

A. A. AVETISSIAN, A. V. GALSTIAN and G. S. MELIKIAN

The interaction of the title compounds with ethyl alcohol in the presence of hydrogen chloride leads to the formation of the corresponding imino-ester hydrochlorides. The latter form linear and cyclic amidines on interaction with amines.

## Л И Т Е Р А Т У Р А

1. А. А. Аветисян, Г. С. Меликян, А. В. Галстян, Арм. хим. ж., 36, 738 (1983).
2. А. А. Аветисян, Г. С. Меликян, Б. К. Каспарян, Арм. хим. ж., 36, 713 (1983).
3. R. Roger, D. G. Nellson. Chem. Rev., 61, 179 (1961).
4. А. А. Аветисян, Ц. А. Мангасарян, М. Т. Дангян, Г. С. Меликян, С. Г. Мацолян, ЖОрХ, 7, 964 (1971).
5. R. L. Shriner, F. W. Neumann, Chem. Rev., 35, 351 (1944).
6. N. W. Bristow, J. Chem. Soc., 1957, 513.

Армянский химический журнал, т. 37, № 8, стр. 490—493 (1984 г.)

УДК 547.589+547.76

ИССЛЕДОВАНИЕ РЕАКЦИИ  $\beta$ -АРОИЛАКРИЛОВЫХ  
КИСЛОТ С ТИОМОЧЕВИНОЙ

## IV. СИНТЕЗ СОЛЕЙ 5-АРОИЛМЕТИЛ-2-ИМИНОТИАЗОЛИДИНОВ-4

Р. ДЖ. ХАЧИКЯН, Э. В. САФАРЯН, Г. В. ГРИГОРЯН, С. Г. АГБАЛЯН  
и С. М. АТАШЯН

Институт органической химии АН Армянской ССР, Ереван

Поступило 15 XII 1982

Взаимодействием  $\beta$ -ароилакриловых кислот с тиомочевинной в присутствии соответствующих кислот получены гидрохлориды, гидробромиды и сульфаты 5-ароилметил-2-иминотиазолидинонов-4.

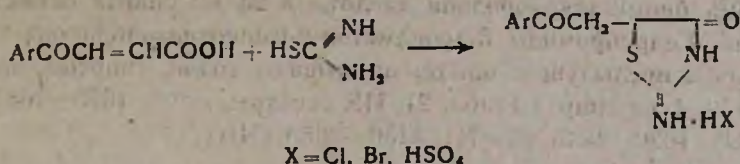
Табл. 3, библиограф. ссылок 4.

Известны способы получения гидрохлоридов 5-ароилметил-2-иминотиазолидинонов-4, заключающиеся во взаимодействии 5-ароилметил-2-иминотиазолидинонов-4 при комнатной температуре с избытком 20% соляной кислоты [1, 2].

На одном примере показано промежуточное образование гидрохлорида 5-бензоилметил-2-иминотиазолидинона-4 при взаимодействии  $\beta$ -бензоил- $\alpha$ -хлорпропионовой кислоты с тиомочевинной [2]. Гидробромиды, сульфаты, фосфаты этих соединений неизвестны.

Нашими опытами показано, что некоторые соли 5-ароилметил-2-иминотиазолидинона-4 могут быть синтезированы взаимодействием  $\beta$ -ароилакриловых кислот с тиомочевинной и минеральными кислотами в спирте при комнатной температуре.

Этим способом были получены гидрохлориды, сульфаты и гидро-  
бромиды с высокими выходами [табл. 1—3].



Попытка получения фосфорнокислых солей не увенчалась успехом, при проведении реакции в присутствии фосфорной кислоты были получены не ожидаемые соли, а основания, соответствующие 5-ароилметил-2-иминотиазолидиноны-4. Таким образом, показано, что фосфорная кислота может служить катализатором при получении 5-ароилметил-2-иминотиазолидинонов-4, причем в отличие от работы [3], где в качестве катализатора применялась уксусная кислота, реакция идет даже при комнатной температуре.

Азот определяли по модифицированному методу Дюма-Прегля [4], при этом деструкцию солей проводили в медной пробирке, являющейся одновременно и восстановителем оксидов азота.

### Экспериментальная часть

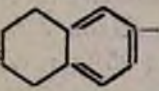
ИК спектры получили на приборе UR-20, в вазелиновом масле. УФ спектры сняты на спектрофотометре «Спекорд».

**Гидрохлориды 5-ароилметил-2-иминотиазолидинона-4.** К смеси 1,78 г (0,01 моля) β-бензоилакриловой кислоты и 1,52 г (0,02 моля) тиомочевинны в 20 мл спирта добавляют 1,5 мл конц. соляной кислоты. Реакционную смесь выдерживают при комнатной температуре 3—4 дня. Образовавшийся осадок отфильтровывают, затем кипятят его с 5 мл спирта, отфильтровывают и высушивают при комнатной температуре. Выход гидрохлорида 5-бензоил-2-иминотиазолидинона-4 2,1 г (78%), т. пл. 238°. ИК спектр, см<sup>-1</sup>: 1680 (NC=O, C=O), 1640 (C=N), 3220, 3450 (NH). УФ спектр, λ<sub>max</sub> (CH<sub>3</sub>OH), нм: 220, 245.

Аналогично получены все гидрохлориды, приведенные в табл. 1, депрессии т. пл. с полученными в работе [2] гидрохлоридами не дают.

Таблица 1

Гидрохлориды 2-имино-5-ароилметилтиазолидинонов-4

Ar	Выход, %	Т. пл., °С (спирт)	Найдено, %				Вычислено, %			
			C	H	N	Cl	C	H	N	Cl
C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	78	238	49,1	4,2	9,5	—	48,8	4,1	9,3	12,7
<i>m</i> -CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	81	244	50,2	4,6	9,9	11,8	50,6	4,6	10,0	12,4
	88	237	55,4	5,7	8,6	11,1	55,4	5,3	8,6	10,8
<i>p</i> -BrC <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	79	268	38,2	2,9	8,3	10,7	37,8	2,9	8,0	10,1

**Гидробромиды 5-ароилметил-2-иминотиазолидинона-4.** Смесь 0,01 моля β-ароилакриловой кислоты, 1,52 г (0,02 моля) тиомочевины, 1 мл 40% бромистоводородной кислоты в 25 мл спирта оставляют на 1—2 дня. Гидробромиды 5-ароилметил-2-иминотиазолидинона-4 выделяют как в предыдущем опыте, промывают водой, спиртом, затем кипятят в 3—4 мл спирта (табл. 2). ИК спектры,  $см^{-1}$ : 1675—1685 (NC=O, C=O), 1620—1645 (C=N), 3150—3250 (NH).

Таблица 2  
Гидробромиды 2-имино-5-ароилметилтиазолидинонов-4

Лг	Выход, %	Т. пл., °C (спирт)	Найдено, %		Вычислено, %	
			N	Br	N	Br
C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	60	237	8,6	24,9	8,9	25,4
<i>n</i> -CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	54	242	8,3	24,7	8,5	24,3
<i>n</i> -BrC <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	53	259	7,9	43,8	7,7	44,1
<i>n</i> -ClC <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	56	255	8,2	23,3	8,3	23,5

**Сульфаты 5-ароилметил-2-иминотиазолидинонов-4.** К 0,01 моля β-ароилакриловой кислоты, растворенной в 15 мл спирта, добавляют 1,52 г (0,02 моля) тиомочевины, а затем прикапывают 1 мл конц. серной кислоты. Реакционную смесь оставляют при комнатной температуре на 3 дня. К реакционной массе добавляют 20 мл воды, осадок отфильтровывают, промывают водой и высушивают (табл. 3). ИК спектры,  $см^{-1}$ : 1670—1680 (C=O, NC=O, C=N), 3220, 3330 (NH), 1060—1080, 1120 (SO<sub>4</sub><sup>2-</sup>).

Таблица 3  
Сульфаты 5-ароилметил-2-иминотиазолидинонов-4

Лг	Выход, %	Т. пл., °C (спирт)	Найдено, %		Вычислено, %	
			N	S	N	S
C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	56	152	9,4	17,1	9,9	16,9
<i>n</i> -CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	94	150	8,9	19,5	8,7	19,9
<i>n</i> -BrC <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	63	230	6,6	13,3	6,8	13,1

**5-Ароилметил-2-иминотиазолидиноны-4.** К смеси 0,01 моля β-ароилакриловой кислоты и 1,52 г (0,02 моля) тиомочевины в 10 мл метанола добавляют 1 мл фосфорной кислоты. Почти сразу же начинается помутнение, выпадает осадок. Через 4—5 дней осадок отфильтровывают, промывают метанолом. Для очистки от примесей кипятят в метаноле. Этим способом получили 5-бензоилметил-2-иминотиазолидинон-4, выход 73%, т. пл. 222° [2], 5-толуилметил-2-иминотиазолидинон-4, выход 95%, т. пл. 250° [2] и 5-(*n*-бромбензоилметил)-2-иминотиазолидинон-4, выход 77%, т. пл. 250° [1].

ԹԻՈՄԻՉԱԼՅՈՒԹԻ շեՏ  $\beta$ -ԱՐՈՒՎԱԿՐԻԱԼԱԹԹՈՒՆԵՐԻ ՌԵԱԿՑԻԱՑԻ  
ՈՒՍՈՒՄՆԱՍԻՐՈՒԹՅՈՒՆԸ

IV. 5-ԱՐՈՒՎՄԵԹԻԼ-2-ԻՄԻՆՈԹԻԱՉՈԼԻՆ-4-ՈՆԵՐԻ ԱՂԵՐԻ ՍԻՆԹԵԶԸ

Ռ. Տ. ԿԱԶԻԿՅԱՆ, Է. Վ. ՍԱՏԱՐՅԱՆ, Գ. Վ. ԳՐԻԳՈՐՅԱՆ, Ս. Գ. ԱՂԲԱԿՅԱՆ և Ս. Մ. ԱԹԱՇՅԱՆ,

Ցույց է տրված, որ համապատասխան թթուների ներկայությամբ  $\beta$ -արոիլ-ակրիլաթթուները թիոմիզանյութի հետ առաջացնում են 5-արոիլմեթիլ-2-իմին-նոթիազոլիդինոնների հիդրոքլորիդներ, հիդրոբրոմիդներ և սուլֆատներ:

INVESTIGATION OF THE REACTION BETWEEN  
 $\beta$ -AROYLACRYLIC ACIDS AND THIOUREA

IV. A SINGLE STAGE SYNTHESIS OF 5-AROYLMETHYL-2-IMINO-  
THIAZOLIDIN-4-ONES

R. S. KHACHIKIAN, E. V. SAFARIAN, G. V. GRIGORIAN,  
S. G. AGHBALIAN and S. M. ATASHIAN

It has been shown that  $\beta$ -aroylacrylic acids form 5-aroylmethyl-2-iminothiazolidinone hydrochlorides, hydrobromides and sulphates with thiourea in the presence of mineral acids.

Л И Т Е Р А Т У Р А

1. J. Bougault, C. Chabrier, Compt. rend., 224, 656 (1947).
2. Տ. Գ. Աղբալյան, Ք. Դժ. Խաչիկյան, Տ. Մ. Ատաշյան, Արմ. քիմ. շ., 34, 569 (1981).
3. A. Sammour, M. I. B. Sellm, E. A. Soliman, Egypt J. chem., 15, 311 (1972—1973).
4. Ա. Ա. Աբրալյան, Ա. Խ. Խանզադյան, Արմ. քիմ. շ., 31, 790 (1978).

Армянский химический журнал, т. 37, № 8, стр. 493—497 (1984 г.)

УДК 547.814.1

ПРОИЗВОДНЫЕ ИЗОХРОМАНА

VII. СИНТЕЗ И БИОЛОГИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ НЕКОТОРЫХ  
N-АРИЛАЛКИЛЗАМЕЩЕННЫХ 1-ИЗОХРОМАНАЛКИЛАМИНОВ

Ա. Գ. ՏԱՄԴՈՒՐՈՎԱ, Ա. Տ. ՇԱԿԻՅԱՆ, Զ. Տ. ԶԱՏՄԻՍՅԱՆ և Յ. Ա. ՄԱՐԿԱՐՅԱՆ

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

Поступило 6 VII 1983

Восстановлением амидов 1-изохроманкарбоновой и 1-изохромануксусной кислот альмогидридом лития получены N-арилалкилзамещенные 1-изохроманалкиламинны IV.

Табл. 2, библиографические ссылки 6.

Фармакологические исследования ранее синтезированных соединений ряда 1-[(алкил-N-арилалкиламино)метил]изохромана показали четкое симпатолитическое действие, а также некоторые симптомы, характерные для веществ, возбуждающих ЦНС [1].