

КРАТКИЕ СООБЩЕНИЯ

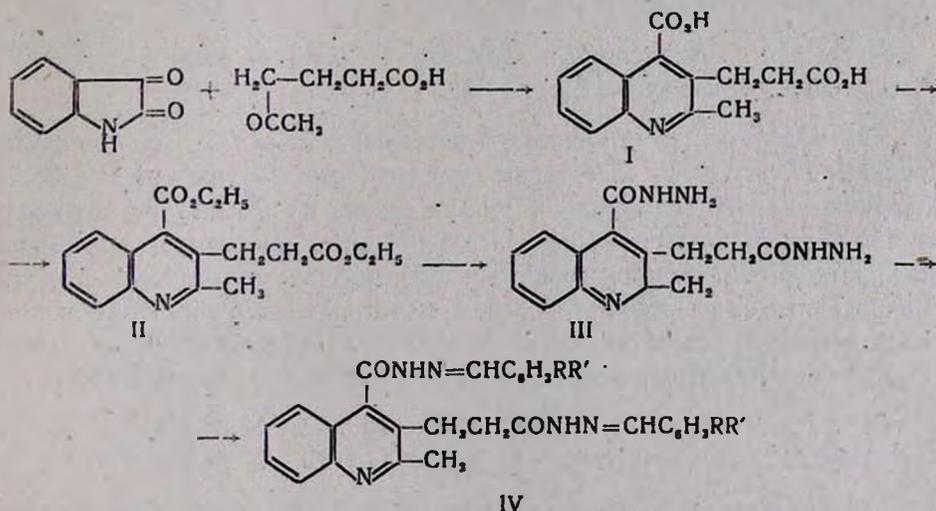
Г. Т. Татевосян, А. Г. Терзян, С. П. Экмекджян

Замещенные гидразиды

$\beta$ -(2-метил-4-карбоксихинолил-3)-пропионовой кислоты

Обнаружение высокой антитуберкулезной активности гидразида изоникотиновой кислоты и его арилметиленовых производных явилось стимулом к широкому химическому и фармакологическому изучению гидразидов карбоновых кислот жирного, ароматического и гетероциклического рядов. Значительно меньше изучались гидразиды дикарбоновых кислот, которые также могут оказаться носителями ценных биологических свойств; по литературным данным, гидразиды некоторых дикарбоновых кислот проявляют антитуберкулезные свойства [1], а также являются антагонистами биотина [2] и стимуляторами роста растений [3].

С целью последующего биологического изучения нами получены дигидразид  $\beta$ -(2-метил-4-карбоксихинолил-3)-пропионовой кислоты (III) и его некоторые замещенные бис-бензилиденные производные (IV):



Экспериментальная часть

$\beta$ -(2-Метил-4-карбоксихинолил-3)-пропионовая кислота (I). Смесь 8,3 г изатина, 8,5 г  $\gamma$ -ацетилмасляной кислоты и 45 мл 33%-ного раствора едкого натра нагревалась на кипящей водяной бане трое суток. По охлаждении содержимое колбы застыло в кристаллическую

массу. Смесь разбавлена водой до полного растворения осадка красного цвета, раствор отфильтрован и продукт осажден из фильтрата уксусной кислотой. Осадок отфильтрован, промыт разбавленной уксусной кислотой и спиртом. Получено 8 г (62,5%) высушенного на воздухе желтоватого сырого продукта, очень мало растворимого в спирте, ацетоне и бензоле, а с водой образующего коллоидный раствор. После перекристаллизации из большого количества спирта светло-кремовые кристаллы плавилась при 280° (разложение).

Найдено %: С 64,44; Н 5,00; N 5,33

$C_{14}H_{13}O_4N$ . Вычислено %: С 64,86; Н 5,35; N 5,40.

*Диэтиловый эфир β-(2-метил-4-карбоксихинолил-3)-пропионо-вой кислоты (II)*. При пропускании сухого хлористого водорода через смесь 24 г дикарбоновой кислоты (I) и 80 мл абсолютного спирта смесь разогрелась, окрасилась в темный цвет и все количество кислоты перешло в раствор. Смесь кипятилась 6 часов, причем через нее все время пропускался медленный ток хлористого водорода. Охлажденный темно-красный раствор слит в холодную воду. После подщелочения водного раствора содой выделился вязкий маслообразный продукт, который с помощью эфира отделен от водного слоя, и последний еще два раза экстрагирован эфиром. Соединенные эфирные растворы промыты водой и высушены серноокислым натрием. После отгонки эфира осталось 15 г сырого продукта в виде вязкого масла красного цвета. Перегонкой в вакууме получено светло-розовое масло с т. кип. 150—155° при 2 мм;  $d_4^{20}$  1,1423;  $n_D^{20}$  1,5528.

Найдено %: С 68,53; Н 6,73; N 4,68

$C_{18}H_{21}O_4N$ . Вычислено %: С 68,57; Н 6,67; N 4,44.

*Дигидразид β-(2-метил-4-карбоксихинолил-3)-пропионо-вой кислоты (III)*. Смесь 45 г сырого неперегнанного диэфира (II), 35 г 85%-ного гидрата гидразина и 90 мл спирта кипятилась на водяной бане 3 часа. Вскоре после начала кипячения из прозрачного раствора стало выделяться твердое вещество, образовавшее объемистый осадок. Охлажденная смесь отфильтрована, и фильтр промыт небольшим количеством спирта. После перекристаллизации из спирта получено 35,9 г (87,5%) бесцветного кристаллического вещества с т. пл. 203—204°.

Найдено %: С 58,60; Н 5,82; N 24,55

$C_{14}H_{17}O_2N_5$ . Вычислено %: С 58,53; Н 5,92; N 24,39.

*Замещенные бис-(бензилиденгидразиды) β-(2-метил-4-карбоксихинолил-3)-пропионо-вой кислоты (IV)*. Смесь 3 г (0,01 моля) дигидразида (III), 0,02 моля свежеперегнанного или перекристаллизованного ароматического альдегида, 25 мл спирта и 10 мл воды кипятилась 3 часа, после чего оставлялась на ночь. Образовавшийся осадок отфильтровывался и промывался на фильтре небольшим количеством

спирта. После перекристаллизации из большого количества спирта замещенные бис-(бензилиденгидразиды) (IV) получались в виде бесцветных или светло-кремовых кристаллических веществ, выходы и свойства которых приведены в таблице.

Таблица

IV		Выход, %	Т. пл. в С	Анализ в %					
R	R'			найдено			вычислено		
				С	Н	Н	С	Н	Н
H	H	78,5	217—18	72,70	5,53	15,15	72,57	5,40	15,12
H	<i>o</i> -ОН	77,3	221—22	67,83	5,12	15,48	67,87	5,05	15,12
<i>p</i> -ОН	<i>m</i> -СН <sub>3</sub> О	67,7	243—44	64,97	5,25	12,89	64,86	5,23	12,63
H	<i>o</i> -СН <sub>2</sub> СО <sub>2</sub> H	93,7	237—38	63,20	5,10	11,29	62,85	4,75	11,45

Институт тонкой органической химии  
АН АрмССР

Поступило 14 XI 1963