

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

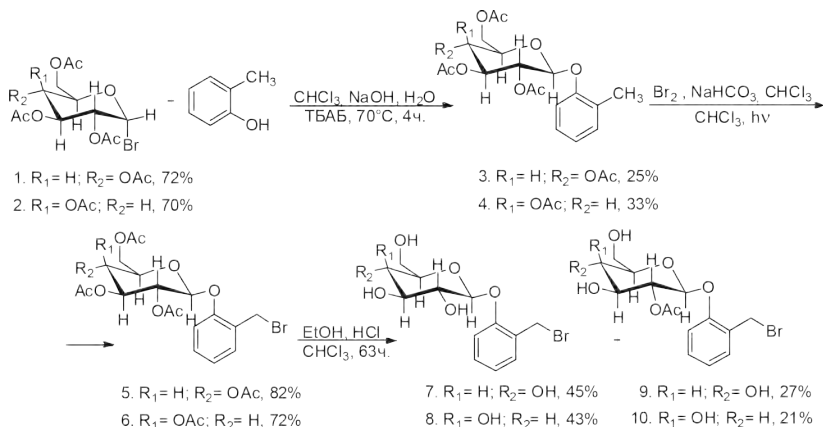
Фенолгликозиды широко распространены в растительном мире и обладают большим спектром биологической активности. Они содержатся в различных частях растений семейства ивовые, одним из которых является кора осины. Осина содержит большой спектр полезных веществ, на ее основе изготавливаются масса средств,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

гликозилирование *o*-крезола с использованием КФП (тетрабутил аммоний бисульфат) в двухфазной системе. Затем полученные гликозиды 3 и 4 бромировали радикально на свету, с получением монобромпроизводного 5 и 6. Далее проводили удаление ацетильных групп. Реакция потребовала 29 часов для соединения 5 и 26 часов для соединения 6, после чего продукты разделяли посредством колоночной хроматографии.



При селективном снятии ацетильных групп в системе CHCl₃-EtOH-HCl [2] нами были получены как гликозиды без ацетильных групп (гликозиды 7 и 8), так и продукты неполного дезацетилирования 9 и 10, содержащие ацетильную группу у 2'-атома гидроксила моносахарида. Таким образом, нами впервые были получены гликозиды 7, 9, а также галактозиды 8, 10. Структура этих гликозидов такова, что, имея высоко-реакционноспособную бромметиленовую группу, они могут выступать в качестве хороших алкилирующих агентов. Такое свойство химических соединений широко применяется в лечении рака.

Таким образом, нами впервые предложена система для селективного снятия ацетильных групп при наличии в соединении реакционноспособных C-Hal связей и получены гликозиды 7–10, которые не удается получить другим путем.

Список литературы

1. Lee, Hye-Suk. et al. Bull Kor Chem Soc, 2012.– 33(9).– 3004.
2. Stepanova et al. Carbohydr. Res., 2014.– 388.– 105.