

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ БЕТУЛИНА И АЛЛОБЕТУЛИНА С МЕТАНСУЛЬФОХЛОРИДОМ

А.В. Точин¹, М.Н. Мельникова¹, Н.А. Анисимова^{1,2}

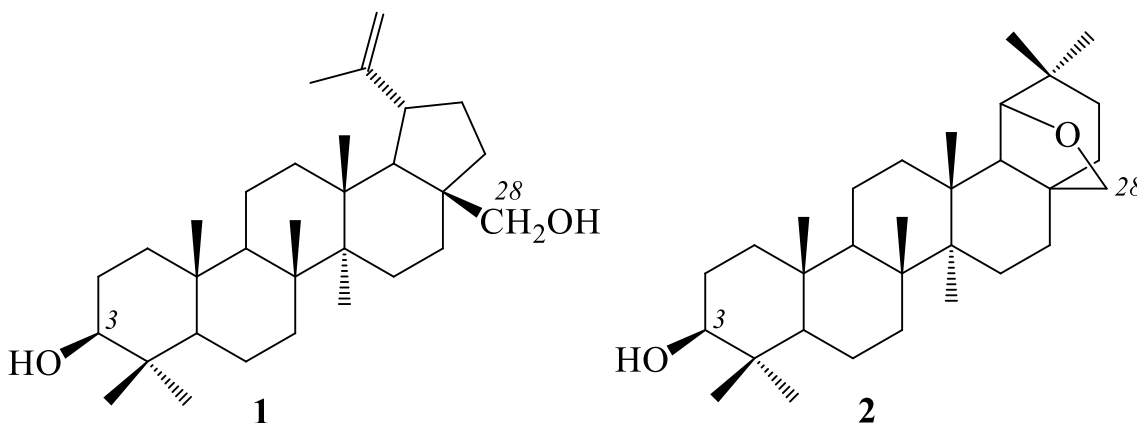
¹Высшая школа технологии и энергетики СПбГУПТД, ²РГПУ им. А. И. Герцена, Санкт-Петербург

tocha84@yandex.ru

Известно, что природные пентациклические тритерпеноиды лупанового ряда (бетулин, бетулиновая кислота, диацетат бетулина и др.) и их синтетические производные относятся к важному классу биологически активных веществ с широким спектром физиологической и фармакологической активности [1].

Особый интерес к лупановым тритерпеноидам обусловлен возможностью их применения в качестве лекарственных препаратов, обладающих токсичностью по отношению к злокачественным опухолям. Например, бетулиновая кислота интересна для медицины как основа для разработки новых противовирусных лекарственных средств, проявляющих ингибирующее действие по отношению к различным видам опухолей; диацетат бетулина проявляет гиполипидемические и желчегонные свойства, а также обладает гепатопротекторной активностью [2].

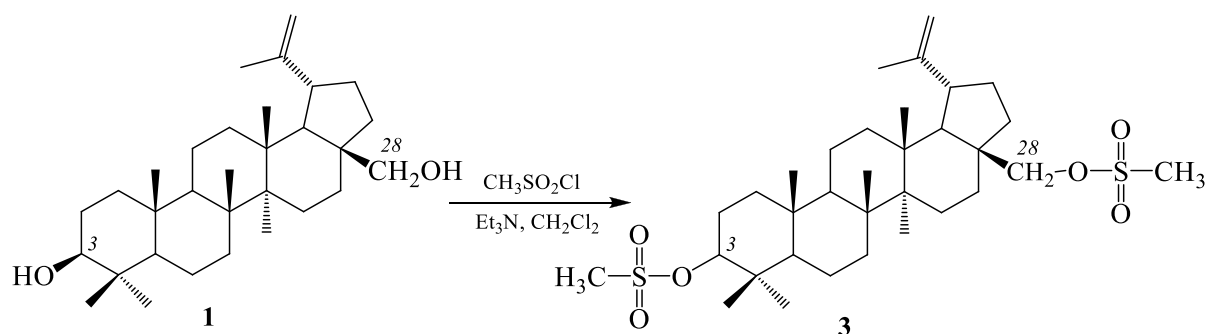
В качестве объектов исследования нами были использованы бетулин **1** и аллобетулин **2**, функционализация которых позволяет не только расширить ряд синтетических производных терпенов, но и использовать их в качестве доступных базовых соединений для дальнейшей модификации.



Мезилирование терпеноидов **1, 2** осуществляли по описанной в литературе методике [3] для 1,3,5-трис(мезилоксиметил)бензола.

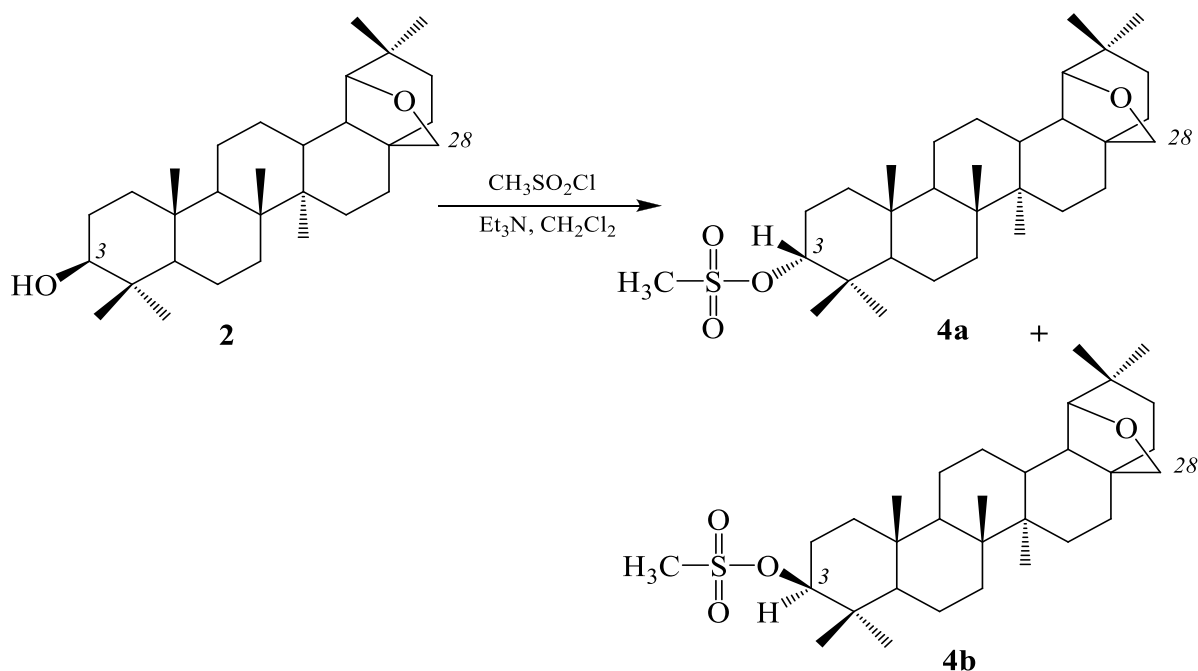
Взаимодействие терпеноида **1** с метансульфохлоридом осуществляли в среде хлористого метилена и в присутствии триэтиламина при 0°C в течение 1 ч. Получали целевой продукт – 3,28-ди-*O*-мезилбетулин **3** с выходом 94%.

В ходе данного взаимодействия осуществляется замещение атома водорода гидроксильной группы терпеноида на мезильную группу.



В указанных условиях осуществлялось мезилирование обеих гидроксильных групп по положениям 3 и 28.

По аналогичной методике получен продукт – 3-*O*-мезилаллобетулин в виде двух диастереомеров **4a**, **4b**, о чем свидетельствует удвоение сигналов метильных групп (CH_3SO_3^-) в спектре ЯМР ^1H реакционной смеси.



Методом колоночной хроматографии из реакционной смеси выделен один из диастереомеров продукта **4**. Синтезированные соединения **3** и **4** представляют собой пластинчатые кристаллы со светло-желтым оттенком.

Состав и строение полученных продуктов **3**, **4a**, **4b** подтверждено современными физико-химическими методами исследования ИК, ЯМР ^1H спектроскопии и масс-спектрометрии.

Список литературы

1. Толстикова Г.А. // Химия в интересах устойчивого развития. 2005. Т. 13. № С. 1-30.
2. Василенко Ю.К., Семенченко В.Ф., Фролова Л.М. // Экспериментальная и клиническая фармакология. 1993. Т. 56. №4. С. 53-55.
3. Mihra A., Naram N.S. // Dyes and Pigments. 2004. Vol. 63. N 2. P. 191-202.