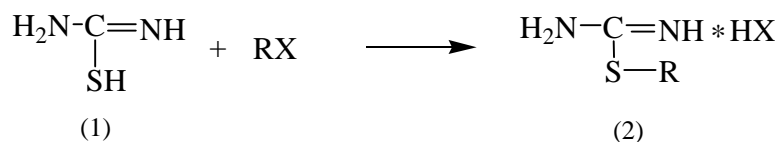
Меруерт Бердешевна Исабаева

Карагандинский государственный технический университет

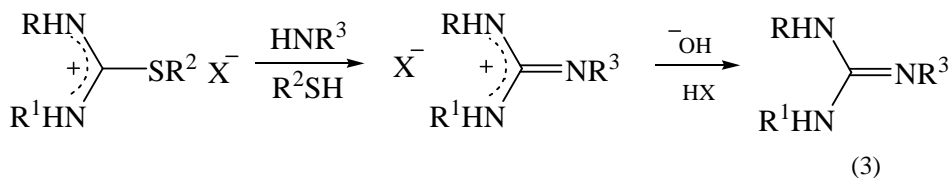
О БИОЛОГИЧЕСКОЙ АКТИВНОСТИ ПРОИЗВОДНЫХ ГУАНИДИНА[©]

Производные гуанидина широко распространены в природе. Они выделены из различных объектов животного и растительного происхождения, например мускулов, крови и мочи животных, листьев и плодов растений, из бактерий и т.п. Доказано, что производные гуанидина играют важную роль в процессе жизнедеятельности как животного, так и растительного организмов и являются необходимыми продуктами обмена живой клетки [3]. Биологическая важность соединения гуанидина видна хотя бы на примере таких производных гуанидина, как аргинин и креатин [2].

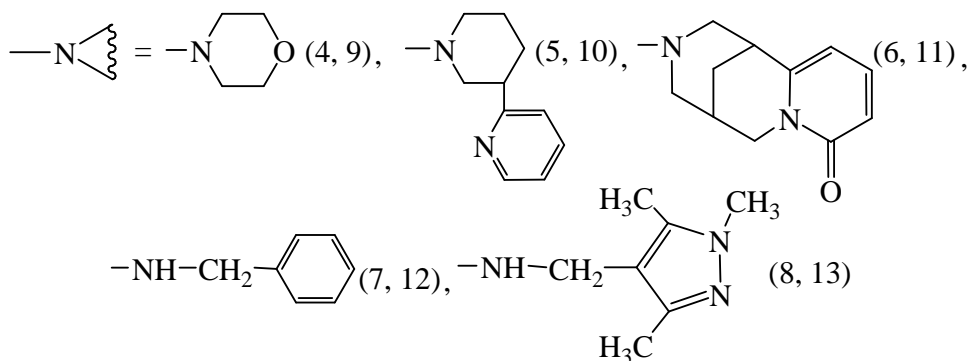
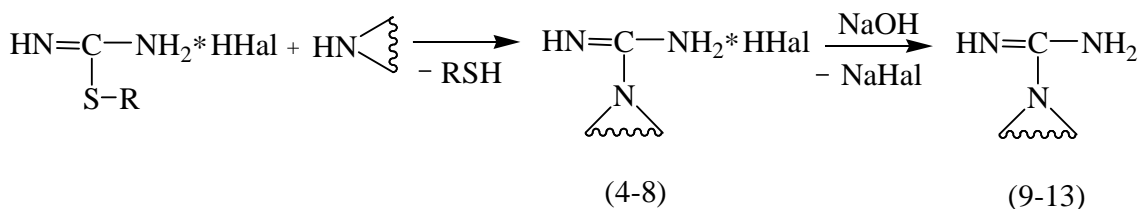
Тиомочевина и ее производные, поставляющими в состав синтезируемой молекулы группу -C(NH)NH₂, являются удобными синтонами в синтезе гуанидинов. Гидрогалогениды S-алкилтиомочевины или изотиоурониевые соли (2) легко образуются при добавлении соответствующего алкилгалогенида к тиомочевине (1) [1]. Пропил- и бутилгалогениды дают хорошо кристаллизующиеся соли:



S-алкилизотиоурониевые соли легко омыляются основаниями с образованием соответствующего гуанидинового производного (3) и меркаптана:



По этой схеме нами проведен аминолиз S-алкилизотиоурониевых солей. Алкильный радикал уходит в составе меркаптана, поэтому выбор S-алкилизотиоурониевой соли определялся кристаллизуемостью, стойкостью и чистотой соли. Кристаллизуемость соли увеличивается при увеличении длины радикала, а стойкие и чистые продукты выделялись при использовании бромпроизводных. Очень длинные радикалы образуют высококипящие меркаптаны, которые трудно удаляются из реакционной смеси. Поэтому, для аминолиза брались пропил- и бутилбромиды.



Hal = Br (4, 5, 7, 8), I (6).

Синтезированные соли гуанидина (4-8) представляют собой белые кристаллические вещества, которые хорошо растворимы в воде и практически нерастворимы в органических растворителях (спирт, ацетон, бензол). Гуанидины (9, 13) представляют собой белые аморфные порошки, а соединения (10-12) - маслообразные вещества, хорошо растворимые в органических растворителях.

С целью определения возможной биологической активности синтезированных соединений были проведены испытания на ростостимулирующую активность. Среди полученных соединений (9-13) гидробромид N-(1,3,5-триметил-1H-пиразол-4-илметил)-гуанидина (8, ГИБ-16) проявил наибольшую ростостимулирующую активность.

Испытания проводили в ТОО «Казахский НИИ плодоводства и виноградарства», в лаборатории агроэкологии и массовых анализов.

Контролем служила вода, в качестве эталона сравнения применяли «Аквинол». Испытание проводили на отрезках фасоли обыкновенной, проверяемые концентрации регулятора ризогенеза - 10, 50 и 100 мг/л. Данные по сравнению влияния регуляторов на рост корнеобразования фасоли приведены в Табл. 1. Изучение корнеобразования исследовалось по следующим факторам: длина корневой зоны, количество точек роста, количество бугорков, количество корней, суммарная длина всех корней (Рис. 1).

Табл. 1. Влияние регуляторов роста на корнеобразование фасоли

Препарат	Концентрация	Длина корневой зоны, см	Количество точек роста, шт.	Количество бугорков, шт.	Количество корней, шт.	Длина всех корней, см
Вода		5,7	27	6	21	32,0
Аквинол	10	5,3	19	8	11	79,4
	50	4,7	16	5	11	62,6
	100	5,4	22	13	9	56,0
ГИБ-16	10	3,5	25	3	22	112,4
	50	5,0	28	10	18	93,9
	100	4,27	23	7	16	89,4

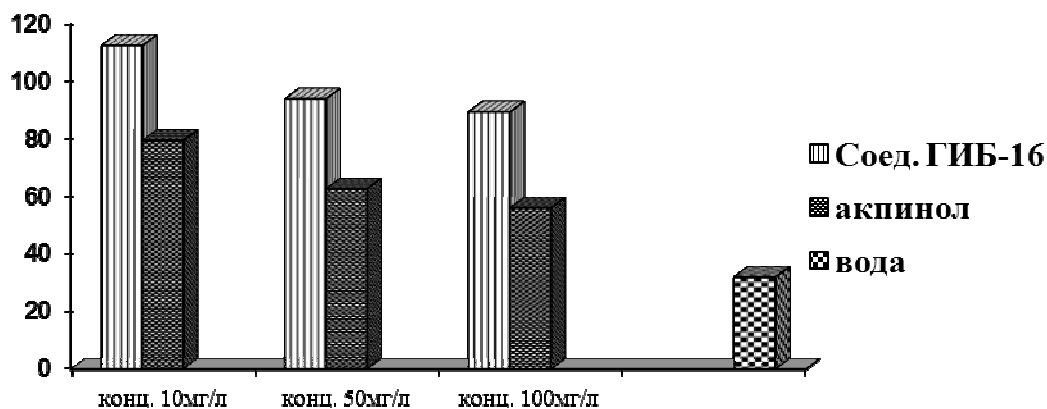


Рис. 1. Влияние регуляторов роста на длину корней фасоли

Анализ всех полученных данных показал, что исследуемое соединение (ГИБ-16) при исследуемых концентрациях способствовало лучшему корнеобразованию фасоли как по сравнению с водой, так и по сравнению с эталоном сравнения – «Акпинолом». При этом наибольший двукратный эффект на корнеобразование (длина корневой зоны, количество точек роста, количество бугорков, количество корней, длина всех корней.) по сравнению с акпинолом, испытываемое соединение показало при концентрации 10 мг/л. При концентрациях 50 и 100 мг/л соединение (ГИБ-16) показало соответственно наименьший эффект, чем при концентрации 10 мг/л.

Список литературы

1. Газалиев А. М., Исабаева М. Б., Ибатаев Ж. А., Ибраев М. К. Синтез и свойства новых потенциально биоактивных веществ на основе тиомочевины и биогенных аминов // Химия и технология растительных веществ: тезисы докладов V-ой Всероссийской научной конференции. Сыктывкар-Уфа, 2008. С. 104.
2. Граник В. Г. Лекарства, фармакологический, биохимический и химический аспекты. М.: Вузовская книга, 2001. 408 с.
3. Добрынина В. И. Учебник по биологической химии. М.: Госуд. изд. мед. литер., 1963. 447 с.

УДК 612.017.1

Акмарал Талаповна Кабденова, Жанат Абеновна Сатыбалдиева
Республиканское государственное предприятие на праве хозяйственного ведения
«Национальный Центр экспертизы лекарственных средств, изделий медицинского назначения
и медицинской техники» МЗ Республики Казахстан, г. Алматы

КВАНТОВО-ХИМИЧЕСКИЙ АНАЛИЗ СТРУКТУРЫ АЗАТИОПРИНА И УРОВЕНЬ ЭКСПРЕССИИ CD-МАРКЕРОВ[©]

Исходя из анализа литературных данных о современных компьютерных технологиях, мы предположили о возможности использования методов компьютерной химии для изучения действия Азатиоприна на уровень экспрессии CD-маркеров в зависимости от его концентрации в крови [3; 4].

Как известно, CD (кластеры дифференциации) представляют собой макромолекулы, появляющиеся на определенной стадии развития клеток. Их обнаружение и количественная оценка позволяют достоверно оценить состояние иммунной системы под тем или иным воздействием.

В данной статье представлено исследование влияния квантово-химических характеристик азатиоприна - известного лекарственного средства, обладающего цитотоксическим механизмом действия на проявление экспрессии CD. Азатиоприн представляет собой имидазольное производное 6-меркаптопурина, но в отличие от последнего, обладает более широким спектром действия. Установлено, что данный препарат по механизму действия относится к цитотоксическим разновидностям иммуносупрессоров. Предполагают, что препарат ингибирует активацию клеточной пролиферации и разрушает стимулированные лимфоидные клетки [5-9].