

ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ ЖУРНАЛ

3

(Окремий відбиток)

ВИДАВНИЦТВО

«ЗДОРОВ'Я»

1978

КОРОТКІ ПОВІДОМЛЕННЯ

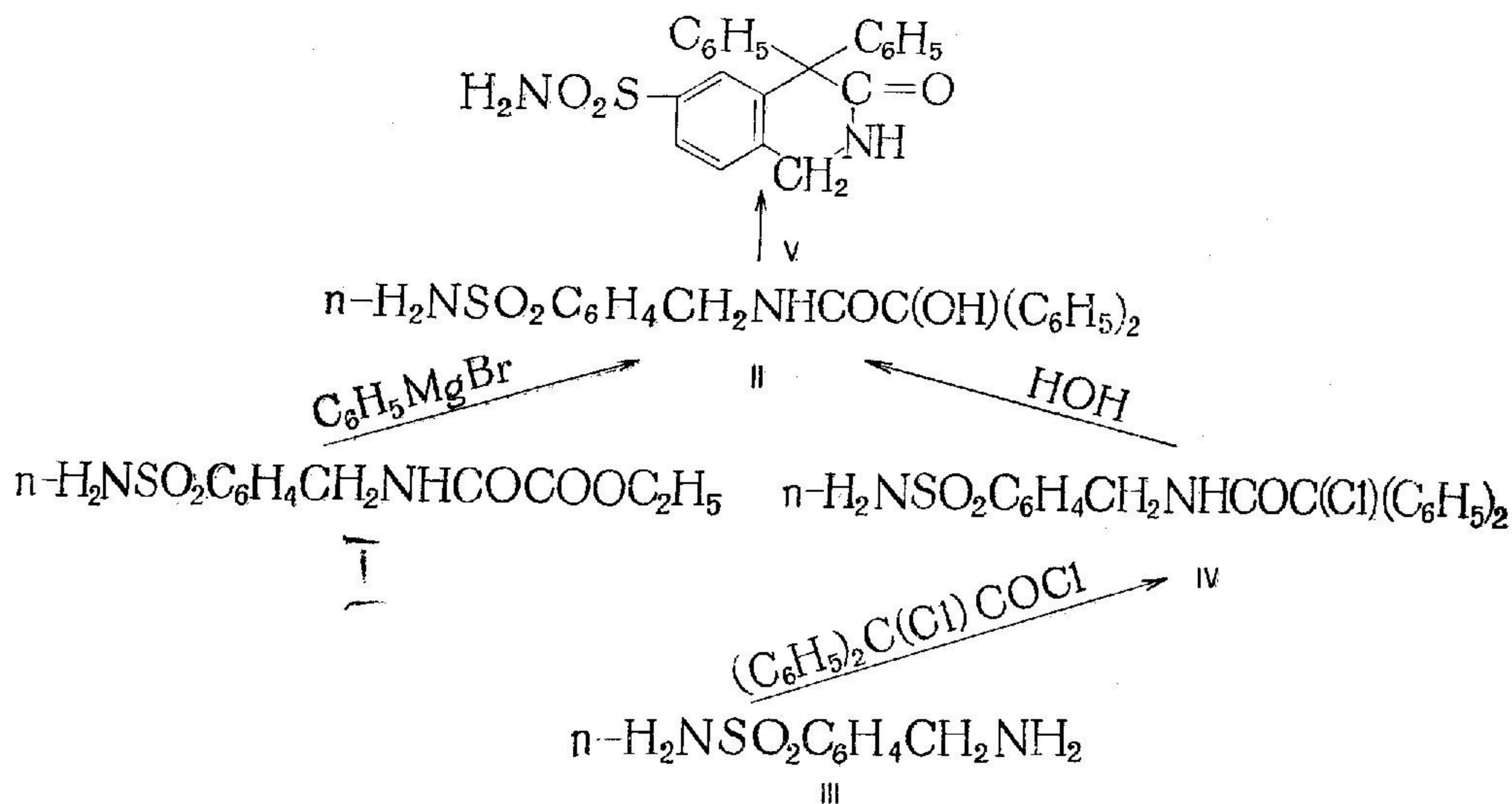
УДК 547.833:542.95

СИНТЕЗ 4,4-ДИФЕНІЛ-3-ОКСО-6-СУЛЬФАМІЛ-1, 2, 3, 4-ТЕТРАГІДРОІЗОХІНОЛІНУ

В. П. ЧЕРНИХ

Харківський фармацевтичний інститут

Встановлено, що *p*-етоксаліламінометилбензолсульфамід (I) при дії бромистого фенолмагнію утворює *n*-сульфамілбензиламід бензилової кислоти (II). Останній був також одержаний за реакцією взаємодії марфанілу (III) з хлорангідридом дифенілхлороцтової кислоти та омиленням *n*-сульфамілбензиламіду дифенілхлороцтової кислоти (IV), що утворився. При дії концентрованої сірчаної кислоти сполука II циклізується в 4,4-дифеніл-3-оксо-6-сульфаміл-1, 2, 3, 4-тетрагідроізохінолін (V).



Сполуки II і V в дослідах на мишах і щурах були досліджені на діуретичну активність, в результаті чого встановлено, що вони підсилюють сечовиділення на 200% у порівнянні з контролем і за активністю приблизно в два рази уступають гіпотіазиду і діакарбу (2).

Експериментальна частина

n-Сульфамілбензиламід бензилової кислоти (II). а) 0,03 мол бромистого фенолмагнію в 100 мл ефіру нагрівають 30 хв. з 0,01 мол ефіру (I) (1), потім охолоджують і магнійорганічний комплекс розкладають 0,5% розчином соляної кислоти. Вихід 75%, т. топл. 192—193°C (з діоксану).

Знайдено в %: N 7,3. C₂₁H₂₀N₂O₄S.

Вираховано в %: N 7,1.

б) До 0,01 мол сульфаміду (III) в 10 мл льодяної оцтової кислоти додають 0,01 мол тріетиламіну і 0,01 мол хлорангідриду дифенілхлороцтової кислоти. Розчин нагрівають, додають 2 краплі 10% розчину їдкого натрію, через 5 хв. охолоджують і виділяють амід (II). Вихід 91%, т. топл. 192—193°C (з діоксану). Проба змішування речовин, одержаних за вищенаведеним способом, розтопилась без депресії. В ІЧ спектрі сполуки II спостерігається смуга вбирання ОН групи (3450 см⁻¹).

4,4-Дифеніл-3-оксо-6-сульфаміл-1, 2, 3, 4-тетрагідроізохіноліну (V).
0,01 мол амідy II в 10 мл льодяної оцтової кислоти обробляють 25 мл концентрованої сірчаної кислоти і залишають при 25° на 30 хв. Виливають в 100 мл води з льодом, фільтрують, сушать. Вихід 87%, т. топл. 266—268° С (з етанолу).

Знайдено в %: N 7,5. $C_{21}H_{18}N_2O_3S$.

Вираховано в %: N 7,4.

ВИСНОВОК

Встановлено, що при дії концентрованої сірчаної кислоти на п-сульфамілбензиламід бензилової кислоти утворюється 4,4-дифеніл-3-оксо-6-сульфаміл-1, 2, 3, 4-тетрагідроізохіноліну.

ЛІТЕРАТУРА

1. Дроговоз С. М., Черных В. П., Фармакологія и токсикологія, 1976, № 6, 706—708. — 2. Петюнин П. А., Черных В. П., Штучная В. П. и др., ХФЖ, 1973, т. 7, № 4, 31—32.

Надійшло 28.XII 1977 р.