

СИНТЕЗ 8-БРОМКОФЕИНА

Ведение. Бромкофеин – соединение представляющие собой большой практический интерес, так как является основой для получения ряда перспективных биологически активных веществ. Которые в свою очередь могут быть применены для производства лекарственных препаратов.

Целью данной работы являлся синтез 8-бромкофеина.

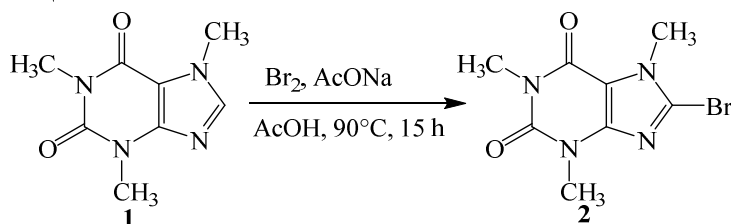
Для достижения поставленной цели были сформулированы следующие задачи:

1. Анализ литературы по синтезу производных кофеина.
2. Выделение кофеина **1** из раствора кофеина-бензоата натрия.
3. Проведение синтеза 8-бромкофеина **2**.
4. Выделение и анализ синтезированного производного кофеина.

Материалы и методы. Для проведения синтеза были использованы следующие реактивы: раствор кофеина-бензоат натрия 20% (ОАО «Борисовский завод медицинских препаратов», РБ), ледяная уксусная кислота (хч, ЗА, «ПЯТЬ ОКЕАНОВ», РБ), ацетат натрия безводный (хч, ООО «АО Реахим», РФ), бром (хч, ООО «АО Реахим», РФ), хлороформ (хч, ООО «АО Реахим», РФ), сульфат натрия безводный (хч, ООО «АО Реахим», РФ).

К водному раствору кофеина-бензоата натрия объемом 13 см³ добавили хлороформ объемом 15 см³ и при непрерывном перемешивании проводили экстрагирование в течение 5 мин, хлороформный слой отделили на делительной воронке. Далее к отделенному водному слою добавили новую порцию хлороформа и продолжили экстракцию (экстрагирование проводили 3 раза по 20 см³). Объединив полученные хлороформные фракции, провели их обезвоживание с помощью безводного сульфата натрия. Далее на роторном испарителе (ИКА RV10 digital) провели упаривание полученного экстракта. Масса кофеина **1** на выходе составила 1,15 г.

На представленной ниже схеме представлена реакция бромирования кофеина. Процесс осуществляли в круглодонной колбе с обратным холодильником при температуре 90°C при постоянном перемешивании. К раствору кофеина **1** и безводного ацетата натрия в уксусной кислоте прикапывали раствор брома в том же растворителе. Контроль за ходом реакции осуществляли с помощью ТСХ.



После окончания процесса бромирования осадок отфильтровали на фильтре Шотта при пониженном давлении. Далее осадок был промыт ледяной уксусной кислотой, раствором соды и высушен. Масса осадка составила 0,3 г (выход 20% от теор.). По данным ТСХ реакция протекала практически полностью, но условия выделения и очистки продукта не оптимизировались, с этим и связан относительно низкий выход продукта. Для контроля чистоты полученного 8-бромкофеина **2** была определена температура плавления (207°C), которая соответствовала литературным данным.

Результаты и выводы. Нами был получен 8-бромкофеин с удовлетворительным выходом из доступного фармацевтического сырья. Дальнейшая работа будет направлена на усовершенствование процесса синтеза и получение новых биологически активных производных на основе 8-бромкофеина.