

А. Л. Миджоян, В. Г. Африкян и Г. Л. Папаян

Исследования в области аминов и их производных

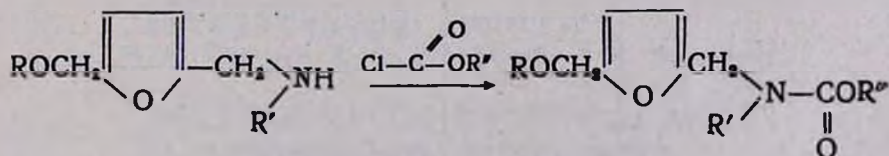
Сообщение VI. Метилловые эфиры алкил-5-алкоксиметилфурфурил-2-карбаминовых кислот

Известно, что этиловый эфир карбаминовой кислоты—уретан является наркотическим средством. Однако за последние годы в литературе встречаются указания на то, что уретан обладает и канцеролитическим свойством. Алкилированные уретаны и некоторые другие производные карбаминовой кислоты, по сравнению с этилуретаном, оказались менее активными [1]. Представляют интерес данные о способности этилуретана задерживать клеточное деление [2, 3], в связи с чем были предприняты попытки использования его против злокачественных опухолей [4,5].

Широкому исследованию подвергнуты, кроме полициклических углеводов, их производных, различного строения уретанов и незначительное число соединений ряда фурана, как производные 5-нитрофурана, 5-метилфуран-2-карбоновой кислоты, фурфурола, фурфуриламина, фурфурилового спарта и пр. [6].

В связи с этим и в продолжение начатых исследований по синтезу алкил-5-алкоксиметилфурфурил-2-аминов [7] представлялось интересным получение замещенных уретанов для испытания канцеролитических, антимиотических свойств.

Уретаны синтезированы взаимодействием указанных выше вторичных аминов с эфирами хлоругольной кислоты по схеме:

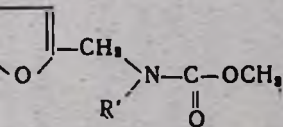


Реакция проводилась с применением эквимолекулярного количества концентрированной щелочи. Уретаны получались с выходами 80—90% теории. В приводимой ниже таблице приведены некоторые физико-химические константы синтезированных соединений.

Уретаны представляют собой соломенно-желтого цвета жидкости, растворимые в органических растворителях и нерастворимые в воде; при стоянии темнеют.

ROCH_2-

R	R'	Выход в %	Температура кипения в °C
CH_3	CH_3	93.0	119—121
CH_3	C_2H_5	82.6	127—129
C_2H_5	CH_3	95.7	126—128
C_2H_5	C_2H_5	87.1	134—136
C_3H_7	CH_3	83.6	135—137
C_3H_7	C_2H_5	92.2	144—146
$\text{н-ЗО-C}_3\text{H}_7$	CH_3	85.1	130—132
$\text{н-ЗО-C}_3\text{H}_7$	C_2H_5	80.5	138—140
C_4H_9	CH_3	80.7	146—148
C_4H_9	C_2H_5	81.0	157—158
$\text{н-ЗО-C}_4\text{H}_9$	CH_3	84.4	143—144
$\text{н-ЗО-C}_4\text{H}_9$	C_2H_5	88.5	151—153



Давление в мм	n_D^{20}	d_4^{20}	MR _D		Анализ в %					
					C		H		N	
			вычис- лено	найдено	вычис- лено	найдено	вычис- лено	найдено	вычис- лено	найдено
з	1,1403	1,4860	54,12	53,68	56,33	56,60	7,09	6,88	6,55	6,40
з	1,1132	1,4815	58,40	58,14	58,15	58,17	7,47	7,66	6,16	6,31
з	1,1073	1,4825	58,74	58,55	58,15	58,31	7,48	7,22	6,16	6,45
з	1,0880	1,4780	63,02	62,77	59,75	59,70	7,88	7,96	5,80	5,69
з	1,0947	1,4810	63,36	62,71	59,75	59,58	7,88	7,50	5,80	5,59
з	1,0710	1,4760	67,98	67,47	61,17	61,03	8,23	8,50	5,49	5,50
з	1,0941	1,4780	63,36	62,41	59,77	59,58	7,88	7,47	5,80	5,59
з	1,0661	1,4770	67,98	67,65	61,17	60,95	8,23	8,00	5,49	5,68
з	1,0777	1,4800	67,98	67,29	61,17	60,85	8,23	8,02	5,48	5,19
з	1,0635	1,4770	72,26	72,65	62,45	62,15	8,55	8,67	5,20	5,45
з	1,0774	1,4752	67,98	67,45	61,17	61,25	8,23	8,30	5,48	5,27
з	1,0605	1,4775	72,59	71,83	62,45	62,55	8,55	8,39	5,20	5,29

В экспериментальной части описан синтез метилового эфира метил-5-метоксиметилфурфурил-2-карбаминовой кислоты, по примеру которого получены остальные.

Элементарный анализ полученных соединений произведен сотрудниками аналитического отдела С. Н. Тонакян и Л. С. Аракелян.

Данные исследований канцеролитических свойств будут опубликованы отдельно.

Экспериментальная часть

Метиловый эфир метил-5-метоксиметилфурфурил-2-карбаминовой кислоты. В круглодонную четырехгорлую колбу, снабженную мешалкой, двумя капельными воронками (для хлоругольного эфира и щелочи) и обратным холодильником, помещают 10 г (0,064 моля) метил-5-метоксиметилфурфурил-2-амин в 70 мл абсолютного бензола. При охлаждении колбы водой и перемешивании одновременно прикапывают 6,1 г (0,064 моля) метилового эфира хлоругольной кислоты в 10 мл абсолютного бензола и 2,85 г (0,071 моля) едкого натра в 5 мл воды. По окончании прибавления перемешивание продолжают в течение 15 минут, приливают 20—25 мл воды, отделяют бензольный слой, водный 2 раза экстрагируют эфиром и соединенные эфирные экстракты высушивают над прокаленным сульфатом натрия. Отогнав растворитель, остаток перегоняют в вакууме, собирая фракцию, кипящую при 119—121°/3 мм. Выход 12,7 г или 93%, теория.

В ы в о д

Синтезировано для испытания канцеролитических и антимиотических свойств 12 метиловых эфиров алкил-5-алкоксиметилфурфурил-2-карбаминовых кислот, не описанных в литературе.

Институт тонкой органической химии

АН АрмССР

Поступило 25 VI 1958

Ս. Լ. ՄՅԵՂՅԱՆ, Վ. Գ. ԱՇԻՔՅԱՆ, Հ. Լ. ՊԱՊԱՅԱՆ

ՀԵՏԱԶՈՏՈՒԹՅՈՒՆՆԵՐ ԱՄԻՆՆԵՐԻ ԵՎ ՆՐԱՆՑ ԱԾԱՆՑՅԱԼՆԵՐԻ ԲՆԱԳԱՎԱՌՈՒՄ

Հաղորդում VI. Ալկիլ-5-ալկոքսիմեթիլֆուրֆուրիլ-2-կարբամիլցարբուցների մեթիլէթերները

Ա Մ Փ Ո Փ Ո Ւ Մ

Վաղուց հայտնի է, որ կարբամիլնաթթվի էթիլ-էսթերը (ուրեթանը) նաբ-կատիկ միջոց է:

Վերջին տարիների գրականության մեջ հաճախ ենք հանդիպում հաղոր-դումների այն մասին, որ ուրեթանը ցուցաբերում է նաև կանցերոլիտիկ հատ-

կություն: Առանձնապես հետաքրքրություն է ներկայացնում բջիջների բաժանումը կանխելու նրա ունակությունը, որի կապակցությամբ փորձեր են արվել այն օգտագործել չարորակ ուռուցքների բուժման գործում:

Ուրեթանները և նրանց ածանցյալները միայն մի փոքր մասն են այն բազմաթիվ միացությունների, որոնք մինչև օրս ստացվել և ուսումնասիրվել են իրրև կանցերոլիտիկ և հակամիտոտիկ նյութեր: Այդ միացությունների մեջ ֆուրանի ածանցյալները շատ համեստ տեղ են գրավում. ուսումնասիրված են ֆուրֆուրոլի, նիտրոֆուրֆուրոլի և ֆուրանկարբոնաթթվի մի քանի ածանցյալները, որոնք, ի հարկ է, չեն կարող հիմք հանդիսանալ այդ հետաքրքիր խմբի դերը այս բնագավառում բնորոշելու համար:

Այս պատճառով էլ հետաքրքիր էր շարունակել մեր աշխատանքները ֆուրանի շարքի բարդ ամիներին հետ և ստանալ ուրեթաններ և մի շարք այլ միացություններ, որոնց ուսումնասիրությունները կարող են հնարավորություն տալ ճշտելու և լրացնելու ֆուրանի ածանցյալների՝ իրրև կոնցերոլիտիկ նյութերի մասին եղած կարծիքը:

Այդ կապակցությամբ սինթեզել ենք գրականության մեջ չնկարագրված 12 ուրեթաններ, որոնց ֆիզիկաքիմիական հատկությունները բնորոշող տրվալները բերված են աղյուսակում:

ЛИТЕРАТУРА

1. Л. А. Грещома, Вопросы онкологии, II, № 6 (1956).
2. I. W. Green, C. C. Kuschlaugh, Cancer Research, № 4, 9, 199 (1949).
3. A. Haddow, W. Sexton, Nature 157, 500 (1946).
4. W. J. Harrington, W. C. Maloney, Cancer N. V. 3, 253 (1950) [Cancer Research 16, 32 (1956)].
5. R. M. Engstrom, A. Kirschbaum, U. W. Mixer, Science 105, 255 (1947) [C. A. 41 3216b (1947)].
6. B. John, Friedl, A. Boryczka, F. Costa, Cancer Research, suppl., № 2, 30 (1955).
7. А. Л. Мянжоян, В. Г. Африкян, Г. Л. Папаян, Изв. АН АрмССР, ХН 11, 281 (1958)