

А К А Д Е М И Я Н А У К С С С Р

**Ж У Р Н А Л
О Р Г А Н И Ч Е С К О Й
Х И М И И**

Т о м ІІІ

О Т Д Е Л Ь Н Ы Й О Т Т И С К



**ИЗДАТЕЛЬСТВО „НАУКА“
МОСКВА 1967 ЛЕНИНГРАД**

АМИДЫ И ГИДРАЗИДЫ ЩАВЕЛЕВОЙ КИСЛОТЫ**ХIII. АМИДЫ АРИЛСУЛЬФОНИЛОКСАМИНОВЫХ
И 4-СУЛЬФАМИЛОКСАНИЛОВОЙ КИСЛОТ
С АСИММЕТРИЧЕСКИМИ ЗАМЕСТИТЕЛЯМИ**

П. А. Петюнин, В. П. Черных

В литературе известны многочисленные примеры влияния оптической деятельности на биологическую активность соединений [1]. В развитие предыдущих исследований [2, 3] нами осуществлен синтез N-замещенных амидов арилсульфонилоксаминовых (I—VII) и 4-сульфамилоксаниловой (VIII, IX) кислот с асимметрическими радикалами. Сульфамиды (I—VII) получали при конденсации арилсульфамидов $4\text{-RC}_6\text{H}_4\text{SO}_2\text{NH}_2$ ($\text{R}=\text{H}$,

CH₃, Cl, NH₂) с эфирами N-замещенных оксаминоновых кислот RNHCOCOOC₂H₅ [R=борнил (X), 1,2,3,4-тетрагидро-β-нафтил (XI)]; сульфамиды 4-H₂NO₂SC₆H₄NHCOCONHR [R=борнил (VIII), 1,2,3,4-тетрагидро-β-нафтил (IX)] получены амидированием этилового эфира 4-сульфаминоксаниловой кислоты (XII).

Сульфамиды — кристаллические вещества, растворимые в водных щелочах; соединения (VIII, IX) с оксаминоильным радикалом при амино-группе имеют более высокие температуры плавления.

ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

Сульфамиды (I—VII) получали по методу [3], свойства их приведены в таблице.

Этиловый эфир борнилоксаниновой кислоты (X). 12.7 г борниламина [4] в 20 мл этанола прибавляют к раствору 16 г диэтилоксалата в 30 мл этанола при температуре не выше 3°. После исчезновения щелочной реакции отгоняют этанол и остаток перегоняют в вакууме. Выход 14.7 г (70%). Т. кип. 175—177° (6 мм), d_4^{20} 1.0462, n_D^{20} 1.4919. Найдено %: N 5.87. C₁₄H₂₃NO₃. Вычислено %: N 5.53.

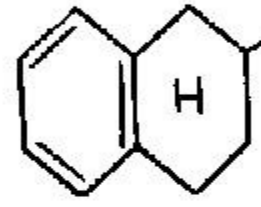
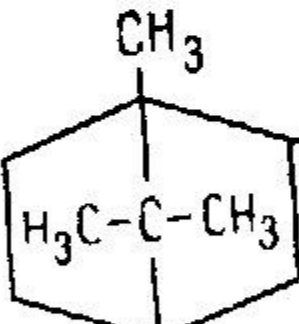
Этиловый эфир 1,2,3,4-тетрагидро-β-нафтил-оксаминоновой кислоты (XI) получен аналогично из 14.7 г 1,2,3,4-тетрагидро-β-нафтиламина [5] и 19 г диэтилоксалата. Выход 60%, иглы, т. пл. 67—68° (из петролейного эфира). Найдено %: N 5.93. C₁₄H₁₇NO₃. Вычислено %: N 5.67.

Борниламид 4-сульфаминоксаниловой кислоты (VIII). Раствор 10.88 г эфира (XII) и 6.12 г борниламина в 40 мл диметилформамида кипятят 3 часа, разбавляют 5-кратным количеством воды, подкисляют соляной кислотой; осадок отфильтровывают, промывают водой и сушат на воздухе. Выход 14 г (93%), иглы, т. пл. 239—240° (из этанола). Найдено %: N 11.21. C₁₈H₂₅N₃O₄S. Вычислено %: N 11.08.

1,2,3,4-Тетрагидро-β-нафтиламид 4-сульфаминоксаниловой кислоты (IX) получен с выходом 93%. Иглы, т. пл. 284° (разл., из водного диметилформамида). Найдено %: N 11.60. C₁₈H₁₉N₃O₄S. Вычислено %: N 11.26.

N-Замещенные амиды арилсульфонил-оксаминоновых кислот



| № соединения | R | R' | Выход (в %) | Т. пл. * | Найдено % N | Формула | Вычислено % N |
|--------------|-----------------|---|-------------|-----------|-------------|---|---------------|
| I | H |  | 84 | 168—169° | 8.12 | C ₁₈ H ₁₈ N ₂ O ₄ S | 7.82 |
| II | NH ₂ | | 73 | 178—179.0 | 11.40 | C ₁₈ H ₁₉ N ₃ O ₄ S | 11.26 |
| III | Cl | | 56 | 170—172.0 | 7.38 | C ₁₈ H ₁₇ ClN ₂ O ₄ S | 7.13 |
| IV | CH ₃ | | 67 | 179—180.0 | 7.74 | C ₁₉ H ₂₀ N ₂ O ₄ S | 7.53 |
| V | H |  | 93 | 190—191.0 | 7.91 | C ₁₈ H ₂₄ N ₂ O ₄ S | 7.69 |
| VI | Cl | | 50 | 187—187.5 | 7.17 | C ₁₈ H ₂₃ ClN ₂ O ₄ S | 7.03 |
| VII | CH ₃ | | 71 | 183—185.0 | 7.66 | C ₁₉ H ₂₆ N ₂ O ₄ S | 7.41 |

Выводы

Для изучения взаимосвязи между химическим строением и биологической активностью получен ряд замещенных амидов арилсульфонил-оксаминоновых и 4-сульфаминоксаниловой кислот с асимметрическими радикалами.

* Соединение (I) кристаллизуют из толуола, (III) — из ледяной уксусной кислоты, остальные — из этанола.

Литература

[1] Н. А. Преображенский, Э. И. Генкин. Химия органических лекарственных средств, ГХИ, 251, 471 (1951). — [2] П. А. Петюнин, В. П. Черных, Н. Н. Валяшко, Сб. ЖОХ «Биол. акт. соед.», 158 (1965). — [3] П. А. Петюнин, В. П. Черных, ЖОрХ, 2, 285 (1966). — [4] М. С. Пешекерова. Практические работы по органической химии, ГХТИ, 22 (1932). — [5] Синт. орг. преп., ГХТИ, 2, 203 (1932).

Поступило в Редакцию
5 мая 1966 г.
ЖОрХ, т. 3, в. 5

Харьковский
фармацевтический институт
