



УДК 547.821.2'11\*3.052

## ВВЕДЕНИЕ ТРИТИЕВОЙ МЕТКИ В 3-ГИДРОКСИ-6-МЕТИЛ-2-ЭТИЛПИРИДИН

*Шевченко В. П., Мясоедов Н. Ф.*

*Институт молекулярной генетики Академии наук СССР, Москва*

Для введения изотопной метки в оксипиридины (например, в производные витамина В<sub>6</sub>) обычно используются химические методы или изотопный обмен с тяжелой водой (<sup>2</sup>H<sub>2</sub>O) [1]. Для получения меченных тритием оксипиридинов такие методы не всегда удачны. Некоторые производные оксипиридинов (например, гидрохлорид 3-гидрокси-6-метил-2-этилпиридина) не имеют функциональных групп, способных к восстановлению тритидами металлов, а получение тритиевой воды с высокой молярной радиоактивностью и работа с ней являются самостоятельной трудноразрешимой задачей.

В настоящей работе описано получение меченного тритием гидрохлорида 3-гидрокси-6-метил-2-этилпиридина методом гетерогенного каталитического изотопного обмена с газообразным тритием в растворе [2]. Сложность использования этого метода связана с тем, что ароматические амины являются дезактиваторами катализаторов на основе переходных металлов [3]. Реакцию гетерогенного изотопного обмена проводили в хлороформе, метаноле, воде при разных давлениях трития (в опыте использовали 0,18–0,21 ТБк трития) в течение 2–5 ч и в интервале температур 20–27° С (катализатор – 5% Pd/BaSO<sub>4</sub>) (таблица).

Лучшие результаты получены при использовании метанола при давлении трития 400 гПа (время реакции 3 ч и температура 25° С). Идентичность меченого препарата с исходным соединением устанавливали методом ТСХ на пластинках силуфол UV<sub>254</sub> в системе бензол – метанол, 9:1 (R<sub>f</sub> гидрохлорида 3-гидрокси-6-метил-2-этилпиридина – 0,17) и спектральными

**Введение тритиевой метки в гидрохлорид 3-гидрокси-6-метил-2-этилпиридина \***

Растворитель	Давление, гПа	Температура, °С	Время, ч	Выход, %	Молярная радиоактивность, ТБк/моль
Хлороформ	350	25	3	92	9,6
	400	25	3	90	11,1
	400	27	3	87	11,5
	400	20	3	91	8,3
	400	25	2	89	9,2
	400	25	5	86	11,0
Метанол	350	25	3	90	9,8
	400	25	3	88	12,8
	400	27	3	83	12,3
	400	20	3	88	10,1
	400	25	2	82	10,5
	400	25	5	85	12,3
Вода	350	25	3	93	7,9
	400	25	3	87	10,3
	400	27	3	85	10,2
	400	20	3	89	7,5
	400	25	2	92	8,1
	400	25	5	85	10,3

\* Соотношение катализатор — вещество 3:2, катализатор — 5% Pd/BaSO<sub>4</sub>. Подчеркнуты лучшие результаты для каждого растворителя.

методами (УФ-спектры снимали на спектрометре Spesord UV VIS в метаноле,  $\lambda_{\text{макс}}$  290). Радиохимическая чистота меченого препарата не менее 95–97%.

Таким образом, предложенный метод применим для введения трития в ароматические амины.

Проверка препарата, проведенная в Институте химической физики АН СССР, показала его пригодность для биохимических исследований (данные будут опубликованы отдельно).

#### ЛИТЕРАТУРА

1. Coburn S. P., Lin C. C., Schaltenbrand W. E., Mahuren J. D. J. Label. Compounds and Radiopharm., 1982, v. 19, № 5, p. 703–716.
2. Шевченко В. П., Мясоедов Н. Ф. Химия природн. соедин., 1980, № 5, с. 657–663.
3. Физер Л., Физер М. Реагенты для органического синтеза. М.: Мир, 1970, с. 136–137.

Поступило в редакцию  
11.III.1986

#### TRITIUM LABELLING OF 3-HYDROXY-2-ETHYL-6-METHYLPYRIDINE

SHEVCHENKO V. P., MYASOEDOV N. F.

*Institute of Molecular Genetics, Academy of Sciences of the USSR, Moscow*

3-Hydroxy-2-ethyl-6-methylpyridine hydrochloride was labelled in solution by means of gaseous tritium in the presence of palladium catalyst. The labelled compound was purified by thin-layer chromatography and shown to be suitable for biological studies.