

СИНТЕЗ ХЛОРМЕТИЛЕНОВЫХ ПРОИЗВОДНЫХ ФЕНОЛГЛИКОЗИДОВ

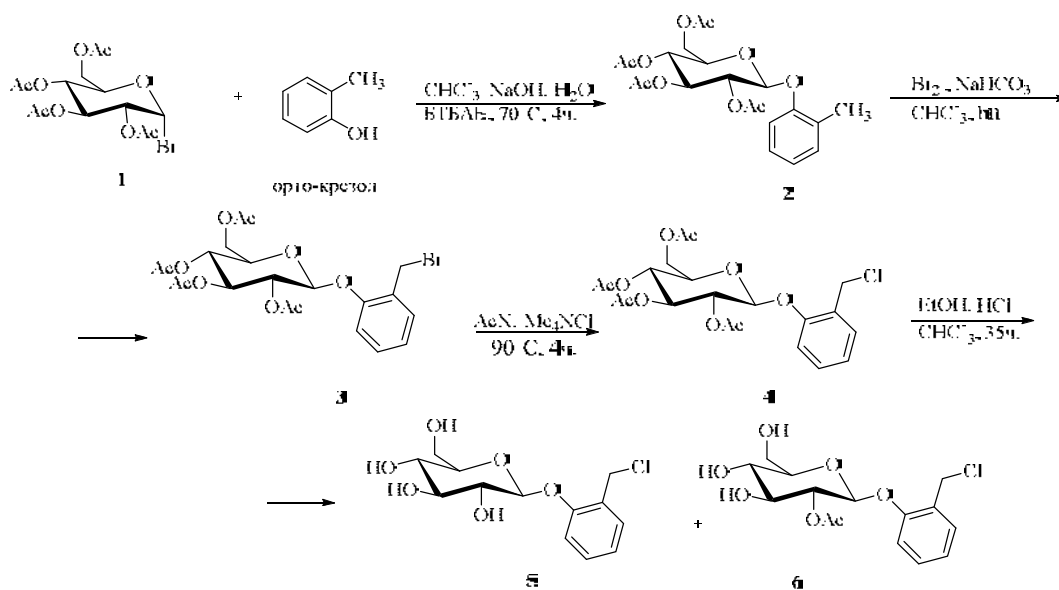
Д.А. Романова

Научный руководитель: ст. преподаватель, к. х. н. Е.В. Степанова
Национальный исследовательский Томский политехнический университет
E-mail: da.romanova.93@gmail.com

Одним из наиболее известных представителей фенолгликозидов является салицин. Он встречается в разных частях растений, но чаще всего в коре семейства ивовые [1]. В настоящее время к семейству этих растений проявляется большой интерес, так как на их основе изготавливают массу средств, обладающих противовоспалительными, жаропонижающими и мочегонными качествами.

Известно, что введение галогенов в фармпрепараты может значительно ее увеличивать их фармакологическую активность. Так, если гидроксигруппу салицина заменить на бром или хлор, можно ожидать изменение фармакологических свойств препарата. Однако в литературных источниках нам не удалось найти синтезы этих или подобных гликозидов. Поэтому целью нашей работы является разработка методов полного синтеза хлорметиленовых производных салицина.

В состав рассматриваемых гликозидов входит глюкоза, поэтому получение нашего вещества начинается с получения ацетобромглюкозы **1**, которая является хорошим гликозил-донором для получения арилгликозидов. Далее проводили гликозилирование *o*-крезола ацетобромглюкозой **1** с использованием КФП (бензил третбутил аммоний бромид) в двухфазной системе. Затем полученный гликозид **2** бромировали радикально на свету, с получением монобромпроизводного **3**. Далее провели замещение брома на хлор по реакции нуклеофильного замещения при помощи тетраметиламмоний хлорида [2] с получением гликозида **4**. На конечном этапе провели снятие ацетильных групп в системе HCl-EtOH-CHCl₃ [3]. Реакция потребовала 35 часов для соединения **5** и **6**, после чего продукты разделяли посредством колоночной хроматографии.



Таким образом, нам впервые удалось снять ацетильные группы гликозида **4** с сохранением связи C-Cl в кислых условиях. А, кроме того, нам также удалось выделить продукт **6**, содержащий одну ацетильную группу, который может в дальнейшем быть использован как строительный блок для получения природных гликозидов.

Работа была выполнена в рамках гранта РФФИ № 14-03-00743.

Список литературы

1. Химический анализ лекарственных растений. Учебное пособие для фармацевтических вузов / Е.Я. Ладыгина, Л.Н. Сафронич, В.Э. Отряшенкова и др. ; под ред. Н.И. Гринкевич, Л.Н. Сафронич. – М. : Высшая школа, 1983. – 176 с.
2. Briggs J.C. et al. // Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1: Organic and Bio-Organic Chemistry (1972-1999). – 1995. – Vol.1. – P. 27–32.
3. Stepanova et al. // Carbohydr. Res. – 2014. – Vol. 388. – P. 105.