

KHẢO SÁT MỘT SỐ YẾU TỐ ẢNH HƯỞNG ĐẾN SỰ HỒ BIẾN IMIN-ENAMIN CỦA MỘT SỐ DẪN XUẤT BASE SCHIFF CỦA GOSSYPOL

Nguyễn Kim Phi Phụng, Đỗ Thị Mỹ Liên, Tôn Thất Quang, Phạm Đình Hùng
Khoa Hóa, Trường Đại học Khoa học Tự Nhiên - ĐHQG tp.HCM

Tóm tắt:

Gossypol là sắc tố màu vàng cô lập từ hạt bông vải *Gossypium herbaceum*. Hợp chất này đã được chứng minh là có khả năng ức chế virus HIV loại 1; giết vi khuẩn sốt rét *Plasmodium falciparum*; giết các tế bào ung thư của người (phổi; vú; bệnh bạch cầu...). Tuy vậy, gossypol có tính độc và các nghiên cứu cho biết độc tính là do hai nhóm chức aldehyd của gossypol; vì thế, các nhà nghiên cứu thường điều chế những dẫn xuất base Schiff của gossypol để mong mỗi có được những hợp chất mới vẫn giữ được những hoạt tính sinh học như trên nhưng giảm hoặc không độc.

Các nghiên cứu về những dẫn xuất base Schiff của gossypol từ trước đến nay (1985-2000) đều chỉ cho biết sản phẩm hiện diện hoặc ở dạng imin hoặc ở dạng enamin và không cho biết điều kiện thực hiện phản ứng. Các nghiên cứu của chúng tôi (từ năm 2000 đến nay) cho thấy những dẫn xuất base Schiff của gossypol luôn luôn được thành lập trước tiên ở dạng imin. Nếu cô lập sản phẩm ra khỏi mọi trường phản ứng và làm khô thì sản phẩm luôn luôn ở dạng imin; nếu hỗn hợp sản phẩm vẫn ở trong dung môi, ở nhiệt độ phòng, dưới ánh sáng thấy được thì sau một thời gian, sản phẩm sẽ hồ biến qua dạng enamin.

Trong phần báo cáo này, chúng tôi trình bày phần khảo sát một số yếu tố có thể gây ảnh hưởng lên sự hồ biến imin-enamin của những dẫn xuất base Schiff của gossypol

-Ảnh hưởng của những amin chi phương có dây carbon dài ngắn khác nhau (từ 3 đến 8 carbon) được sử dụng để ghép vào gossypol. Phản ứng được thực hiện trong điều kiện trong dung môi, ở nhiệt độ phòng, dưới ánh sáng thấy được.

-Ảnh hưởng của những amin thơm (có mang các nhóm thế khác nhau ở vị trí *para*) được sử dụng để ghép vào gossypol. Phản ứng được thực hiện trong điều kiện trong dung môi, ở nhiệt độ phòng, dưới ánh sáng thấy được.

-Ảnh hưởng của sự hiện diện alumin dùng làm chất mang rắn để tẩm riêng rẽ gossypol và tác chất alkilamin; rồi sau đó trộn hai bột khô lại với nhau để thực hiện phản ứng trong môi trường khô, không dung môi.

STUDY ON SOME FACTORS WHICH COULD INDUCE THE IMINE-ENAMINE TAUTOMERISM OF SCHIFFBASE ADDUCTS OF GOSSYPOL

Nguyen Kim Phi Phung, Do Thi My Lien, Ton That Quan, Pham Dinh Hung
Department of Chemistry, University of Natural Sciences - VNU.HCM

Abstract:

Gossypol exhibits a number of interesting types of biological activity, including antitumor, antimalarial, anti-HIV effects. But gossypol is toxic and this toxicity may be related to the two functional aldehyde groups in the molecule. So, many authors would like to synthesize the Schiffbases adducts of gossypol with the hope that the new derivatives will be less toxic but still keep the initial biological activity well.

From 1985 to 2000, there were many authors working on this subject. These authors did not pay attention on the fact that the Schiffbases adducts of gossypol might tautomerize from the imine form to the enamine one.

Our work showed that all adducts were initially performed under the imine form as the conventional mechanism of the reaction between an aldehyde group of one molecule with an amino group of another molecule. If adducts were immediately isolated from the reaction solution and were dried, they always stayed under the imine form. If adducts were still in solution, after a certain time, at room temperature, in visible light, the imine-enamine tautomerism happened.

We would like to study some factors which effect the imine-enamine tautomerism of the Schiffbases adducts of gossypol:

- the length of the aliphatic amines
- the substituents at para position in the aromatic amines
- the technique of separately impregnating gossypol and amine on alumina