

Таблица 1. Результаты реакции борелирования в воде

Продукт	Соотношение S:B ₂ (OH) ₄	Время	T, °C	Выход %
4-NO ₂	1:2,5	3 ч. 30 мин.	25	80
3-NO ₂	1:1	3 ч. 20 мин.	60	49
4-COOH	1:0,7	11 мин.	60	50
4-Br	1:2,5	1 день 20 ч.	25	89
4-OCH ₃	1:2	3 часа	60	80

Таблица 2. Результаты реакций борелирования в этаноле при комнатной температуре

Продукт	S:B ₂ (OH) ₄	Время реакции	Выход %
4-Br	1:1	2 ч. 37 мин.	90
2-COOH	1:0,8	2 ч. 30 мин.	76
4-Br-2-COOH	1:0,8	1 ч. 30 мин.	96
3-NO ₂	1:1	3 ч. 39 мин.	40
4-NO ₂	1:1	2 часа	63

Таким образом был впервые разработан метод получения арилбороновых кислот из аренадиазоний трифторметансульфонатов и тетра-

гидроксидибора протекающий в «зеленых условиях»

Список литературы

1. Hall DG In *Boronic Acids*. Vol. 1. Hall DG. Wiley-VCH; Weinheim, 2011
2. N. Miyaura, A. Suzuki, *Chem. Rev.*, 1995.– 95.– 2457.
3. W. Yang, X. Gao, B. Wang, *Med. Res. Rev.*, 2003.– 23.– 346.
4. Jean-Yves Winum, Alessio Innocenti, Andrea Scozzafava. *Bioorg. Med. Chem.* 17 (2009).– 3649–3652.
5. Seaman W. and Johnson, J.R. (1931) *J. Am. Chem. Soc.*– 53.– 711–723.

ТРИХОЗИД, ТРИХОКАРПИН, ДЕЗОКСИТРИХОКАРПИН

Д.Д. Фёдорова

Научный руководитель – к.х.н., старший преподаватель Е.В. Степанова

Национальный исследовательский Томский политехнический университет
634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина 30, penene10@yandex.ru

В группу гликозидов простых фенолов относят такие гликозиды, которые при гидролизе гликозидной связи расщепляются на агликоны, содержащие одну или несколько фенольных групп при одном бензольном кольце [1]. Фенолгликозиды входят в состав многих лекарственных растений. Природные фенольные гликозиды обладают высокой биологической активностью [2].

Одним из представителей фенолгликозидов является Трихозид (Рис.1), который содержится в коре калифорнийского волосистоплодного тополя *P. Trichocarpa* [3]. Лекарственные препараты, изготовленные на основе коры тополя – давно известные народные средства для лече-

ния массы заболеваний. Сам трихозид, который содержится в коре тополя, обладает противовоспалительным, антисептическим, обезболивающим, смягчающим, жаропонижающим и успокаивающим нервную систему действием [3].

Несмотря на большой диапазон целебных свойств и ценность трихозида для медицинской химии, в литературе нет каких-либо упомина-

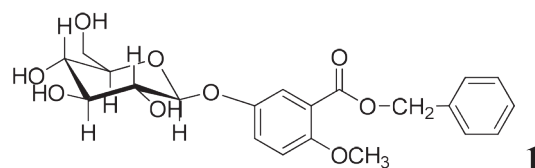


Рис. 1.

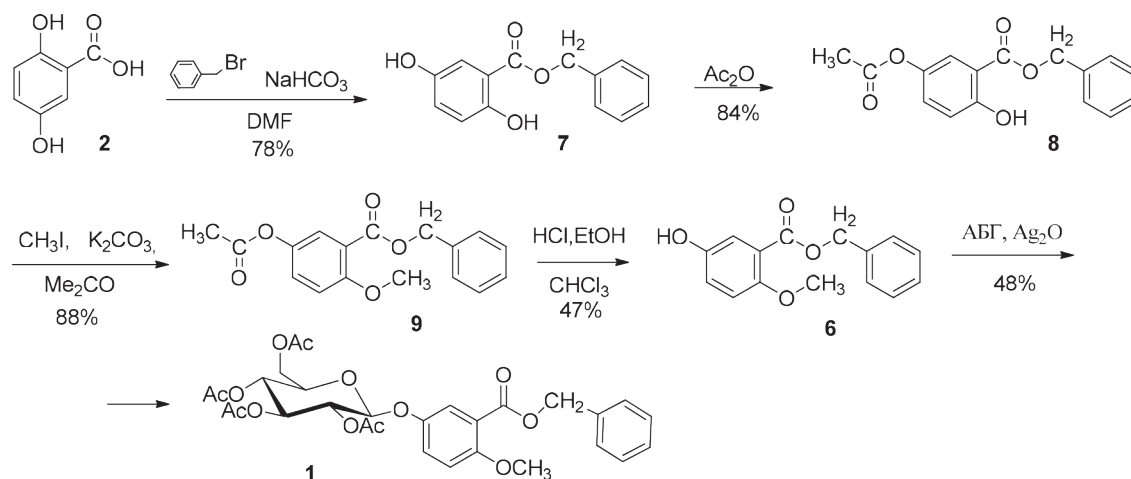


Рис. 2.

ний о попытках синтеза. Наибольшую сложность при разработке синтетических подходов к синтезу трихозида составляет получение агликона, а входящая в его состав – 5-гидрокси-2-метоксибензойная кислота является коммерчески недоступным соединением.

Поэтому целью нашей работы были разработка методики синтеза природного гликозида – трихозида и его производных.

Синтез трихозида проходил по следующей схеме: из гентизиновой кислоты (2) получали бензилгентизат (7), затем ацелировали, ацелирование прошло почти со 100% селективностью по одному гидроксилу. Полученное соединение 8 метилировали, в результате чего в первые было получено соединение (9) – ацетат агликона трихозида. Снимали защитную ацетильную группу в предложенной нами системе, состоящей из HCl, EtOH, CHCl₃, которая позволяет сохранить сложноэфирную бензильную группу. Затем проводили гликозилирование с использованием

хинолина, оксида серебра и АБГ, с получением трихозида (1).

Контроль за ходом реакции и чистотой полученных продуктов вели методом ТСХ. Детектирование пятен проводили в фильтрованном УФ-свете. Чистоту вещества доказывали ВЭЖХ – анализ проводили на жидкостном хроматографе.

Доказательство структуры полученных соединений проводилось методами ЯМР ¹H, ¹³C.

Таким образом, нами предложена простая удобная схема синтеза трихозида с общим выходом 13%. Впервые был получен агликон трихозида, а затем сам трихозид. Также предложенный нами метод оказался весьма универсальным для получения природных фенолгликозидов и с его помощью удалось получить еще два фенолгликозида – трихокарпин и дезокситрихокарпин.

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

Список литературы

1. Гринкевич Н.И., Сафронич Л.Н. // Химический анализ лекарственных растений, 1983. – С.176.
2. Карпук В.В. // Фармакогнозия, 2011. – С.341.
3. Irwin A. // Phytochemistry, 1968. – №4. – P.825.