

ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ ЖУРНАЛ

4

(Окремий відбиток)

**ВИДАВНИЦТВО
«ЗДОРОВ'Я»**

1979

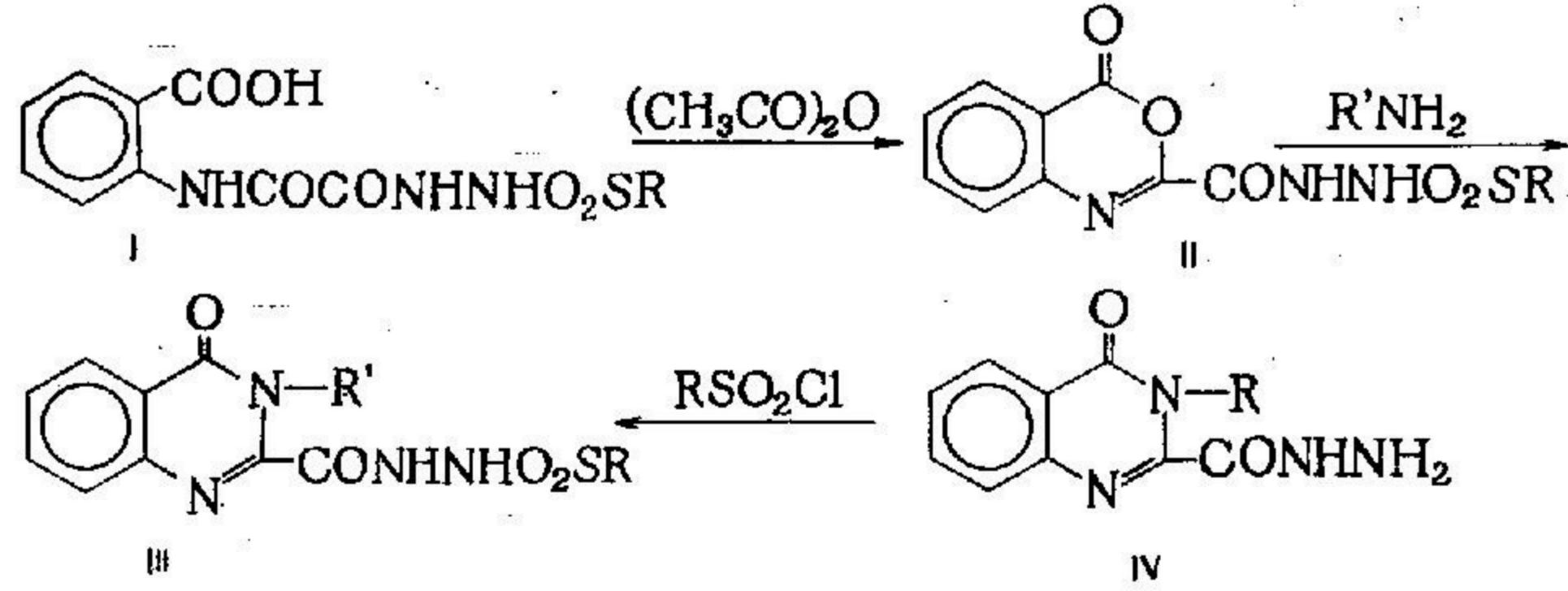
КОРОТКІ ПОВІДОМЛЕННЯ

УДК 615.254.2.012

СИНТЕЗ АРЕНСУЛЬФОГІДРАЗИДІВ 3-R-ХІАЗОЛОН-4-КАРБОНОВОЇ-2-КИСЛОТИ

П. О. БЕЗУГЛИЙ, В. П. ЧЕРНИХ
Харківський фармацевтичний інститут

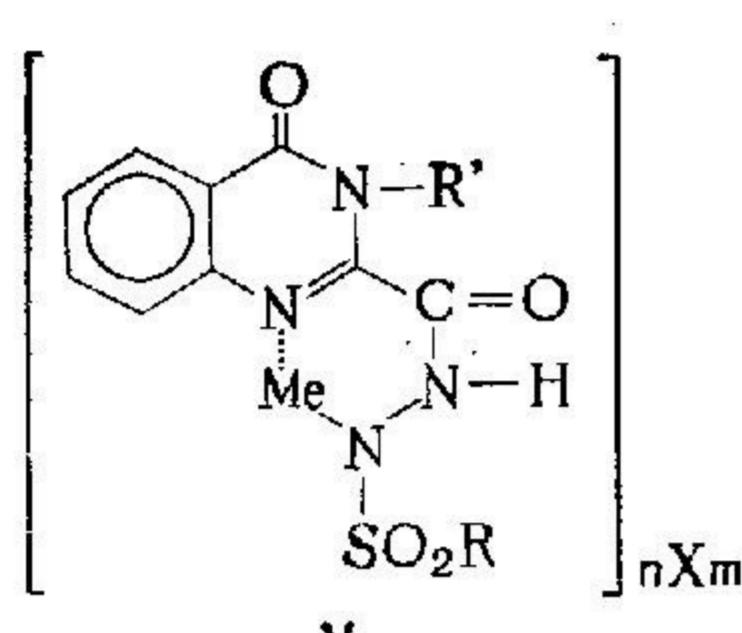
Нами встановлено, що аренсульфогідразиди *o*-карбоксіоксанілової кислоти (I) при нагріванні в середовищі оцтового ангідриду перетворюються в аренсульфогідразиди бензоксазин-1,3-он-4-карбонової-2-кислоти (II), які здатні з первинними ароматичними амінами утворювати аренсульфогідразиди 3-R-хіазолон-4-карбонової-2-кислоти (III).



I—IIIa R=C₆H₅; I—IIIb R=n-CH₃C₆H₄; III, IV R'=n-C₂H₅OC₆H₄

Утворення хіназолонів III підтверджено зустрічним синтезом за реакцією ацилування сульфохлоридами гідразиду 3-R-заміщених хіназолон-4-карбонової-2-кислоти і порівнянням їх спектрів. В ІЧ спектрах хіназолонів III знайдено смуги 1680—1690, 1610—1620, 1485—1490 (хіназолоновий цикл), 1710—1718 (ν_{CO}), 1360—1380 ($\nu_{SO_2}^{as}$), 1165—1175 cm^{-1} ($\nu_{SO_2}^s$) (1).

Натрієві солі хіназолонів III з катіонами багатьох металів утворюють кристалічні осади (V).



Константи іонізації для сполук III в 60% водному діоксані при 25° С лежать в межах 8,8—9,7 од. рКа.

Аренсульфогідразиди 3-R-хіазолон-4-карбонової-2-кислоти проявляють гіпоглікемічну активність.

Експериментальна частина

Аренсульфогідразиди бензоксазин-1,3-он-4-карбонової-2-кислоти (II).

$\text{SO}_2\text{R} \quad]_{\text{pH}_m}$ 0,01 мол сульфогідрозиду I кип'ятять 3 години в 10 мл оцтового ангідриду, охолоджують і виливають у 50 мл сухого толуолу. Осад відфільтровують, промивають ефіром і кристалізують з толуолу. Вихід IIa 57%, т. топл. 219—220° С; IIb 69%, т. топл. 223—224° С.

0,01 мол бензоксазинону II нагрівають на протязі 30 хв. з 0,01 мол *n*-фенетидину у 3 мл ДМФА. Охолоджують і розводять 50 мл води. Осад відфільтровують і кристалізують. Вихід IIIа 93%, т. топл. 226—227°C (з водного етанолу); IIIб 87%, топл. 237—238°C (з ДМФА).

Результати елементного аналізу одержаних сполук відповідають виражуваним.

Висновок

Синтезовано аренсульфогідразиди 3-R-хіназолон-4-карбонової-2-кислоти, для яких встановлена гіпоглікемічна активність.

ЛІТЕРАТУРА

1. Петюнін П. А., Черних В. П., Петюнін Г. П., Кожевников Ю. В.,
ХГС, 1970, № 11, 1575—1578.

Надійшло 24.04.1979 р.