

твердого топлива. – 2010. – № 6. – С. 22–30.

3. Федущак Т.А., Петренко Т.В., Восмеригов А.В., Канашевич Д.А., Журавков С.П., Величкина Л.М. Физико-химические свойства и активность нанопорошковых катализаторов гидродесульфирования дизельной фракции // Журнал физической химии. – 2012. – Т. 86. – № 3. – С. 444–448.

4. Металлические порошки и порошковые материалы: справочник / Под ред. Ю.В. Левинского. – М.: Экомет, 2005. – 520 с.

5. Камьянов В.Ф., Большаков Г.Ф. Структурно-групповой анализ компонентов нефти // Нефтехимия. – 1984. – Т. 24. – № 4. – С. 450–459.

ИССЛЕДОВАНИЕ БИОЛОГИЧЕСКОЙ АКТИВНОСТИ *IN VITRO* НЕКОТОРЫХ ГЛИКОЗИДОВ КОРЫ ОСИНЫ (*POPULUS TREMULA*)

Л.К. Мингажева, Е.В. Степанова

Научный руководитель: доцент, к.х.н. М.Л. Белянин

Национальный исследовательский Томский политехнический университет,

Россия, г. Томск, пр. Ленина, 30, 634050

E-mail: l.mingazheva@mail.ru

IN VITRO BIOLOGICAL ACTIVITY OF SOME *POPULUS TREMULA* BARK GLYCOSIDES

L.K. Mingazheva, E.V. Stepanova

Scientific Supervisor: assoc. prof. M.L. Belyanin

Tomsk Polytechnic University, Russia, Tomsk, Lenin str., 30, 634050

E-mail: ivanov@tpu.ru

The study on inhibitory effect on human serum enzymes, namely glycine peptidase, alkaline phosphatase and esterase by phenolglycosides of the family Salicaceae: salicine, salirepin and their derivatives.

Вещества растительного происхождения представляют огромный интерес для исследования в связи с их разнообразной биологической активностью. Растения семейства Salicaceae широко используются в народной медицине для лечения описторхоза, паралича, болезни легких, оспы, экстракт коры ивы обладает противовоспалительным эффектом [1].

Фитохимические исследования показали наличие в растениях семейства Salicaceae следующих фенолгликозидов: салицина (1), циннамоат салицина (2), салирепина (3), салирепозида (4), 2-гидроксибензоат салирепина (5), 4-гидроксибензоат салирепина (6), 3,4-дигидроксициннамоат салирепина (7), дибензоил салирепина (8), тремулацин (9) (Рисунок 1) [2].

Данные соединения обладают широким спектром биологического действия. Салицин и его производные эффективны при лечении лихорадки и ревматических заболеваний. Салирепозид обладает противоопухолевой, противовирусной активностью и гельминтоцидным действием, также является ингибитором фосфодиэстеразы яда змеи [3]. С целью изучения фермент ингибирующей активности фенолгликозидов 1-9 было исследовано *in vitro* их влияние на активность ферментов сыворотки крови человека: глицинаминопептидазы, щелочной фосфатазы и эстеразы. Оценку ингибирующей способности

соединений проводили спектрофотометрическим методом. Изменение оптической плотности измеряли при 415 нм на микропланшетном ридере *iMark BIO-RAD*.

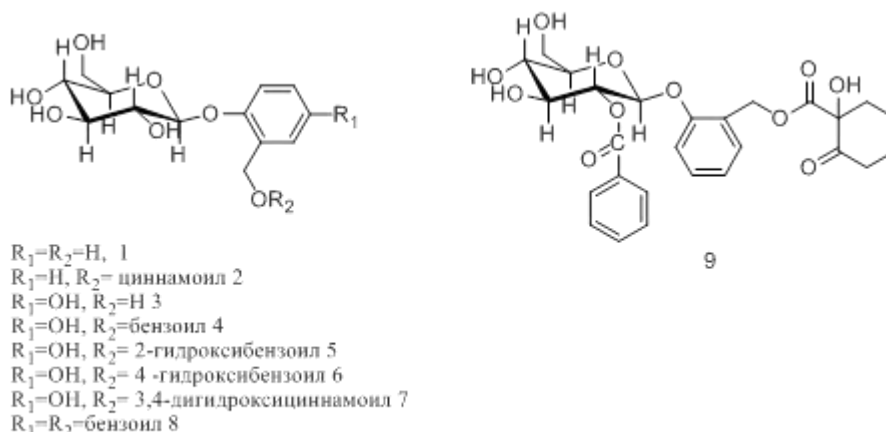


Рис. 1. Структуры исследованных соединений

Таблица 1. Концентрации соединений 1-9 в инкубационной смеси

№ п/п	Исследуемое соединение	Исходная концентрация, мМ	Концентрация в инкубируемом объеме (мМ)		
			Глицинамино-пептидаза	Щелочная фосфатаза	Эстераза
1	Салицин	1,75	0,21	0,073	0,092
2	Циннамоат салицина	1,20	0,144	0,051	0,063
3	Салирепин	1,66	0,199	0,070	0,087
4	Салирепозид	1,23	-	-	0,065
5	2-гидроксibenзоат салирепина	1,18	0,142	0,050	0,062
6	4-гидроксibenзоат салирепина	1,18	0,142	0,050	0,062
7	3,4-дигидроксibenзоат салирепина	1,08	0,137	0,048	0,057
8	Дибензоил салирепина	0,98	0,118	0,041	0,052
9	Тремулацин	0,95	0,114	0,040	0,050

Таблица 2. Значения $C_{50инг}$ гликозидов 1-9 для глицинаминопептидазы, щелочной фосфатазы и эстеразы ($n=3$)

№ п/п	Исследуемое соединение	$C_{50инг}$, мМ		
		Глицинамино-пептидаза	Щелочная фосфатаза	Эстераза
1	Салицин	0,312±0,011	0,532±0,063	0,735±0,044
2	Циннамоат салицина	0,289±0,014	0,191±0,009	0,092±0,004
3	Салирепин	0,252±0,014	0,274±0,018	0,296±0,009
4	Салирепозид	-	-	0,442±0,039
5	2-гидроксibenзоат салирепина	0,186±0,011	0,191±0,017	0,203±0,006
6	4-гидроксibenзоат салирепина	0,198±0,009	0,212±0,010	Н.о.
7	3,4-дигидроксibenзоат салирепина	Н.о.	0,065±0,001	0,242±0,066
8	Дибензоил салирепина	Н.о.	0,110±0,005	0,139±0,002
9	Тремулацин	0,150±0,009	0,395±0,043	0,078±0,001

Н.о. – не обнаружено

Исследуемые соединения 1-8 были синтетически получены по [4,5]. Тремулацин был выделен из коры осины (*Populus tremula*) по [6]. Измерение ферментативной активности сыворотки проводилось по известным методикам [7,8].

Для изучения ингибирующей активности гликозидов 1-9, для каждого гликозида была приготовлена инкубационная смесь, содержащая исследуемое соединение в концентрации, приведенной в таблице 1.

Пептидазная активность сыворотки составила 3,205 мкмоль/мин·л. Фосфатазная активность сыворотки 2,328 мкмоль/мин·л. Эстеразная активность сыворотки 1,083 мкмоль/мл·мин.

Для оценки ингибирующей активности для каждого соединения 1-9 была определена концентрация в инкубируемой смеси, при которой активность фермента уменьшилась на 50 %. ($C_{50\text{инг}}$) по сравнению с контролем (без добавления тестируемого соединения). Результаты представлены в таблице 2.

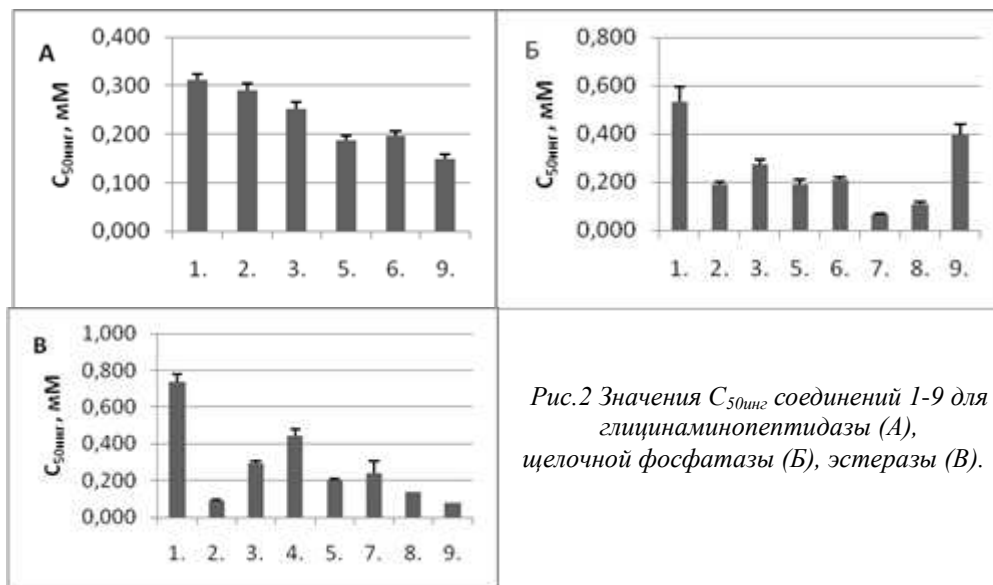


Рис.2 Значения $C_{50\text{инг}}$ соединений 1-9 для глицинаминопептидазы (А), щелочной фосфатазы (Б), эстеразы (В).

Все исследованные гликозиды обладают ингибирующим действием. Наиболее активными ингибиторами являются тремулацин (для эстеразы $C_{50\text{инг}}=0,078$ мМ, для глицинаминопептидазы $C_{50\text{инг}}=0,150$ мМ), циннамоат салицина (для эстеразы $C_{50\text{инг}}=0,092$ мМ), дибензоил салицина (для щелочной фосфатазы $C_{50\text{инг}}=0,110$ мМ, для эстеразы $C_{50\text{инг}}=0,139$ мМ) и 3,4-дигидроксидибензоил салирепина (для щелочной фосфатазы $C_{50\text{инг}}=0,065$ мМ). Данные гликозиды имеют в своей структуре 2 или 3 бензольных кольца и гидроксильные группы в орто - или параположениях. Эффект ингибирования может быть объяснен способностью связываться гликозида с ферментом посредством образования водородных связей и π - π ароматических межплоскостных взаимодействий, вызывая изменение активности фермента.

Работа выполнена при финансовой поддержке Гос.задания «Наука», проект № 2387.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Adams M. et al. Medicinal herbs for the treatment of rheumatic disorders // Journal of Ethnopharmacology. – 2009. – №121. – P.343–359
2. Boeckler G. A. et al. Phenolic glycosides of the Salicaceae // Phytochemistry. – 2011. – № 72. – P. 1497–1509
3. Ahma, V. U. et al. Phosphodiesterase-Inhibiting Glycosides from Symplocos racemosa // Helv. Chim. Acta. – 2004. – V. 87. – P. 67 – 72.
4. Belyanin M.L. et al. First total chemical synthesis of natural acyl derivatives of some phenolglycosides of the family Salicaceae// Carbohydrate Research . – 2012. – № 363. – P. 66–72
5. Belyanin M.L. et al. Synthesis of acyl derivatives of salicin, salirepin and arbutin //Carbohydrate Research

– 2014 (in press) doi:10.1016/carres

6. Zapesochnaaya G.G. Phenolic compounds of *Salix acutifolia* bark //Chemistry of Natural Compounds. – 2002. – V. 38. – № 4. – P. 314 – 318.

7. Биссвангер Х. Практическая энзимология – М.: Бином Лаборатория знания, 2010. – 328с.

8. Соколовская Л.Г. Семейство биосенсорных анализаторов для оценки «эстеразного статуса» организма// Химическая и биологическая безопасность. – 2004. – № 1–2. – С. 21–31.

**THE ANALYSIS OF STRUCTURAL FEATURES OF HUMIC ACIDS FRACTIONS AFTER
MECHANOCHEMICAL MODIFICATIONS**

¹M.P. Mirzobekzoda, ²E.V. Maltseva, ¹N.S. Shekhovtsova

Scientific Supervisor: Ph. D, E.V. Maltseva; associate professor N.S. Shekhovtsova

¹Tomsk Polytechnic University, Russia, Tomsk, Lenin ave., 30, 634050

²Institute of Petroleum chemistry SB RAS, Russia, Tomsk, Academichesky ave., 4, 634021

E-mail: maltseva2@gmail.com

**АНАЛИЗ СТРУКТУРНЫХ ОСОБЕННОСТЕЙ ФРАКЦИЙ ГУМИНОВЫХ КИСЛОТ ПОСЛЕ
МЕХАНОХИМИЧЕСКОЙ МОДИФИКАЦИИ**

М.П. Мирзобекзода¹, Е.В. Мальцева², Н.С. Шеховцова¹

Научный руководитель: к.х.н. Е.В. Мальцева; доцент, к.х.н. Н.С. Шеховцова

¹Национальный исследовательский Томский политехнический университет,

Россия, г. Томск, пр. Ленина, 30, 634050

²Институт химии нефти СО РАН, Россия, г. Томск проспект Академический, 4, 634021

E-mail: maltseva2@gmail.com

Впервые изучено влияние модифицирующего агента тиомочевины в процессе механоактивации на структурный состав и кислотно-основные свойства основных фракций гуминовых кислот – гиматомелановые и протогуминовые кислоты.

Humic substances take an essential role in environmental protection. With growing of world production, the amount of chemical substances, that are able to migrate through the atmosphere and hydrosphere, increase. Thus, protection function of the humic substances that irreversibly absorb a lot of man-induced toxicants with detoxification of soil pollutant, plants of living substances due to the variety of functional groups, becomes very important [1,2]. In the previous works was shown that mechanoactivation (MA) modifies the structure and properties of humic acids, increasing their detoxication ability [3, 4]. However, investigation of mechanoactivation influence on humic acids fractions, possessing unique physiological activity, represent huge interest.

Therefore, the main purpose of this work is an investigation of mechanoactivation influence on the acid-base properties of humic acids after their fractionation.

Humic (HA) and fulvic (FA) acids were extracted from transitional peat of the Tomsk region with decay