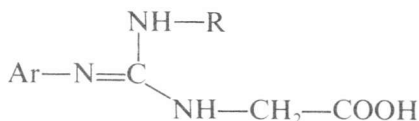


Zlúčeniny vyvolávajúce sladkú chuť. VII. Extrémne sladké deriváty guanidínu

MICHAL UHER—ALŽBETA KRUTOŠÍKOVÁ—MILAN KOVÁČ

Súhrn. Uvádzajú sa niektoré poznatky o veľmi sladkých syntetických derivátoch guanidínu, ktoré sa ako sladidlá zatiaľ nepoužívajú. Opisuje sa ich štruktúra, syntéza a vlastnosti.

V roku 1988 bola patentovaná [1] skupina sladkých látok s extrémne vysokou sladivosťou — disubstituované guanidínové deriváty kyseliny octovej všeobecného vzorca



R = alkyl, Ar = aryl.

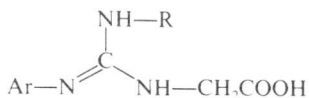
Autori uvádzali, že najsladšie boli deriváty ak Ar = 4-kyanofenyl- alebo 3,5-dichlorofenyl, R = benzyl-, cyklohexyl-, resp. cyklooktyl (tab. 1).

Na syntézu týchto látok použili reakciu príslušných izotiomočovín s amínmi.

Doc. Ing. Michal Uher, CSc., Prof. Ing. Alžbeta Krutošiková, DrSc., Katedra organickej chémie, Chemickotechnologická fakulta STU, Radlinského 9, 812 37 Bratislava.

Ing. Milan Kováč, CSc., Výskumný ústav potravinársky, Priemyselná 4, 820 06 Bratislava.

Tabuľka 1. Relatívna sladivosť guanidínoctových kyselín
Table 1. Relative sweetening ability of guanidine acetic acids

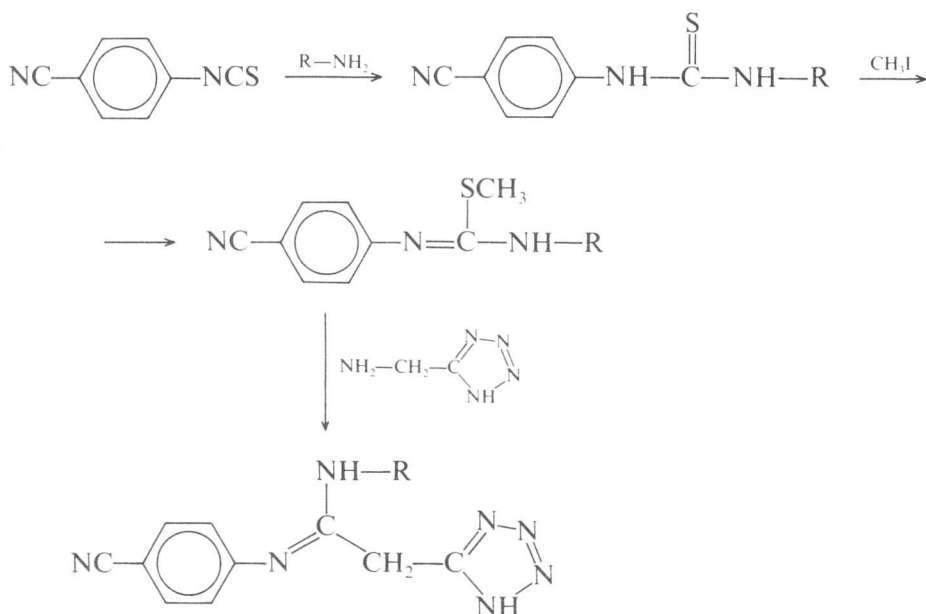


Zlúčenina ¹	Ar	R	Rel. sladivosť ^{a2}
1	4-kyanofenyl ³	cyklohexyl ⁵	12 000
2		cyklooktyl ⁶	170 000
3		benzyl ⁷	30 000
4	3,5-dichlórfenyl ⁴	l-naftyl ⁸	60 000
5		benzyl ⁷	80 000
6		cyklooktyl ⁶	60 000
7		l-naftyl ⁸	30 000

a — 2% roztok sacharózy; 2% saccharose solution.

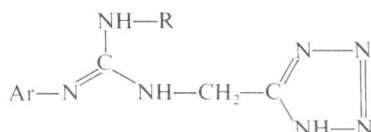
¹Compound, ²Relative sweetening ability, ³4-Cyanophenyl, ⁴3,5-Dichlorophenyl, ⁵Cyclohexyl, ⁶Cyclooctyl, ⁷Benzyl, ⁸l-Naphtyl.

Ďalšiu skupinu extrémne sladkých organických látok opísal Owens a kol. [2]. Karboxylovú skupinu v guanidínovej sérii sladkých látok nahradili 5-tetrazolovú skupinou. Syntézu tetrazolových analógov guanidínu uskutočnili takto:



Vo všeobecnosti je relatívna sladivosť týchto látok podstatne nižšia oproti predošlej sérii (tab. 2).

Tabuľka 2. Relatívna sladivosť guanidintetrazolových derivátov
Table 2. Relative sweetening ability of guanidine derivatives

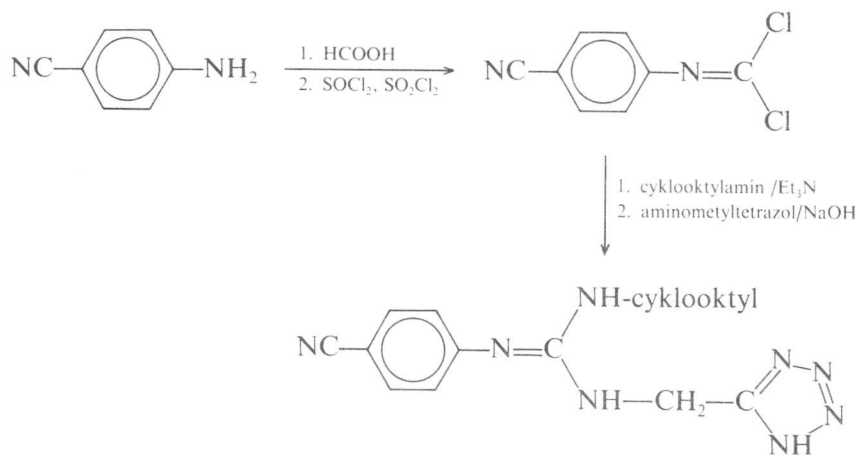


Zlúčenina ¹	Ar	R	Rel. sladivosť ^{a2}
1	4-kyanofenyl ³	H	50 ^a
2		benzyl ⁵	700 ^b
3		cyklooktyl ⁶	5000 ^a
4		l-naftyl ⁷	500 ^a
5	3,5-dichlórfenyl ⁴	cyklooktyl ⁶	400 ^c
6		benzyl ⁵	400 ^c
7		l-naftyl ⁷	70 ^b

a — 5% roztok sacharózy; 5% saccharose solution, b — 7% roztok sacharózy; 7% saccharose solution, c — 4% roztok sacharózy; 4% saccharose solution.

For explanations 1—4 see Table 1. ⁵Benzyl, ⁶Cyclooctyl, ⁷l-Naphtyl.

Nedávno bola opísaná jednoduchá metóda na syntézu týchto derivátov a to: reakciou karboimidoyldichloridu s príslušnými amínmi za prítomnosti trietylamínu [3] napr.:



61% výťažok, t. t. 175 – 176°C

V súčasnosti sa študuje možnosť využitia týchto látok ako komerčných produktov. Z porovnania relatívnej sladivosti medzi karboxylom a 5-tetrazolyllovou skupinou možno usudzovať na zníženú afinitu receptora pre tetrazolylderiváty.

Literatúra

1. Eur. Patent Appl. 241 395, okt. 14, 1987; Chem. Abstr., 109, 1988, 190047.
2. OWENS, W. H.—KELLOG, M. S.—KLADE, C. A.—MADIGAN, D. L.—MAZUR, R. H.—MULLER, G. W., In: Sweeteners. Discovery, Molecular Design and Chemoreception. Walters, D. E.—Orthoefer, F. T.—Du Bois, G. E. (Eds.). ACS Symposium Series 450. Washington, DC, American Chemical Society 1991, s. 100—112.
3. NAGARAJAN, S.—HO, TSE-LOK—DUBOIS, G. E., Synth. Commun., 22, 1992, s. 1191.

Do redakcie došlo: 19. 8. 1992

Compounds developing sweet taste. VII. Extremely sweet derivatives of guanidine

Summary

Information about extremely sweet organic matters, which are not yet used as sweeteners, are introduced in the survey. Their structure, synthesis and characteristics are described.

Соединения вызывающие сладкий вкус. VII. Экстремно сладкие производные гванидина

Резюме

В работе даются знания об экстремно сладких синтетических органических веществах, которые пока еще не используются в качестве сладких веществ. Описывается их структура, синтез и свойства.