

КРАТКИЕ СООБЩЕНИЯ

УДК 542.91+547.435+547.466

АМИНОКИСЛОТЫ И ПЕПТИДЫ

VII. СИНТЕЗ НЕКОТОРЫХ ПРОИЗВОДНЫХ N-АЦЕТИЛСАРКОЛИЗИНА

Ц. Е. АГАДЖАНЯН и А. Д. АРУТЮНЯН

Институт тонкой органической химии им. А. Л. Минджояна
АН Армянской ССР, Ереван

Поступило 31 VII 1973

С целью изучения противоопухолевых свойств методом смешанных ангидридов (метилхлоркарбонат) синтезированы: амиды N-ацетилсарколизина, содержащие остатки стрептоцида, уросульфана, сульфадимезина, тубазида, новокаина; дипептиды N-ацетилсарколизина с эфирами N-алкиламиноокислот и аминокислот [1]; диалкиламиноалкиловые эфиры N-ацетилсарколизина.

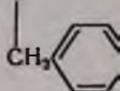
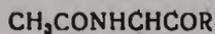
Строение полученных веществ подтверждено данными ИК спектров (ν CO 1730—1740 см^{-1}). Чистота их установлена ТСХ.

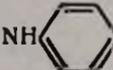
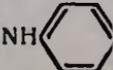
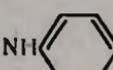
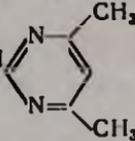
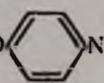
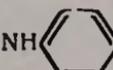
Экспериментальная часть

Получение амидов, пептидов и эфиров N-ацетилсарколизина. К 5—7% раствору смеси N-ацетилсарколизина и триэтиламина (1:1, в опытах с новокаином и гидрогалогенидами эфиров N-алкиламиноокислот и 1:2 в опытах с аминокислотами в диметилформамиде при перемешивании и охлаждении (0—2°) в течение 10 мин. прибавлялись эквимольные количества растворов метилхлоркарбоната и через 30 мин. второго компонента в диметилформамиде (конечная концентрация 5—7%). Смесь оставлялась 2 часа при указанной температуре и до утра при комнатной. Осадок фильтровался, большая часть растворителя удалялась из фильтра в вакууме. К остатку добавлялась вода, осадок фильтровался, промывался 10% раствором соды, водой и сушился в вакууме над P_2O_5 . Выходы, элементные анализы и физико-химические константы приведены в таблице.

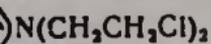
ЛИТЕРАТУРА

1. M. Frankel, G. Zullchovsky, I. Knoble; J. Chem. Soc., 1964, 3931.



R	Выход, %	Т. пл., °C	R _f [*]	C
				5
1	2	3	4	5
NH  SO ₂ NH ₂	52	113—114	0,73	—
NH  SO ₂ NHCONH ₂	40	132—134	0,24****	—
NH  SO ₂ NH 	50	117—119	0,44****	—
NHNHCO 	54	170—172	0,74	—
NH  COOCH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	70	105—107	0,41****	—

Таблица



А н а л и з, %								
най д е н о				в ы ч и с л е н о				
Н	Н	С	Сl	С	Н	Н	С	Сl
6	7	8	9	10	11	12	13	14
—	—	6,50	14,50	—	—	—	6,38	14,17
—	—	5,47	13,30	—	—	—	5,88	13,05
—	13,30	4,80	11,50	—	—	13,83	5,23	11,60
—	—	—	14,90	—	—	—	—	15,02
—	9,48	—	11,90	—	—	9,91	—	12,50

1	2	3	4	5
$N(CH_3)CH_2COOC_2H_5$	70	85—86	0,52****	53,10
$N(C_6H_5)CH_2COOC_2H_5$	75	103—105	0,54**	—
$NHOCH(C_2H_5)COOCH_3$	70	102—103	0,38****	49,79
$NHOCH_2COOC_2H_5$	60	68—69***	—	50,69
$OCH_2CH_2N(CH_3)_2$	75	165—167	0,61	—
$OCH_2CH_2N(C_2H_5)_2$	55	132—134	0,33****	56,72
OCH_2CH_2N 	55	68—70	0,52	—
$OCH_2CH_2CH_2N$ 	63	91—92	0,45****	—

* Al_2O_3 , *n*-пропанол—вода, 7:3.

** Силикагель—гипс, *n*-пропанол—вода, 7:3.

*** При хранении вещество разлагается.

**** Al_2O_3 , абс. бензол—абс. этанол, 15:1.

Продолжение таблицы

6	7	8	9	10	11	12	13	14
6,20	10,30	—	—	53,80	6,50	9,41	—	—
—	8,30	—	13,60	—	—	8,24	—	13,97
6,00	9,77	—	—	49,34	6,29	9,09	—	—
6,50	8,66	—	—	51,01	5,81	9,40	—	—
—	10,24	—	—	—	—	10,05	—	—
7,02	9,21	—	—	56,50	7,40	9,42	—	—
—	9,27	—	—	—	—	9,46	—	—
—	9,50	—	—	—	—	8,95	—	—