

Жилкибаев О.Т., Шоинбекова С.А., Бахташ К.Н., Куралбаева А.К.
Казахский национальный университет имени аль-Фараби, Алматы, Казахстан,
zhilkibaevoral@mail.ru

СИНТЕЗ НОВЫХ АНАЛОГОВ ПРИРОДНЫХ ФИТОГОРМОНОВ НА ОСНОВЕ ПРОПИНИЛОВЫХ СПИРТОВ ПИПЕРИДИНА

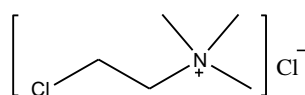
Несмотря на значительные достижения науки, природные фитогормоны не получили широкого практического применения из-за сложности и дороговизны их выделения из организмов-продуцентов, разнонаправленности действия легкой метаболической дезактивации растительными ферментами. Массовое применение аналогов фитогормонов – регуляторов роста растений стало возможным только после создания аналогов фитогормонов на основе природных и химических веществ, более стабильных в организме, так как отсутствуют соответствующие ферменты на деструкцию новых продуктов. Поэтому, создание новых высокоэффективных и низкзатратных синтетических аналогов природных фитогормонов с комплексными свойствами (регулирующие, антистрессовые, иммуностимулирующие и т.д.) приобретает особую актуальность, т.к. потребность в высокоэффективных фиторегуляторах растет с каждым днем. Нами осуществлен направленный синтез новых арилоксипропилиловых спиртов пиперидина – аналогов природных фитогормонов. Поведенные углубленные лабораторные и демонстрационные испытания показали высокую эффективность новых синтезированных препаратов.

Despite considerable achievements of a science, natural phytohormones have not obtained wide practical application because of complexity and dearness of their allocation from organisms-producers, different actions of easy metabolic deactivation by vegetative enzymes. Mass application of phytohormones analogues is regulators of plants growth became possible only after creation of analogues of phytohormones on the basis of natural and chemical substances, more stable in an organism, because of absence of corresponding enzymes for destruction of new products. Therefore, creation of new highly effective and low-cost-based analogues of natural phytohormones with complex properties (regulating, antistress, immunostimulant etc.) gets a special urgency since the requirement for highly effective phytoregulators grows every day. The directed synthesis of new ariloxypropinyl alkaloids of piperidine, the analogues of natural phytohormones, was performed by us. Spent profound laboratory and demonstration tests have shown high efficiency of new synthesized preparations.

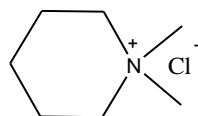
Важнейшие направления современной агротехнологии предусматривают получение нового поколения высокоэффективных регуляторов роста растений, применение которых направлено на решение многих проблем, связанных с повышением урожайности, улучшением качества растениеводческой продукции, повышением устойчивости сельскохозяйственных культур к различным болезням, вредителям и климатическим условиям. Несмотря на достижения науки, природные фитогормоны не получили широкого практического применения из-за сложности и дороговизны их выделения из организмов-продуцентов, разнонаправленности действия легкой метаболической дезактивации растительными ферментами. Широкое применение аналогов фитогормонов – регуляторов роста растений стало возможным только после создания аналогов фитогормонов на основе природных и химических веществ, более стабильных в организме, так как отсутствуют соответствующие ферменты на деструкцию новых продуктов. Современные технологии биорегуляторов роста растений нацелены на получение известных фитогормонов синтетическими методами, а также направленным синтезом биорегуляторов роста, не имеющих аналогов в природе, отличающихся высоким уровнем эффективности при практическом

применении в сельском хозяйстве. Потребность в высокоэффективных фиторегуляторах растет с каждым днем, поэтому, создание новых высокоэффективных и низкозатратных синтетических аналогов природных фитогормонов приобретает особую актуальность.

Для осуществления этой задачи, нами сначала выбран объект исследования на основе подробного анализа литературных, патентных и государственных документов в области создания новых регуляторов роста растений. Пиперидиновое кольцо составляет основу многих природных алкалоидов: пиперин (лат. *piper* – перец, само слово пиперидин происходит от этого слова), ролусен из черного перца – *Piper nigrum*, конииин, лобелин, пельтьерин и т.д. На основе производных пиперидина синтезированы такие регуляторы роста, как – фоспинол, ТАБС, акпинол-альфа и др. На основе двух действующих веществ – хлормекватхлорида и мепикватхлорида – зарегистрировано 6 препаратов из Китая, Чехии, Австрии, Германии и Венгрии. Интерес к ним у нас вызван наличием в структуре этих препаратов четвертичного аммониевого структурного фрагмента.



хлормекватхлорид



мепикватхлорид

Среди них наибольшую активность проявляют производные четвертичных аммониевых солей. Внедрение ацетиленового фрагмента, в частности Карвитол, приводит также к увеличению активности. Таким образом, предложенная методология поиска новых РРР варьированием ароматического фрагмента и кватернизирующего агента находит подтверждение в научной литературе. Разрабатываемые нами препараты являются структурными аналогами широко распространенных действующих веществ.

Направленный синтез новых аналогов природных фитогормонов осуществлен перемешиванием эквимолярной смеси арилоксипропина с пиперидин-4-оном – в условиях реакций Фаворского. Строение синтезированных соединений установили с помощью методов ИК- и ЯМР ^1H спектроскопии. Для определения рострегулирующей активности новых синтезированных пиперидолы переведены в водорастворимые соли.

Проведенные углубленные лабораторные и демонстрационные сравнительные испытания новых соединений и эталонных препаратов разрешенных к применению в Казахстане на зерновых (пшеница и ячмень), овощных (картоп, морковь, капуста, огурцы, помидор) и других культур показали высокую эффективность применения новых синтезированных препаратов. Проведенные лабораторные и полевые испытания показали, что новые препараты стимулируют рост и развитие органов (хвоя, крона, стебель) тьянь-шаньской ели *Picea schrenkiana*. Воздушно-сухая масса надземной части сеянцев в опытном варианте также превышала контроль (на 19%) и обеспечило 98% всхожести семян. Исследована зависимости «структура-активность», «доза-эффект», «доза-культура» регуляторов роста растений.

Эффективность новых соединений – широкий спектр культур, хорошая растворимость в воде, высокая биологическая активность, близкая к лучшим мировым средствам защиты, низкая доза применения – 0,0001% по действующему веществу (1г на 1т воды), сравнимые с природными фитогормонами, длительные сроки хранения, экологическая безопасность. Технологические показатели: высокий выход целевых продуктов, последовательное проведение 3-стадий реакции в одном реакторе.