

**Схема 1.** Получения фенольных гликозидов

так и к более значительному деацетилированию. Основным продуктом является полиформилированный имин. Время гидролиза, температура процесса и концентрация кислоты практически не влияет на соотношения продуктов. В ходе реакции происходит частичное снятие ацильной группы (в большей степени в случае ацетилпроизводных), однако, получение гликозидов именно с этими группами представляет интерес.

Методами ЯМР  $^{13}\text{C}$  и  $^1\text{H}$  и ГХ-МС было доказано, что метод Даффа не является селективным [4], так как наблюдаются продукты п-формилирования 3,8 и стерически затрудненных продуктов 6,10.

Дальнейшее гликозилирование проводится по следующей схеме:

Метод Даффа является удобным способом для введения формильной группы в выбранные субстраты с хорошим выходом. Доказано образование незначительного количества п-изомеров и продуктов без ацильных групп.

### Список литературы

1. Boeckler G.A. // *Phytochemistry*, 2011.– Vol.72(13).– P.1497–1509.
2. Viqar U.A. // *Phytochemistry*, 2003.– Vol.63.– P.217–220.
3. Kazuhiro H. // *Joutnal of Natural Products*, 1986.– Vol.49.– №.2.– P.218–224.
4. Yinrong Lu. // *Phytochemistry*, 2000.– Vol.55.– P.67–75.
5. Duff J.C. // *J.Chem. Soc.*, 1941.– P.547.

## Синтез N,N-диметилпроизводных аминопиридинов из пиридилтрифлатов в диметилформамиде

М.И. Потапова, А.Ж. Касанова

Научный руководитель – д.х.н., профессор Е.А. Краснокутская

*Томский политехнический университет*

634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина, 30, [asiyakass@mail.ru](mailto:asiyakass@mail.ru)

N,N-Замещенные аминопиридины широко используются как полупродукты в синтезе лекарственных препаратов для лечения сердечно-сосудистой системы, воспалительных заболеваний, заболеваний

центральной нервной системы и др. [1].

Основным методом получения этих важных с практической точки зрения соединений является аминирование хлорпиридинов диметиламином [2–4]. Кроме того, известно, что хлорпроизводные пиридинов при простом кипячении в диметилформамиде (ДМФА) в течение 6–95 ч могут быть превращены в соответствующие N,N-диметилпроизводные [5].

На кафедре Биотехнологии и органической химии Национального исследовательского Томского политехнического университета был разработан удобный метод получения широкого ряда пиридилтрифлатов (пиридил трифторметансульфонатов) [6].

Известно, что трифлатная группа – хорошо уходящая группа. Мы поставили цель – исследовать поведение пиридилтрифлатов в кипящем ДМФА.

Мы впервые показали, что пиридилтрифлаты могут взаимодействовать с ДМФА (схема 1) с образованием соответствующих N,N-диметиламинопиридинов.

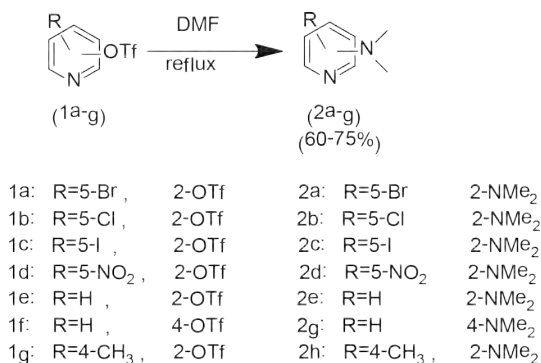


Схема 1.

При этом реакция протекает значительно быстрее, чем это было описано в работе [7], что ожидаемо, поскольку нуклеофильность хлорид-иона больше, чем трифлатной группы.

Таким образом, показано, что N,N-диметиламинопиридины могут быть быстро получены из соответствующих пиридилтрифлатов при простом кипячении в ДМФА.

Работа выполнена при поддержке гранта Гос.задание «Наука» проект №2387.

### Список литературы

1. Janssens F.; Torremans J.; Janssen M.; Stokbroekx R.A.; Luyckx M.; Janssen P.A.J. // J. Med. Chem., 1985.– 28.– P.1943.
2. Lundgren R.-J.; Sapping-Kumankumah A.; Stradiotto M. // Chem. Eur. J., 2010.– Vol.16.– №6.– P.1983–1991.
3. Anderson L.C.; Seeger N.V. // J. Am. Chem. Soc., 1949.– Vol.71.– №24.
4. I.G. Farbenind. Patent: DE676331. 1935.
5. Kodimuthali A.; Mungara A.; Prasunamba P.-L.; Pal M. // J. Braz. Chem. Soc., 2010.– Vol.21.– №8.– P.1439–1445.
6. Krasnokutskaya E.A.; Kassanova A.Zh.; Estaeva M.T.; Filimonov V.D. // Tetrahedron Letters, 2014.– 55.– P.3771–3773.
7. Kodimuthali A.; Mungara A.; Prasunamba P.-L.; Pal M. // J. Braz. Chem. Soc., 2010.– Vol.21.– №8.– P.1439–1445.

---

### Синтез бромпроизводных фенолгликозидов и фенолгалактозидов

Д.А. Романова, М.О. Нарогная

Научный руководитель – к.х.н., ассистент Е.В. Степанова

*Томский политехнический университет*

*634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина, 30, da.romanova.93@gmail.com*

Фенолгликозиды широко распространены в растительном мире и обладают большим спектром биологической активности. Они содержатся в различных частях растений семейства ивовые, одним из которых является кора осины. Осина содержит большой спектр полезных веществ, на ее основе изготавливаются масса средств, которые обладают противовоспалительными, жаропонижающими и мочегонными качествами.

Салицин является одним из наиболее известных представителей фенолгликозидов. Он широко используется в фармацевтике, обладает антиоксидантными, а так же противовоспалительными, жаропонижающими свойствами и используются в качестве анальгетиков [1].

Как известно введение галогенов в фармпрепаратах может значительно увеличивать и изменять биологическую активность. В литературных источниках не упоминаются способы синтеза этих гликозидов. Поэтому целью нашей работы является получение брометиленовых производных фенолгликозидов, в которых гидроксил салицина замещен на бром.

Основным составляющим компонентом является глюкоза и галактоза, поэтому стадии получения нашего вещества начинаются с получения ацетобромглюкозы 1 и ацетобромгалактозы 2, после чего провели