

СИНТЕЗ НОВОГО ПРОИЗВОДНОГО КОЛХАМИНА С ПРОПЕНИЛЭТИНИЛКАРБИНОЛАМ

Аликулов Рустам Валиевич

канд. хим. наук, доцент, Термезский государственный университет,
Узбекистан, г. Термез

E-mail: rv_alikulov@rambler.ru

Гелдиев Юсуф Аллаярович

преподаватель, Термезский государственный университет,
Узбекистан, г. Термез

Рузиева Бахтигул Юлдашевна

ст. преп., Термезский государственный университет,
Узбекистан, г. Термез

Атамуратова Дилором Маматмуминовна

преподаватель, Термезский государственный университет,
Узбекистан, г. Термез

Имамова Лобар

преподаватель, Термезский государственный университет,
Узбекистан, г. Термез

Нуралиев Гайрат Тураевич

преподаватель, Термезский государственный университет,
Узбекистан, г. Термез

SYNTHESIS OF A NEW DERIVATIVE OF COLCHINE WITH PROPENYLETHINYLCARBINOLS

Rustam Alikulov

Associate Professor, Candidate of Chemical Sciences, Termez State University,
Uzbekistan, Termez

Yusuf Geldiev

Lecturer, Termez State University,
Uzbekistan, Termez

Baxtigul Ruzieva

Lecturer, Termez State University,
Uzbekistan, Termez

Dilorom Atamurotova

Lecturer, Termez State University,
Uzbekistan, Termez

Lobar Imamova

Lecturer, Termez State University,
Uzbekistan, Termez

Gayrat Nuraliev

Lecturer, Termez State University,
Uzbekistan, Termez

АННОТАЦИЯ

Синтезированы 4-(колхамин N/пропенил-1-бутин-2) карбинол. Строения синтезированных соединений подтверждены данными ИК- и ПМР-спектров.

ABSTRACT

Synthesized 4- (colchamino N/propenyl-1-butyn-2) carbinol. The structures of the synthesized compounds are confirmed by the data of IR and PMR spectra.

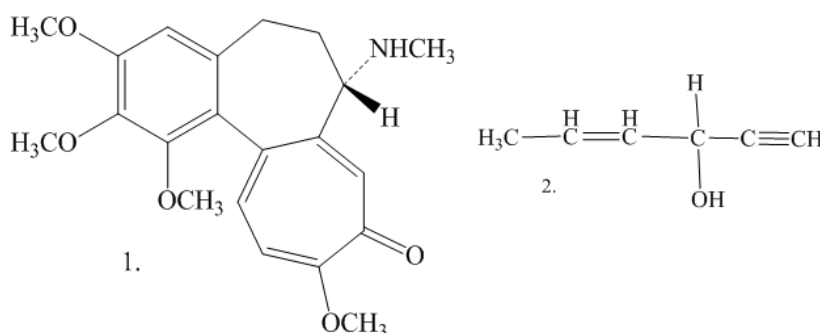
Ключевые слова: Колхамин, пропенилэтинилкарбинолам 4-(колхамин N/пропенил-1-бутин-2) карбинол.

Keywords: Colchamine, propenylethynylcarbinolam 4- (colchamino N / propenyl-1-butyn-2) carbinol.

Введение. Известно, что введение в молекулу лекарственных веществ групп, содержащих ацетиленовую связь, заметно снижает их токсичность. Ввиду того, что такая работа в области колхициновых алкалоидов ранее не проводилась, нами синтезированы

производных колхамина (1) со пропенилэтинилкарбинол (2) [3].

Исходные соединения для синтеза ацетиленовых производных колхамина (1) :



Экспериментальная часть.

а) Производные, колхамина со пропенилэтинилкарбинолом. Навеску 1,0 г колхамина растворяли в 17 мл высушенного и свежеперегнанного диоксана и

в раствор добавляли 0,12 г пара-форма, 0,01 г гидрохинона и 0,03 г однохлористой меди. После этого добавив в раствор ещё эквимолекулярное количество пропенилэтинилкарбинол содержимое колбы хорошо перемешивали.

Таблица 1.

Условия реакции пропенилэтинилкарбинол с колхамина

№	Реагент	Расчетное количество реагента	Взятое количество реагента	Выход продукта (%)
1.	Колхамин	0,78	1,0	93

Реакционную смесь нагревали на глицириновой бане с обратным холодильником при 70-90° в течение 4-6 часов, Окончание реакции определяли по тонкослойной хроматографии реакционной смеси.

После практического окончания реакции нерастворимые в диоксане вещества отделяли фильтрованием и растворитель (диоксан) отгоняли на роторной установке. Остаток растворяли в 20-30 мл хлороформа, полученный очень темный хлороформный раствор трехкратно экстрагировали по 20 мл 5%-ной уксусной кислоты.

Уксуснокислый экстракт содержит непрореагировавший колхамин, который выделили подщелачиванием кислого раствора аммиаком и экстракцией хлороформом.

Хлороформный раствор продукта реакции, после отделения исходного колхамина, сушили над безводным сульфатом натрия, сульфат отфильтровали и фильтрат пропускали через небольшой слой (5-7 г)

окси алюминия. При этом темный экстракт сильно осветляется. Растворитель отгоняли и продукт реакции сушили в вакуум-эксикаторе.

Результаты и их обсуждение. Реакцию конденсации колхамина с ацетиленовыми соединениями проводили по Манниху [4], в эквимолекулярных соотношениях реагентов:

Основное исходное соединение - колхамин (1) для проведенных синтезов был выделен из *Colchicum luteum baker* произрастающий Сурхандаринской области.

В результате нами синтезированы; 4-(колхамин N/пропенил-1-бутин-2) карбинол (3) (табл.2) [5].

Полученные соединения представляют светло-желтого цвета порошки, о близкими между собой значениями R_f . В то же время по хроматографической подвижности они сильно отличаются от исходных колхамина, имея высокие значения R_f .

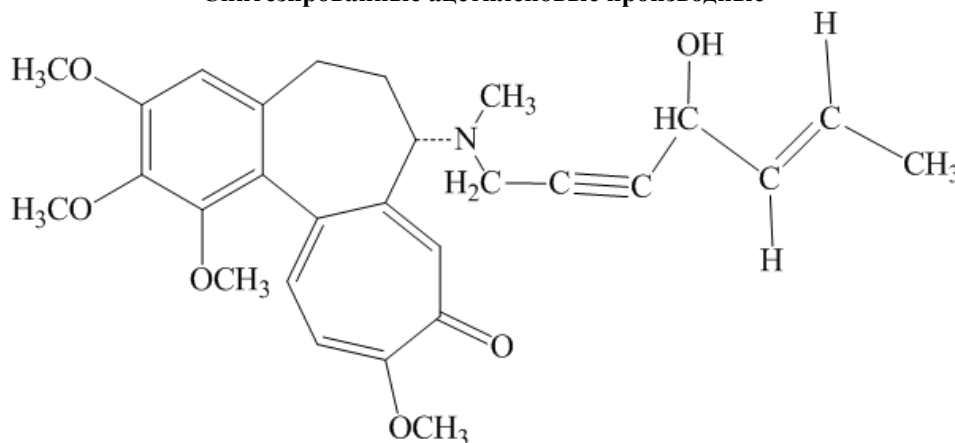
Характерным для всех ацетиленовых производных является присутствие в их ПМР-спектрах двухпротонного дублета от мостиковой N-CH₂- группы, который проявляется в области 3,32-3,38 м.д. Мостиковая же OCH₃-группа, имеющаяся в соединениях 4-5, образует узкий двухпротонный дублет в области 4,53-4,70 м.д.

Строения синтезированных соединений подтверждены данными ИК- и ПМР-спектров. В ИК-спектрах соединений со сложноэфирной группировкой

(3-4) проявляются полосы поглощения карбонильной группы (1735-1730 см⁻¹).

Колхаминовая фрагменты синтезированных соединений в-ПМР-спектрах существенно не различаются: сигналы N-метильной группы проявляются при 2,20-2,22 м.д., метоксильных групп - 3,56-3,60 (при C-1) и 3,82-3,85 м.д. (при C-2, C-3 C-10), протона Н-4 - при 6,44-6,51 м.д., Н-8 - 7,90-7,96 м.д., Н-11 - 6,68-6,75 м.д. и Н-12 - 7,17-7,22 м.д.

Синтезированные ацетиленовые производные



4-(колхамино N/пропенил-1-бутин-2) карбинол (3).

ИК-спектр: 1210, 1140, 1730, 2600, 3000, 3410, 3540 см⁻¹.

ПМР-спектр: 1,60, 1,85 (CH₂), 2,05 (CH₃), 2,26 (N-CH₃), 3,58; 3,85 x 2, 3,83 (3H x 4, cc, 4OCH₃), 5,16 (OH), 6,48 (H-4), 6,94 (H-11), 7,24 (H-12 и H-8) м.д.

Выводы.

1. Синтезированы новые производные колхамина с пропенилэтинилкарбинолам.

2. Синтезированного соединения подтверждены ПМР и ИК спектральными данными.

Список литературы:

1. Киселев В.В., Меньшиков Г.П. Химические свойства колхамина. Докл. АН СССР. 1953. Т. 88. №5. С. 825-827.
2. Santavy F. Substanzen der Herbstzeitlose und ihre Derivate. XXVII. Beitrag zur Konstitution der Substanz F. – Collect. Czech.Chem.Comm., 1951, B.16, №7, s. 676-688.
3. Аликулов Р.В. Алкалоиды Colchicum kesselringii Rgl. и Merendera robusta Vge. строения новых гомопроропфиновых и гомоапорфиновых алкалоидов. Дисс. на соиск.уч.степ. к.х.н., Ташкент, 1993. С. 53-57.
4. Вацуру К.В., Мищенко Г.Л. Именные реакции в органической химии. М., 1976
5. Юсупов М.К., Аликулов Р.В., Чоммадов Б.Ч., Насирова Б., Закиров С. Новые N-ацильные производные колхамина // Четвертое всесоюзное совещание по химическим реактивам. Тез. докл. и сообщений. Баку. 1991. Т.1. С.125.