

СИНТЕЗ 4-АЛКОКСИБЕНЗОЛСУЛЬФОНИЛГИДРАЗОНОВ
 И АМИНОГУАНИДИНОВ

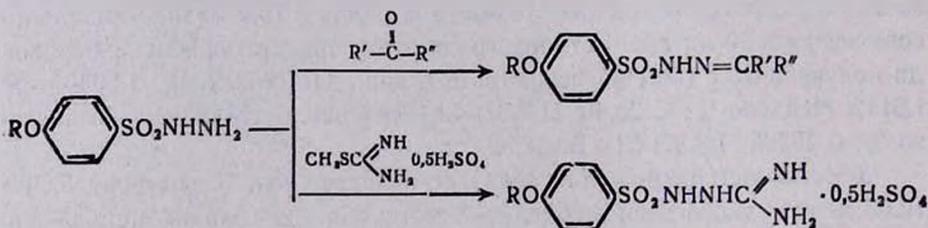
А. А. АРОЯН, А. С. АЗАРЯН и Ш. А. АВЕТЯН

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

Поступило 16 VII 1973

В продолжение исследований в области синтеза производных 4-алкоксибензолсульфонокислот для изучения их антибактериальных свойств [1—3] в данном сообщении описывается синтез 4-алкоксибензолсульфонилгидразонов (I) и 1-(4-алкоксибензолсульфонил)аминогуанидинов (II).

Синтез I осуществлен взаимодействием гидразидов 4-алкоксибензолсульфонокислот с алифатическими и ароматическими альдегидами и кетонами, а II—их взаимодействием с сульфатом S-метилизотиомочевины [4].



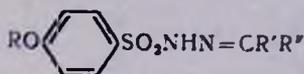
R=CH₃-C₄H₉; R'=H, CH₃; R''=CH₃, C₂H₅, Алк-OC₂H₄.

Экспериментальная часть

4-Алкоксибензолсульфонилгидразоны (I). Смесь 0,05 моля 4-алкоксибензолсульфонилгидразида и 0,05 моля соответствующего альдегида или кетона в 30 мл абс. метанола нагревалась на водяной бане 4—5 час. На следующий день растворитель отгонялся, оставшиеся кристаллы отсасывались, промывались 30—40 мл эфира и перекристаллизовывались из этанола (табл. 1).

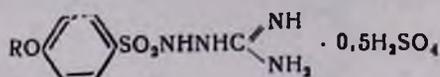
1-(4-Алкоксибензолсульфонил)аминогуанидинсульфаты (II). Смесь 0,01 моля 4-алкоксибензолсульфонилгидразида, 0,01 моля сульфата S-метилизотиомочевины, 20 мл диметилформамида и 20 мл воды кипятилась 6—8 час. После отгонки растворителя оставшаяся густая масса промывалась водой и перекристаллизовывалась из 50% этанола (табл. 2).

Таблица 1



R	R'	R''	Выход, %	Т. пл., °C	Анализ, %			
					N		S	
					най- дено	вычис- лено	най- дено	вычис- лено
CH ₃	H	C ₆ H ₄ OCH ₃	60,0	152—154	8,65	8,74	9,93	10,01
CH ₃	H	C ₆ H ₄ OC ₂ H ₅	56,9	149—151	8,02	8,37	9,41	9,59
CH ₃	H	C ₆ H ₄ OC ₃ H ₇	50,1	148—150	7,70	8,04	8,64	9,20
CH ₃	H	<i>изо</i> -C ₆ H ₄ OC ₃ H ₇	44,4	—	7,78	8,04	8,92	9,20
CH ₃	CH ₃	CH ₃	62,5	129—131	12,00	11,56	12,86	13,22
CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	70,1	146—148	10,56	10,92	12,35	12,50
CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₄ COH ₃	74,8	150—152	8,05	8,37	9,62	9,59
CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₄ OC ₂ H ₅	76,8	151—152	8,28	8,04	9,60	9,20
CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₄ OC ₃ H ₇	62,8	144—146	7,75	7,72	8,38	8,84
CH ₃	CH ₃	<i>изо</i> -C ₆ H ₄ OC ₃ H ₇	50,0	169—171	7,94	7,72	8,73	8,84
C ₂ H ₅	H	C ₆ H ₄ OC ₂ H ₅	81,2	162—163	8,11	8,04	8,97	9,20
C ₂ H ₅	H	C ₆ H ₄ OC ₃ H ₇	71,9	160—162	7,87	7,72	8,68	8,84
C ₂ H ₅	H	<i>изо</i> -C ₆ H ₄ OC ₃ H ₇	55,2	172—174	8,06	7,72	8,89	8,84
C ₂ H ₅	CH ₃	C ₆ H ₄ OCH ₃	80,2	146—149	7,93	8,04	9,27	9,20
C ₂ H ₅	CH ₃	C ₆ H ₄ OC ₂ H ₅	71,2	154—156	7,89	7,72	8,64	8,84
C ₂ H ₅	CH ₃	C ₆ H ₄ OC ₃ H ₇	67,1	174—176	7,25	7,44	8,60	8,50
C ₂ H ₅	CH ₃	C ₆ H ₄ OC ₄ H ₉	61,5	141—143	7,24	7,20	8,56	8,21
C ₂ H ₅	CH ₃	<i>изо</i> -C ₆ H ₄ OC ₄ H ₉	58,5	130—132	7,87	7,20	8,48	8,21
C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	82,0	180—182	11,10	10,92	12,81	12,50
C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	74,7	162—164	10,11	10,36	11,71	11,86
C ₃ H ₇	H	C ₆ H ₄ OCH ₃	70,9	136—138	8,36	8,04	8,87	9,20
C ₃ H ₇	H	C ₆ H ₄ OC ₂ H ₅	75,0	142—144	7,46	7,72	8,56	8,84
C ₃ H ₇	H	C ₆ H ₄ OC ₃ H ₇	65,5	146—148	6,98	7,44	9,01	8,50
C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	70,2	150—151	10,02	10,36	12,05	11,86
C ₃ H ₇	CH ₃	C ₂ H ₅	80,0	152—153	10,14	9,85	11,57	11,25
C ₃ H ₇	CH ₃	C ₆ H ₄ OCH ₃	61,7	155—156	8,19	7,72	8,42	8,84
C ₃ H ₇	CH ₃	C ₆ H ₄ OC ₂ H ₅	70,1	153—155	7,05	7,44	8,23	8,50
C ₃ H ₇	CH ₃	C ₆ H ₄ OC ₃ H ₇	60,5	151—153	6,93	7,20	8,02	8,21
C ₃ H ₇	CH ₃	<i>изо</i> -C ₆ H ₄ OC ₃ H ₇	61,5	153—154	7,56	7,20	8,62	8,21
C ₃ H ₇	CH ₃	C ₆ H ₄ OC ₄ H ₉	70,5	147—149	7,08	6,92	8,22	7,91
C ₃ H ₇	CH ₃	<i>изо</i> -C ₆ H ₄ OC ₄ H ₉	70,0	142—144	7,26	6,92	7,80	7,91
C ₄ H ₉	H	C ₆ H ₄ OCH ₃	66,6	132—134	8,10	7,72	8,71	8,84
C ₄ H ₉	H	C ₆ H ₄ OC ₂ H ₅	80,0	140—142	7,42	7,44	7,98	8,50
C ₄ H ₉	H	C ₆ H ₄ OC ₃ H ₇	77,0	135—137	7,45	7,20	8,31	8,21
C ₄ H ₉	H	<i>изо</i> -C ₆ H ₄ OC ₃ H ₇	71,7	110—112	6,76	7,20	8,09	8,21
C ₄ H ₉	CH ₃	C ₆ H ₄ OCH ₃	69,1	120—122	7,94	7,44	8,21	8,50
C ₄ H ₉	CH ₃	C ₆ H ₄ OC ₂ H ₅	76,9	138—140	6,83	7,20	8,53	8,21
C ₄ H ₉	CH ₃	C ₆ H ₄ OC ₃ H ₇	69,4	125—127	6,48	6,92	7,61	7,91
C ₄ H ₉	CH ₃	<i>изо</i> -C ₆ H ₄ OC ₃ H ₇	61,8	135—137	6,68	6,92	7,69	7,91
C ₄ H ₉	CH ₃	C ₆ H ₄ OC ₄ H ₉	71,3	136—138	6,39	6,69	7,71	7,66
C ₄ H ₉	CH ₃	<i>изо</i> -C ₆ H ₄ OC ₄ H ₉	76,5	114—116	7,04	6,69	7,86	7,66

Таблица 2



R	Выход, %	Т. пл., °С	Анализ, %			
			N		S	
			найде-но	вычис-лено	найде-но	вычис-лено
CH ₃	71,6	74—76	18,72	19,10	16,05	16,32
C ₂ H ₅	68,1	56—58	17,86	18,23	16,03	15,64
C ₃ H ₇	65,3	53—55	17,87	17,43	14,55	14,96
C ₄ H ₉	66,2	54—56	16,32	16,71	13,92	14,34

Л И Т Е Р А Т У Р А

1. А. Л. Мнджоян, А. С. Азарян, А. А. Ароян, Арм. хим. ж., 22, 488 (1969).
2. I. Augstein, S. M. Green, A. R. Katritzky, A. M. Monro, J. Med. Chem., 8, 395 (1965).
3. М. Н. Мухина, Лим. фарм. ж., 4, (4), 23 (1970).
4. А. А. Munshi, N. M. Shah, I. P. Trivedi, Ind. J. Chem. 1 (7) 311 (1969); [С. А., 59, 12684 (1963)].