

# ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ ЖУРНАЛ

---

6

---

ВИДАВНИЦТВО  
„ЗДОРОВ'Я“

1968

## 4-АНТИПІРИЛАМІДИ АРИЛЬСУЛЬФОНІЛОКСАМІНОВИХ КИСЛОТ

В. П. ЧЕРНИХ, О. Д. АВДОНІН  
Харківський фармацевтичний інститут

Як відомо, найбільш цінною терапевтичною дією відзначаються сульфаніламідні з гетероциклічними радикалами при сульфамідному азоті (норсульфазол, сульфадимезин, етазол, кінекс та ін.) (1, 2, 6).

Продовжуючи вишукувати біологічно активні сполуки в ряду заміщених амідів арилсульфонілоксамінових кислот (4, 5), ми здійснили їх синтез з 4-антипірильним радикалом при сульфамідному азоті згідно із схемою.

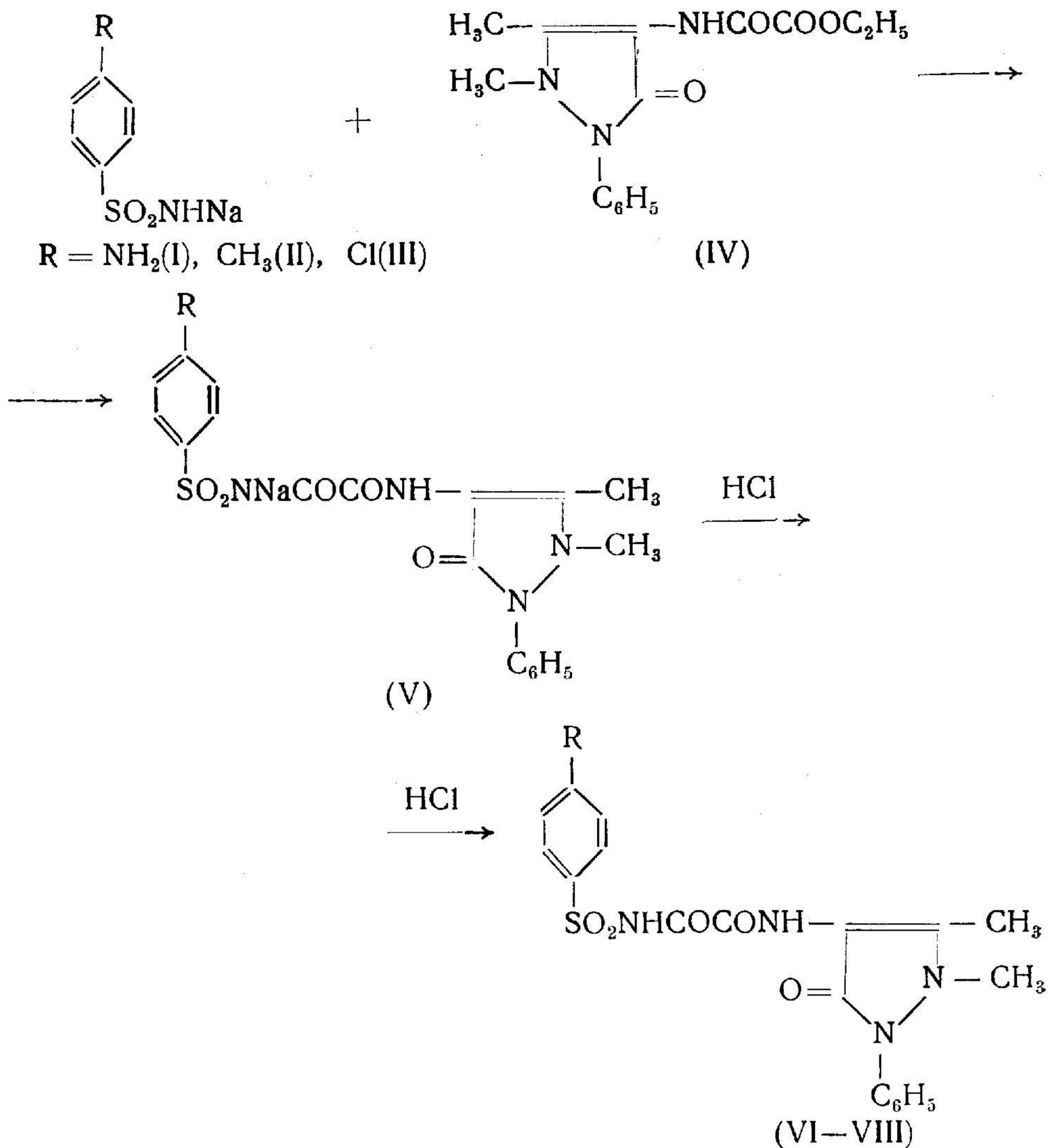
Вихідний етиловий ефір 4-антипірилоксамінової кислоти (IV) одержано з виходом 91% при взаємодії 4-аміноантипірину з хлорангідридом моноетилоксалату в хлороформовому середовищі у присутності тріетиламіну (3).

Реакцію між сульфамідами (I—III) й ефіром (IV) проводили в розчині абсолютного метанолу у присутності метилату натрію. Утворилося натрієве похідне (V), яке розкладалося розведеною хлористоводневою кислотою. 4-Антипіриламідні арилсульфонілоксамінових кислот одержували з виходом до 60% (див. табл.).

4-Антипіриламідні арилсульфонілоксамінових кислот

№ сполуки	R	Вихід (у %)	Форма кристалів (розчинник для кристалізації)	Т. топл. в градусах	Емпірична формула	Елементарний аналіз (у %)	
						знайдено N	вираховано N
VI	NH <sub>2</sub>	58	Багатогранники (анізол)	125 (розкл.)	C <sub>19</sub> H <sub>19</sub> N <sub>5</sub> O <sub>5</sub> S	16,32	16,30
VII	CH <sub>3</sub>	58	Пластинки (водний етанол)	129—131	C <sub>20</sub> H <sub>20</sub> N <sub>4</sub> O <sub>5</sub> S	13,35	13,08
VIII	Cl	60	Пластинки (водний етанол)	137—139 (розкл.)	C <sub>19</sub> H <sub>17</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>5</sub> S	12,58	12,48

Одержані сполуки являють собою безбарвні кристалічні речовини, розчинні у звичайних органічних розчинниках, водних розчинах лугів і карбонату натрію; амід (VI) розчиняється у водних мінеральних кислотах, діазотується і з лужними розчинами β-нафтолу дає відповідний барвник.



### ЕКСПЕРИМЕНТАЛЬНА ЧАСТИНА

**4-Антипіриламід *n*-амінобензолсульфонілоксамінової кислоти (VI).**  
 У розчині метилату натрію, одержаного з 0,23 г (0,01 г-ат) натрію і 25 мл безводного метанолу, послідовно розчиняли 1,72 г (0,01 г-мол) речовини I, 3,64 г (0,012 г-мол) речовини IV і кілька кристаликів фенолфталеїну. Далі розчин нагрівали на водяному огрівнику до знебарвлення малинового кольору. Більшу частину метанолу відганяли, залишок розчиняли в п'ятиразовій кількості води, фільтрували й підкислювали хлористоводневою кислотою (1:1) до кислої реакції на лакмус (рН 4—5).

Осад, що випав, відфільтровували, промивали водою і сушили на повітрі. Вихід 2,49 г.

Аналогічно одержували сульфаміди VII і VIII.

### В И С Н О В К И

В результаті конденсації арилсульфамідів з етиловим ефіром 4-антипірилоксамінової кислоти одержано три не описаних в літературі 4-антипіриламиди арилсульфонілоксамінових кислот, які являють інтерес у біологічному відношенні.

## ЛІТЕРАТУРА

1. Дайсон Г., Мей П., Химия синтетических лекарственных веществ, изд. «Мир», М., 1964, 477.—2. Засосов В. А. Журн. ВХО им. Д. И. Менделеева, 1965, 10, № 6, 671.—3. Петюнин П. А., Калугина З. Г., ЖОХ, 1963, № 33, 2835.—4. Петюнин П. А., Черных В. П., ЖОрХ, 1966, 2, 285.—5. Петюнин П. А., Черных В. П., Валяшко Н. Н., Сб. ЖОХ «Биол. акт. соедин.», 1965, 158.—6. Рабинович И. М., Журн. ВХО им. Д. И. Менделеева, 1965, 10, № 6, 689.

Надійшла 19.X 1966 р.

### 4-АНТИПИРИЛАМИДЫ АРИЛСУЛЬФОНИЛОКСАМИНОВЫХ КИСЛОТ

*В. П. ЧЕРНЫХ, А. Д. АВДОНИН*  
*Харьковский фармацевтический институт*

#### РЕЗЮМЕ

С целью поисков физиологически активных соединений синтезированы 4-антипириламиды арилсульфониллоксаминовых кислот. Последние получают с хорошими выходами в результате конденсации натриевых солей арилсульфамидов с этиловым эфиром 4-антипирилоксаминовой кислоты в безводном метаноле.

### 4-ANTIPYRILAMIDES OF ARYLSULFONYLOXAMINIC ACIDS

*V. P. CHERNYKH and A. D. AVDONIN*  
*Kharkov Pharmaceutical Institute*

#### SUMMARY

Searching physiologically active compounds, 4-antipyrilamides of arylsulfonyloxaminic acids have been synthesized. Their output is efficient as a result of condensation of sodium salts of arylsulfamides with ethyl ether of 4-antipyriloxaminic acid in anhydrous methanol.