

**СИНТЕЗ НОВЫХ ПРОИЗВОДНЫХ 2-(*p*-АМИНОБЕНЗОЛ-  
СУЛЬФАМИДО)-ТИАЗОЛА И 2,3-ДИГИДРО-2-МЕТИЛ-1,4 -  
НАФТОХИНОН-2-СУЛЬФОНАТА**

**Յ. Գ. ՄԵՏՐՈՍՅԱՆ, Գ. Բ. ԱՄԲԱՐՇՄՅԱՆ, Ա. Ա. ԱՎԵՏԻՍՅԱՆ և Մ. Գ. ՏԱՐԳՅԱՆ**

Երևանский государственный университет

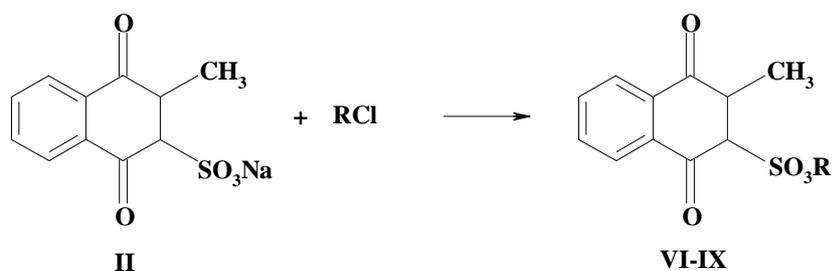
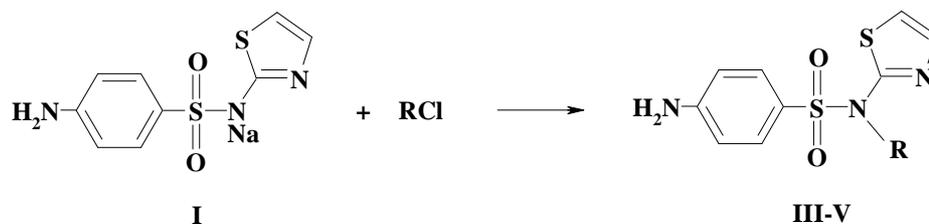
Поступило 4 V 2001

Взаимодействием натриевых производных 2-(*p*-аминобензолсульфамидо)-тиазола и 2,3-дигидро-2-метил-1,4-нафтохинон-2-сульфоната с этиловым эфиром монохлоруксусной кислоты, этиленхлоргидрином, эпихлоргидрином, *N*-хлорметилпирролидином и бензоилхлоридом синтезирован ряд новых производных 2-(*p*-аминобензолсульфамидо)-тиазола и 2,3-дигидро-2-метил-1,4-нафтохинон-2-сульфоната – потенциально биологически активных веществ.

Табл. 1, библиограф. ссылок 5.

Общеизвестна роль сульфамидных препаратов для лечения инфекционных заболеваний [1-5].

Целью данной работы является синтез новых водорастворимых производных 2-(*p*-аминобензолсульфамидо)-тиазола (I) и 2,3-дигидро-2-метил-1,4-нафтохинон-2-сульфоната (II), являющихся исходными веществами для синтеза гетероциклических соединений, представляющих интерес для фармацевтической и биологической химии. Изучено взаимодействие натриевых производных I и II с галогенсодержащими соединениями различных классов. Разработаны оптимальные условия реакции и установлено, что хорошие выходы продуктов реакции получаются в случае бензсульфамидного препарата в диметилформамиде, а в случае сульфонатного – в абсолютном этаноле (VIII), водном этаноле (VI) и водной среде (VII, IX).



(IV, VII) R = -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH; (V, VI) R = -CH<sub>2</sub>COOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;

(III) R = -CH<sub>2</sub>-CH-CH<sub>2</sub>; (VIII) R = -CH<sub>2</sub>N-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CO; (IX) R = -CO-C<sub>6</sub>H<sub>5</sub> (IX).

### Экспериментальная часть

Спектры ЯМР <sup>1</sup>H регистрировались на приборе “Tesla BS-497 (100 МГц)”, внутренний стандарт – ГМДС. ИК спектры сняты на спектрофотометре “UR-20”. Индивидуальность и чистоту полученных соединений контролировали методом ТСХ на пластинках “Silufol UV-254” в системах четыреххлористый углерод-хлороформ (2,5:1) для соединений III-V и этанол-бензол (3:1) для соединений VI-X, проявление – парами йода.

**2-[п-Аминобензол-N-(глицидил)сульфамидо]-тиазол (III).** К 10 ммольям I добавляли 20 мл абсолютного диметилформаида и 10 ммольей мелко нарезанного металлического натрия. Смесь нагревали на водяной бане в течение 1 ч, затем по каплям добавляли 10 ммольей эпихлоргидрина. Смесь нагревали на водяной бане 5-6 ч. Полученное после удаления осадка (NaCl) и отгонки растворителя кристаллическое вещество III (табл.) хорошо растворяется в диметилформаиде, этаноле, не растворяется в воде, хлороформе, четыреххлористом углероде, бензоле, диоксане.

Аналогично получены соединения IV, V (табл.) с использованием вместо диметилформаида абсолютного этилового спирта. Вещество IV

Таблица

**Выходы, температуры плавления, данные ТСХ и элементного анализа соединений III-IX**

Соединение	Выход, %	Т.пл., °С	Найдено, %				Брутто-формула	Вычислено, %				R <sub>f</sub>
			C	H	N	S		C	H	N	S	
III	63	190	48,00	3,96	13,08	20,09	$C_{12}H_{13}N_3O_3S_2$	48,30	4,02	13,00	19,81	0,50
IV	67	143	43,93	3,87	13,81	21,00	$C_{11}H_{13}N_3O_3S_2$	44,15	4,35	14,05	21,40	0,54
V	69	183	45,69	3,97	11,99	18,49	$C_{13}H_{15}N_3O_4S_2$	45,75	4,40	12,32	18,77	0,47
VI	50	90	52,46	4,29	—	9,00	$C_{15}H_{16}O_7S$	52,94	4,71	—	9,41	0,60
VII	80	177 – 178	51,89	4,49	—	10,29	$C_{13}H_{14}O_6S$	52,35	4,70	—	10,74	0,60
VIII	53	—	54,31	4,35	3,51	8,99	$C_{16}H_{17}NO_6S$	54,70	4,84	3,99	9,12	0,65
IX	63	72 – 75	59,79	3,85	—	8,63	$C_{18}H_{14}O_6S$	60,34	3,91	—	8,94	0,65



նավթոլիինոն-2-(պիրրոլիդինսուլֆիլ) սուլֆոնատի և 2,3-դիհիդրո-2-մեթիլ-1,4-նավթոլիինոն-2-(բենզոլի)սուլֆոնատի:

**SYNTHESIS OF NEW DERIVATIVES  
OF 2-(P-AMINOBENZENESULFAMIDO)-THIAZOL  
AND 2,3-DIHYDRO-2-METHYL-1,4-NAPHTOQUINONE-2-SULFONATE**

**E. G. MESROPYAN, G. B. HAMBARDZUMYAN,  
A. A. AVETISSYAN and M. G. SARGSYAN**

The interaction of sodium derivatives of 2-(p-aminobenzenesulfamido)-thiazol and 2,3-dihydro-2-methyl-1,4-naphtoquinone with monochloroacetic acid ethyl ester, ethylenechlorhydrine, epichlorhydrine, N-chlormethylpyrrolidine and benzylchloride lead to formation of 2-[p-aminobenzene-N-(ethoxycarbonylmethyl)]-, 2-[p-aminobenzene-N-(oxyethyl)sulfamido]-thiazol, and 2,3-dihydro-2-methyl-1,4-naphtoquinone-2-sulfonate ethylacetate, 2,3-dihydro-2-methyl-1,4-naphtoquinone-2-( $\beta$ -oxyethyl)-sulfonate, 2,3-dihydro-2-methyl-1,4-naphtoquinone-2-(pyrrolidinomethyl)-sulfonate, 2,3-dihydro-2-methyl-1,4-naphtoquinone-2-(benzoyl)-sulfonate.

**ЛИТЕРАТУРА**

- [1] *Машковский М.Д.* Лекарственные средства. М., Медицина, 1972, т. 2, с. 320.
- [2] *Мелентьева Г.А.* Фармацевтическая химия. т.1, М., Медицина, 1976, с. 312.
- [3] *Ушаков С.Н., Богомова Л.Г., Давиденков В.В.* Актуальные вопросы переливания крови. М., Медгиз, 1954. вып. 3, с. 107.
- [4] *Месропян Э.Г., Амбарцумян Г.Б., Аветисян А.А.* // ЖОрХ, 1998, т. 34, вып. 1, с. 118.
- [5] *Месропян Э.Г., Амбарцумян Г.Б., Аветисян А.А.* // ЖОрХ, 2000, т. 36, вып. 3, с. 462.