

ИССЛЕДОВАНИЕ РЕАКЦИИ ЭЛИМИНИРОВАНИЯ ГЛИКОЗИДОВ ИОДОНИЕВЫХ СОЛЕЙ

Г. В. Беккер, Е. В. Степанова

Научный руководитель – к.х.н., доцент ИШХБМТ Е. В. Степанова

ФГОУ ВО Национальный исследовательский Томский политехнический университет
634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина, 30, gvb5@tpu.ru

Гликозиды иодониевых солей – это бифункциональные органические молекулы, в которых один из лигандов иодониевой соли посредством гликозидной связи связан с углеводным остатком. Поскольку иодониевые соли уже получили широкое распространение как стерео- и регио-селективные арилирующие и функционализирующие агенты [1], используемые как для синтеза сложных органических субстратов [2], так и для ковалентной функциональной модификации материалов [3], их сочетание с углеводами может привести к созданию новых биологически-активных соединений специфически распознаваемых животными и бактериальными клетками, а ароматический агликон может служить как линкером, так и придавать особую биологическую активность.

Целью данной работы было исследовать реакционную способность ряда гликозидов иодониевых солей с различными заместителями в лигандах в реакции восстановительного элиминирования в присутствии азидата натрия.

Для исследования реакционной способности был синтезирован ряд гликозидов иодониевых солей с различными заместителями в кольце А – от сильных акцепторов электронной плотности до сильных доноров.

При исследовании реакционной способности соединения **1a** в реакции восстановительного элиминирования в присутствии азидата натрия было получено 100 % продукта **2a**. При исследовании реакционной способности соединения **1i** в реакции восстановительного элиминирования в присутствии азидата натрия было получено 83 % продукта **2b**.

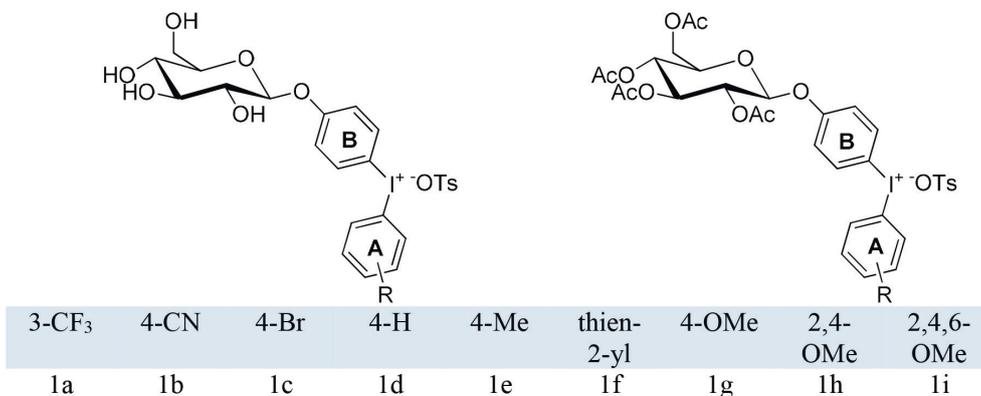


Рис. 1. Гликозиды иодониевых солей

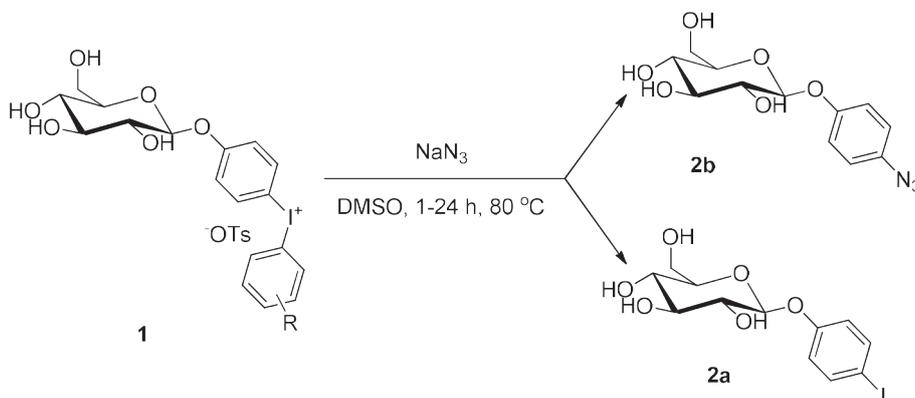


Рис. 2. Восстановительное элиминирование гликозидов иодониевых солей

Полученные результаты подтверждают имеющиеся данные о том, что в данной реакции нуклеофил преимущественно замещается в то кольцо, которое обладает меньшей электронной плотностью. При этом образуются пара-замещенные в бензольном кольце гликозиды. Исследования в данной области в дальнейшем могут

помочь синтезировать гликозиды, которые невозможно получить гликозилированием, а также вводить в углеводные молекулы радиоактивные изотопы в одну стадию для создания радиофармпрепаратов.

Работа выполнена при поддержке гранта РФФИ №21-73-10211.

Список литературы

1. K. Aradi, Z. Novák. *Synthesis & Catalysis*, 2018. – V. 357. – P. 371–376.
2. Viktor V. Zhdankin and Peter J. Stang. *Chemical Review*, 2002. – V. 102 (7). – P. 2523–2584.
3. M. He, T. M. Swager. *Chemistry of materials*, 2016. – V. 28. – P. 8542–8549.

АЦИЛИРОВАНИЕ ГАЛОДИФА АНГИДРИДОМ О,О'-ДИАЦЕТИЛВИННОЙ КИСЛОТЫ

Н. А. Беляева, В. Ю. Куксёнок

Научный руководитель – к.х.н., старший преподаватель В. Ю. Куксёнок

Национальный исследовательский Томский политехнический университет
634050, г. Томск, пр. Ленина, 30, pab30@tpu.ru

Антиконвульсант Галодиф представляет собой нециклическое производное мочевины (1-[(3-хлорфенил)(фенил)метил] мочевины). В отличие от предшественников, он сам является действующим веществом, не требующим трансформации в печени [1]. Препарат обладает широким спектром противосудорожного действия. Препарат имеет малую токсичность и хорошую переносимость, не вызывает осложнений [2].

В составе молекулы Галодифа содержится хиральный атом углерода, таким образом, данное соединение существует в виде двух оптических изомеров. Однако в настоящее время Галодиф производится в виде рацемата. Рацематы могут отличаться по биологической активности от индивидуальных энантиомеров [3]. Поэтому поиск способов энантиомерного разделения ра-

цемического Галодифа, а также методов анализа его энантиомерного состава является актуальной задачей современной органической химии.

Целью настоящей работы была разработка метода синтеза уреида галодифа с L-(+)-О,О'-диацетилвинной кислотой, а также разделение и исследование его индивидуальных диастереомерных форм.

Замещённые мочевины проявляют низкую активность в реакциях ацилирования, поэтому нами был проведён подбор условий и ацилирующего агента, позволяющих получить целевой уреид. В результате исследования было обнаружено, что наиболее подходящим способом является ацилирование галодифа ангидридом (+)-О,О'-диацетилвинной кислоты в толуоле в присутствии серной кислоты (рис. 1).

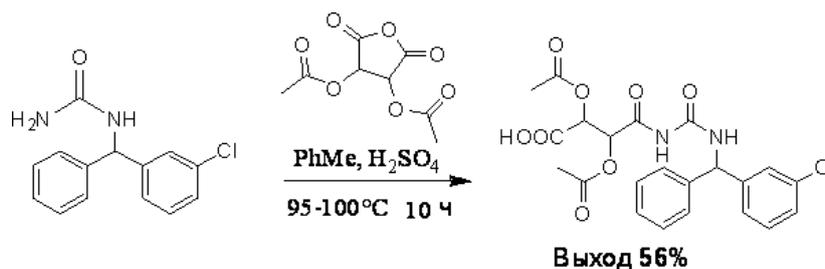


Рис. 1. Ацилирование галодифа ангидридом О,О'-диацетилвинной кислоты в присутствии серной кислоты