

СИНТЕЗ НОВИХ БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ ПІРАЗОЛДИКАРБОНОВИХ КИСЛОТ

Дорохов В.І., Павлюк Г.В., Федичин Б.М.

Житомирський національний агроекологічний університет,
м. Житомир, Старий бульвар, 7, E-mail: VDorokhov@meta.ua

Об'єкт дослідження – пошук нових ростових речовин.

Мета роботи – розробити методи синтезу нових типів біологічно активних речовин й визначити їх ростову активність.

Метод дослідження – вивчення рістрегулюючих властивостей нових біологічно активних речовин та статистичний аналіз врожайності сільськогосподарських культур, що були оброблені даними ростовими речовинами.

Застосування регуляторів росту рослин – один із ефективних шляхів розвитку рослинництва. Незважаючи на порівняно високу

ціну їх виробництва, економічний ефект від використання рiстрегулюючих речовин вищий, ніж від використання добрив і пестицидів, що набуває особливого значення в ринкових умовах. При цьому більшість відомих регуляторів росту малотоксичні і для людини і для рослин та не завдають шкоди навколишньому середовищу, так як використовуються в малих концентраціях.

У зв'язку з високою біологічною активністю 4-заміщених похідних піразолу нам видавалось доцільним здійснити синтез ряду нових піразолдикарбонових кислот з різними за своєю природою ароматичними замісниками в положенні 3 піразольного кільця (I-VI) з метою подальшого дослідження їх біологічних властивостей.

Для отримання 3-карбокси-1-фенілпіразол-4-карбонової кислоти (I) був використаний метод ефективного окиснення відповідних альдегідів калій перманганатом у водно-піридиновому середовищі, який дозволяє досягти 75-90%-них виходів цільових сполук (рис.1):

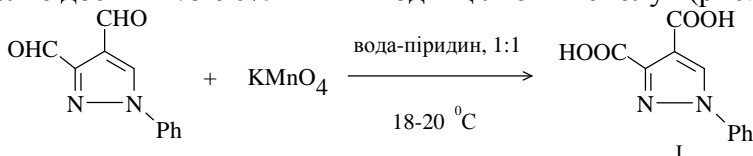


Рис. 1. Схема окиснення 3-форміл-1-фенілпіразол-4-карбальдегіду

Кислоти (II-VI), які містять 3-арильні замісники були одержані з виходом 60-70% у дві стадії.

На першій стадії вихідні речовини – 3-арил-4-форміл-1-(2-ціаноетил)піразоли, під дією киплячої концентрованої хлоридної кислоти HCl легко гідролізуються до відповідних піразолілпропанових кислот (рис.2):

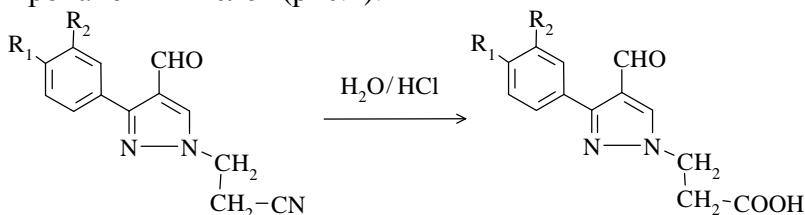
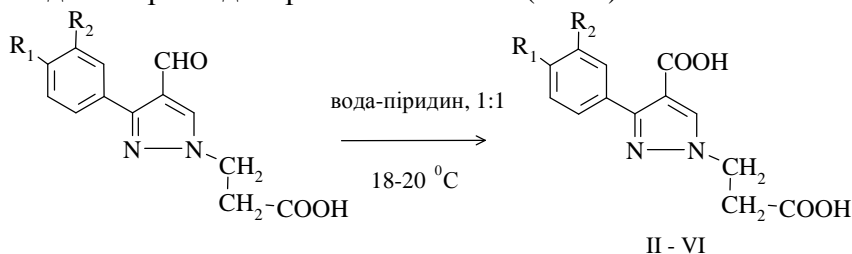


Рис. 2. Схема гідролізу 3-арил-4-форміл-1-(2-ціаноетил)піразолів

При цьому, необхідно відмітити, що за умов проведення реакції не відбувається розрив у зв'язку С–N ні β-ціаноетильного, ні β-карбоксиетильного замісників з атомом Нітрогену піразольного кільця.

На другій стадії (рис.3) отримані піразолілпропанові кислоти окиснювали калій перманганатом у водно-піридиновому середовищі до відповідних піразолдикарбонових кислот (II- VI):



$R_1 = \text{CH}_3\text{O}$, $R_2 = \text{NO}_2$ (II); $R_1 = \text{NO}_2$, $R_2 = \text{H}$ (III); $R_1 = \text{N}_3$, $R_2 = \text{H}$ (IV);

$R_1 = \text{Br}$, $R_2 = \text{H}$ (V), $R_1 = \text{H}$, $R_2 = \text{Br}$ (VI).

Рис. 3. Схема окиснення 3-(3-арил-4-формілліпіразол-1-іл)пропанових кислот

Індивідуальність синтезованих кислот (I-VI) підтверджена методом тонкошарової хроматографії, склад – результатами елементного аналізу, а будова – даними вимірів ІЧ та ПМР-спектрів.

Ростову активність сполук (I-VI) визначали методом скринінгу по відношенню до насіння озимого жита. Як еталон використовували дитіосаліцилову кислоту [3], контроль – дистильована вода. Обробка насіння проводилась водними розчинами калієвих солей отриманих кислот (рис.4):

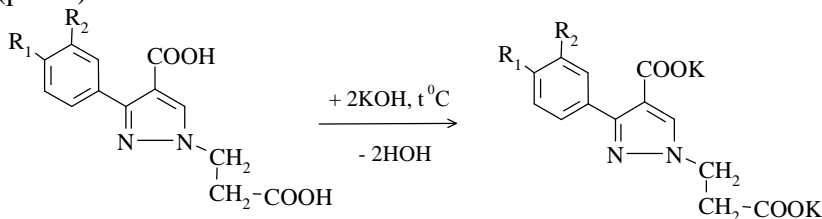


Рис. 4. Схема утворення калієвих солей піразолдикарбонових кислот

Обсяг досліджень включав:

1. Дослідження впливу синтезованих речовин на основні морфологічні (енергія проростання, схожість, вага і довжина наземної та підземної частин рослини) показники рослин.
2. Визначення концентрації водних розчинів досліджуваних речовин, за якої вони показують свою найбільшу біологічну активність.
3. Виявлення оптимального часу замочування насіння водними розчинами солей кислот.

Встановлено, що всі досліджувані речовини в концентраціях 0.00125% є біологічно активними сполуками й проявляють стимулюючу дію на жито. Обробка зерна розчинами калієвих солей синтезованих кислот вказаної концентрації активізує всі ростові процеси. Особливо наглядно це проявляється на довжині та масі коренів рослин. Найбільш активними є сполуки, що містять у положенні 3 піразольного кільця карбоксильну групу –COOH (I), 3-нітрофенільний (III) або 3-азідофенільний замісник (IV).

Висновки

1. Підвищення врожайності сільськогосподарських культур є важливою проблемою сьогодення. Один із шляхів її вирішення – застосування регуляторів росту рослин.
2. Похідні піразолу є перспективними біофорними об'єктами для виявлення структур із високою біологічною активністю.
3. Розроблена методика синтезу ряду нових піразолдикарбонових кислот, визначена їх висока ростова активність.