

ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ХИМИЯ

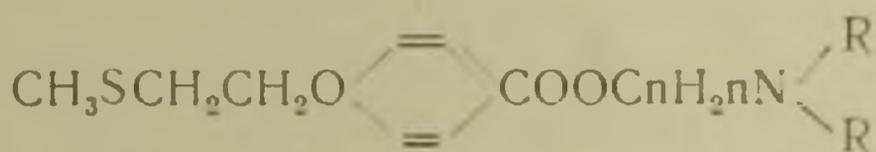
А. Л. Мнджоян, академик АН Армянской ССР, В. Г. Африкян, В. Е. Бадалян
 и А. А. Дохикян

Исследование в области производных
 п-алкоксибензойных кислот

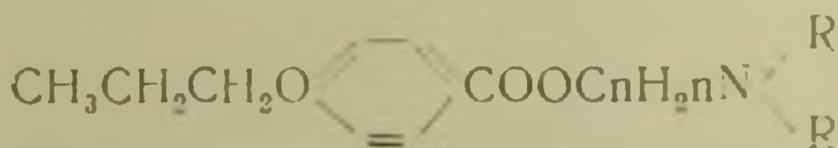
Сообщение XVIII. Некоторые аминоэфиры п-алкилмеркаптоэтоксibenзойных
 кислот

(Представлено 14 XII 1959)

Исследованием биологических свойств некоторых аминоэфиров
 п-метилмеркаптоэтоксibenзойной кислоты

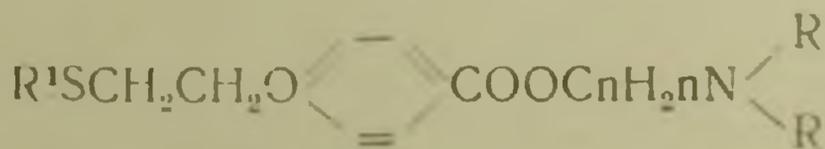


было установлено, что включение двухвалентной серы в строение со-
 ответствующих аминоэфиров п-пропоксибензойной кислоты усиливает



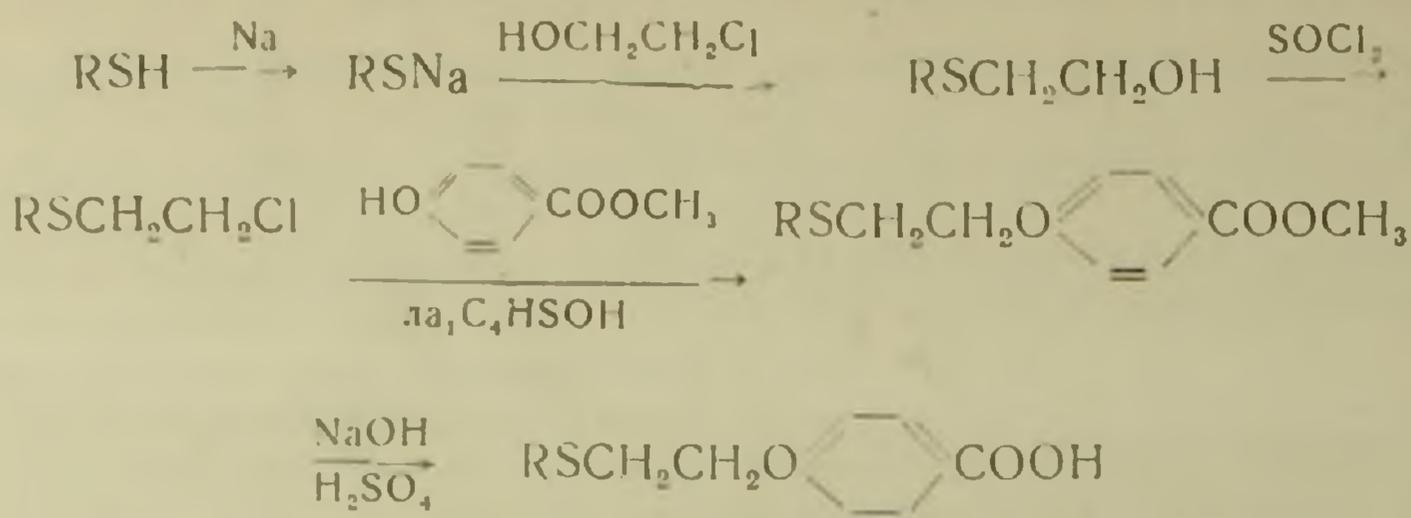
фармакологические и химиотерапевтические свойства соединений, в
 частности, их действие на одноклеточные и патогенные микроорга-
 низмы.

С целью исследования влияния строения алкилмеркапто-группы
 на имеющуюся биологическую активность, мы наметили синтез 5 не-
 больших гомологических рядов соединений с общей формулой



где диалкиламиноалканола представляют собой аминоспирты различ-
 ного строения, а радикал у серы этильный — бутильный остатки.

Использованные п-алкилмеркаптоэтоксibenзойные кислоты син-
 тезированы по схеме



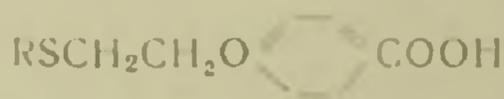
Алкилмеркаптаны получены взаимодействием соответствующих алкилбромидов с тиомочевинной в щелочной среде (1). Последние через меркаптиды введены в реакцию с этиленхлоргидрином, полученные алкилмеркаптоэтанола при помощи хлористого тионила превращены в хлориды и, затем, конденсированы с метиловым эфиром п-оксibenзойной кислоты в присутствии этилата натрия. Омылением промежуточных эфиров выделены алкилмеркаптоэтоксibenзойные кислоты, которые действием хлористого тионила переведены в хлорангидриды и в среде нейтрального растворителя—в аминоэфиры.

В данном сообщении описывается 60 аминоэфиров, идентифицированных в виде хлоргидратов и пикратов, за исключением нескольких, соли которых не удалось кристаллизовать.

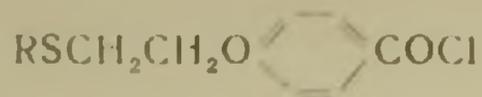
Для биологических исследований получены также йодалкилаты, представляющие собой, в большинстве случаев, тягучие масла.

Синтезированные кислоты и их хлорангидриды, а также аминоэфиры описываются нами впервые; их физико-химические константы сведены в таблицы 1—7.

Таблица 1



R	Выход, %	Температура плавления в °С	Анализ в %					
			С		Н		N	
			вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено
CH ₃ CH ₂ —	90,0	96—97	58,38	58,56	6,23	6,21	14,17	14,19
CH ₃ CH ₂ CH ₂ —	93,0	102—103	59,97	59,69	6,70	6,65	13,34	13,61
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{—}$	91,6	116—117	59,97	59,76	6,70	6,50	13,34	13,28
CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	92,0	94—95	61,38	61,52	7,13	7,42	12,60	12,63
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CHCH}_2 \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{—}$	91,0	108—109	61,38	61,43	7,13	7,27	12,60	12,67



R	Выход в %	Температура кипения в °С	Давление в мм	d_4^{20}	n_D^{20}	MRD		Анализ в %	
						вычислено	найдено	Cl	
								вычислено	найдено
CH ₃ CH ₂ —	89,1	185—188	2	—	—	—	—	14,40	14,39
CH ₃ CH ₂ CH ₂ —	84,7	173—174	2	1,1920	1,5584	68,50	70,51	13,69	13,86
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{CH}—$	76,8	180—183	2	1,1840	1,5575	68,50	70,42	13,69	14,00
CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	88,5	211—212	2	1,1631	1,5675	73,12	76,64	12,99	13,02
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{CH}—\text{CH}_2—$	82,0	200—202	2	1,1580	1,5666	73,12	76,87	12,99	13,23

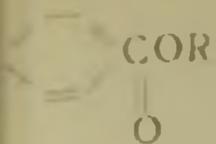
Экспериментальная часть. Алкилмеркаптоэтоксibenзойные кислоты. В литровой круглодонной колбе готовят алкоголь из 23 г (1 гр. ат.) металлического натрия и 350 мл этилового спирта. К полученному алкоголю добавляют 152 г (1 моль) метилового эфира *p*-оксибензойной кислоты и 1,05 моля алкилмеркапто-этилхлорида. Реакционную смесь при перемешивании нагревают на водяной бане в течение 12 часов и, заменив обратный холодильник нисходящим, отгоняют спирт. К остатку приливают раствор 3 г едкого натра в 200 мл воды и экстрагируют эфиром. Из объединенных эфирных экстрактов отгоняют эфир, приливают 480—500 г 10% раствора едкого натра и кипятят с обратным холодильником до исчезновения маслянистого слоя. После охлаждения воднощелочный раствор экстрагируют эфиром, приливают 1—1,5 литра воды и осаждают кислоту 50% серной кислотой. Выделившийся осадок отфильтровывают, промывают на фильтре холодной водой и сушат на воздухе.

*Хлорангидриды *n*-алкилмеркаптоэтоксibenзойных кислот.* В литровую колбу помещают 1 моль *n*-алкилмеркаптоэтоксibenзойной кислоты в 200 мл абсолютного бензола и приливают 151 г (1,2 моля) хлористого тионила в 150—200 мл абсолютного бензола. Смесь нагревают на водяной бане в течение 4—5 часов, отгоняют растворитель и остаток перегоняют в вакууме.

*Аминоэфиры *n*-алкилмеркаптоэтоксibenзойных кислот.* К 0,05 моля хлорангидрида *n*-алкилмеркаптоэтоксibenзойной кислоты в 100 мл абсолютного бензола приливают 0,06 моля аминоспирта, растворенного в 50—80 мл абсолютного бензола. Смесь кипятят на водяной бане в течение 4—5 часов, охлаждают до комнатной температуры и обрабатывают разбавленной соляной кислотой до кислой реакции на



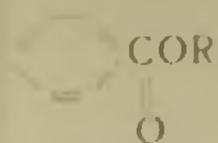
R	Выход в %	Температура кипения в °C	Давление в мм	d_4^{20}	n_D^{20}
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	85.0	205—206	2	1.0973	1.5230
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	88.2	215—216	2	1.0725	1.5130
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	70.0	218—219	2	1.0875	1.5180
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3-$	69.9	222—223	2	1.0552	1.5140
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}- \\ \text{CH}_3$	88.8	208—210	2	1.0629	1.5295
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}- \\ \text{CH}_3$	83.3	217—218	2	1.0475	1.5260
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}- \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3$	75.1	215—216	2	1.0552	1.5115
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}- \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3$	80.0	223—225	2	1.0377	1.5220
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{C}-\text{CH}_2- \\ \text{CH}_3$	62.1	225—226	2	1.0533	1.5105
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{C}-\text{CH}_2- \\ \text{CH}_3$	60.5	229—230	2	1.0325	1.5205
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}- \\ \text{CH}_3 \\ \begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2$	69.8	224—225	2	1.0727	1.5310
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}- \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2$	79.1	230—231	2	1.0339	1.5020



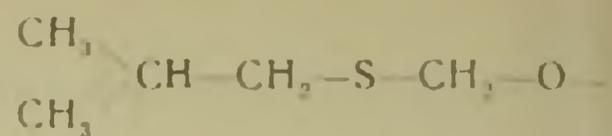
MR _D		А н а л и з в %								Температура плавления солей	
		C		H		N		S		хлоргидратов	пикратов
вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено		
83,19	82,99	60,58	60,45	7,79	7,73	4,70	4,72	10,78	10,49	139	130
92,43	91,20	62,74	63,05	8,36	8,35	4,30	4,20	9,85	10,16	125	120
87,81	86,77	61,71	61,47	8,09	8,39	4,50	4,59	10,29	10,51	159	140
97,05	96,85	63,69	63,59	8,59	8,39	4,12	4,02	9,44	9,56	123	103
92,43	94,49	62,74	62,57	8,36	8,44	4,30	4,44	9,85	9,97	—	95
101,66	103,57	64,55	64,60	8,83	8,96	3,96	4,02	9,07	9,10	—	73
97,05	96,43	63,69	63,14	8,59	8,84	4,12	4,00	9,44	9,82	—	97
106,28	107,96	65,33	65,45	9,05	9,25	3,81	3,98	8,72	8,75	—	—
97,05	96,47	63,69	63,55	8,59	8,80	4,12	4,26	9,44	9,51	102	112
106,28	107,82	65,33	65,20	9,05	9,17	3,81	3,75	8,72	8,69	—	—
100,39	102,24	60,98	60,78	8,53	8,30	7,90	7,78	9,04	9,09	—	129
119,46	117,22	64,34	64,21	9,32	9,68	6,82	6,92	7,88	8,16	100	153



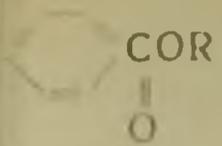
R	Выход в %	Температура кипения в °C	Давление в мм	d_4^{20}	n_D^{20}
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	60.0	202-203	2	1,0698	1,5310
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	70.1	210-212	2	1,0551	1,5120
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	64.8	217-218	2	1,0725	1,5318
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	68,0	225-226	2	1,0481	1,5237
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}- \\ \text{CH}_3$	75.1	212-213	2	1,0509	1,5120
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}- \\ \text{CH}_3$	78,2	235-236	2	1,0195	1,5168
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}- \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3$	75,4	220-221	2	1,0333	1,5202
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}- \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3$	80,0	233-234	2	1,0101	1,5170
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$	60,3	220-221	2	1,0316	1,5203
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$	68,7	234-235	2	1,0231	1,5155
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}- \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_3$	69,8	230-231	2	1,0341	1,5243
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}- \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2$	74,9	238-239	2	1,0155	1,5150



MR _D		А н а л и з в %								Температура плавления солей	
		С		Н		N		S		хлоргидратов	микратов
вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено		
87.41	89.61	61.71	62.03	8.09	7.78	4.50	4.17	10.29	10.60	125	106
96.93	97.05	63.69	63.87	8.59	8.59	4.12	4.24	9.44	9.58	130	107
92.05	92.85	62.74	62.57	8.36	8.48	4.10	4.30	9.86	10.05	151	149
101.26	102.54	64.55	64.50	8.84	8.55	3.96	3.72	9.07	8.79	—	121
96.93	98.47	63.69	63.89	8.59	8.52	4.12	4.01	9.44	9.62	—	91
105.75	104.95	65.33	65.11	9.05	9.00	3.81	3.59	8.72	8.66	120	60—62
101.26	104.09	64.55	64.40	8.84	8.80	3.96	3.97	9.07	9.28	—	104
110.50	112.64	66.19	66.32	9.25	9.30	3.64	3.92	8.40	8.56	—	—
101.26	103.00	64.55	64.36	8.84	8.55	3.96	4.00	9.07	8.70	—	98
110.50	111.98	66.19	66.90	9.25	9.16	3.64	3.56	8.40	8.21	—	—
105.60	107.55	61.92	61.74	8.75	8.61	7.60	7.49	8.50	8.54	98	190
122.98	121.04	65.06	65.03	9.49	9.27	6.59	6.37	7.55	7.85	—	—



R	Выход в %	Температура кипения в °C	Давление в мм	d_4^{20}	n_D^{20}
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 -$	80,2	202—203	2	1,0880	1,5225
$\begin{array}{c} \text{CH}_2 - \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 -$	85,0	224—225	2	1,0448	1,5292
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 -$	60,1	231—232	2	1,0613	1,5252
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \\ \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 -$	76,1	236—237	2	1,0372	1,5265
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \underset{\text{CH}_3}{\text{CH}} -$	80,0	220—221	2	1,0250	1,5198
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \\ \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \underset{\text{CH}_3}{\text{CH}} -$	88,9	234—235	2	1,0188	1,5158
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \underset{\text{CH}_3}{\text{CH}} - \underset{\text{CH}_3}{\text{CH}} -$	90,1	237—238	2	1,0259	1,5180
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \\ \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \underset{\text{CH}_3}{\text{CH}} - \underset{\text{CH}_3}{\text{CH}} -$	92,5	242—243	2	1,0142	1,5142
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \underset{\text{CH}_3}{\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}} - \text{CH}_2 -$	85,2	234—235	2	1,0239	1,5168
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \\ \text{CH}_3 - \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \underset{\text{CH}_3}{\text{C}} - \text{CH}_2 -$	90,8	239—240	2	1,0082	1,5148
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \underset{\text{CH}_3}{\text{CH}} -$	84,0	240—241	2	1,0369	1,5210
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \underset{\text{CH}_3}{\text{CH}} -$	80,4	252—253	2	1,0184	1,5130
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \\ \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \underset{\text{CH}_3 - \text{CH}_2}{\text{CH}} -$					

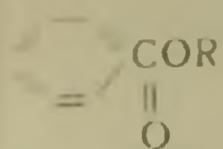


MR _D		А н а л и з в %								Температура плавления солей	
		C		H		N		S		хлоргидратов	цикратов
вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено		
87,48	87,95	61,71	60,46	8,40	8,09	4,50	4,36	10,29	10,35	126	—
97,05	96,24	63,69	63,89	8,63	8,78	4,12	4,18	9,44	9,63	140	110
92,43	91,26	62,74	62,86	8,36	8,34	4,30	4,10	9,85	9,82	162	113—114
101,66	99,35	61,55	64,37	8,84	8,71	3,96	3,74	9,07	9,06	106	—
97,05	96,24	63,69	63,51	8,63	8,61	4,12	3,91	9,44	9,43	98	76
105,88	108,78	65,33	65,09	9,05	8,81	3,81	4,04	8,72	9,00	—	70
101,66	100,52	64,55	64,49	8,84	9,13	3,96	3,74	9,07	9,32	125	100
110,78	109,05	66,19	66,47	9,25	9,08	3,64	3,75	8,40	8,48	—	—
101,65	100,77	64,55	64,80	8,84	8,70	3,96	3,75	9,07	9,33	105	100
110,78	112,87	66,19	66,39	9,25	9,46	3,64	3,62	8,40	8,59	107	125
105,2	108,38	61,92	61,77	8,75	8,38	7,60	7,38	8,50	8,80	173	176
122,98	122,22	65,06	64,93	9,49	9,58	6,59	6,83	7,55	7,82	—	95



R	Выход в %	Температура кипения в °C	Давление в мм	d_4^{20}	n_D^{20}
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	86,5	200-201	2	1,0845	1,5315
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	82,5	220-221	2	1,0984	1,5315
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	68,2	218-219	2	1,0895	1,5340
$\begin{array}{l} \text{C}_3\text{H}-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	65,3	220-221	2	1,0782	1,5380
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}- \\ \text{CH}_3$	75,2	230-231	2	1,0514	1,5220
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}- \\ \text{CH}_3$	18,5	220-221	2	1,0460	1,5090
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}- \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3$	60,8	214-215	2	1,0557	1,5220
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}- \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3$	70,8	223-224	2	1,0182	1,5130
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_3-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$	59,8	220-221	2	1,0543	1,5265
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}}-\text{CH}_2-$	55,9	230-232	2	1,0368	1,5265
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}- \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2$	50,0	225-226	2	1,0576	1,5225
$\begin{array}{l} \text{CH}_3-\text{CH}_2 \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}- \\ \text{CH}_3-\text{CH}_2 \quad \text{CH}_3 \end{array} \text{N}-\text{CH}_2$	60,8	235-236	2	1,4500	1,5090

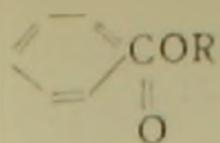
Таблица 6



MR _D		Анализ в %								Температура плавления солей	
		C		H		N		S			
вычис- лено	найдено	вычис- лено	найдено	вычис- лено	найдено	вычис- лено	найдено	вычис- лено	найдено	алюргид- рагон	микратов
92,03	94,12	62,74	62,77	8,36	8,06	4,30	4,47	9,85	10,80	119	110
101,54	100,52	64,55	64,22	8,84	9,10	3,96	3,76	9,07	8,87	116	92
96,65	98,07	63,69	63,60	8,59	8,29	4,12	4,40	9,44	9,43	160	125
105,87	107,15	65,33	65,16	9,05	8,74	3,81	3,85	8,72	8,76	88	100
101,54	100,93	64,55	64,31	8,84	8,52	3,96	4,24	9,07	9,27	—	96
110,50	113,10	66,19	66,13	9,25	9,48	3,64	3,68	8,40	8,52	—	85
106,16	108,16	65,33	65,62	9,05	8,97	3,81	4,10	8,72	8,59	100	89
115,40	118,80	66,79	67,08	9,44	9,20	3,54	3,61	8,10	7,97	—	—
106,16	109,36	65,33	65,60	9,05	8,86	3,81	3,64	8,72	8,83	115	102
116,40	117,52	66,79	66,39	9,44	9,65	3,54	3,59	8,10	8,04	98	92
110,22	113,22	62,80	62,81	8,96	9,00	8,38	8,45	7,32	7,20	69	163
128,29	130,25	65,71	65,43	9,65	9,89	6,38	6,79	7,31	7,98	—	140



R	Выход в %	Температура кипения в °C	Давление в мм	d_4^{20}	n_D^{20}
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 -$	89,2	202—203	2	1.0809	1,5160
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \\ \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 -$	80,8	205—207	2	1.0575	1,5115
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 -$	68,2	200—201	2	1.0771	1,5160
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \\ \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 -$	65,8	215—216	2	1,0449	1,5080
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH} -$ $\quad \quad \quad \quad \quad \quad \quad \quad $ $\quad \quad \quad \quad \quad \quad \quad \quad \text{CH}_3$	75,5	212—213	2	1,0488	1,5065
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \\ \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH} -$ $\quad \quad \quad \quad \quad \quad \quad \quad $ $\quad \quad \quad \quad \quad \quad \quad \quad \text{CH}_3$	69,3	236—237	2	1,0296	1,5215
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH} - \text{CH} -$ $\quad \quad \quad \quad \quad \quad $ $\quad \quad \quad \quad \quad \text{CH}_3 \text{CH}_3$	72,8	215—216	2	1,0430	1,5050
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \\ \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH} - \text{CH} -$ $\quad \quad \quad \quad \quad \quad $ $\quad \quad \quad \quad \quad \text{CH}_2 \text{CH}_3$	68,4	218—219	2	1,0357	1,5000
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{C} - \text{CH}_2 -$ $\quad \quad \quad \quad \quad $ $\quad \quad \quad \quad \text{CH}_3 \text{CH}_3$	69,8	220—221	2	1,0370	1,5030
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \\ \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{C} - \text{CH}_2 -$ $\quad \quad \quad \quad \quad \quad $ $\quad \quad \quad \quad \quad \text{CH}_3 \text{CH}_3$	60,5	225—226	2	1,0220	1,5130
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH} -$ $\quad \quad \quad \quad $ $\quad \quad \quad \quad \begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2$	67,4	232—233	2	1,0488	1,5291
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \\ \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2 - \text{CH} -$ $\quad \quad \quad \quad $ $\quad \quad \quad \quad \begin{array}{c} \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \\ \text{CH}_3 - \text{CH}_2 \end{array} \text{N} - \text{CH}_2$	71,5	240—241	2	1,0159	1,4980



M _R D		А н а л и з в %								Температура плавления солей	
		C		H		N		S		хлоргидратов	и микрогов
вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено		
92,03	91,30	62,74	62,99	8,36	8,30	4,30	4,13	9,85	10,00	143	103
101,26	103,39	64,55	64,31	8,84	8,54	3,96	3,91	9,07	9,10	138	105
96,65	98,52	63,69	63,49	8,59	8,67	4,12	3,88	9,44	9,30	165	121
105,88	107,90	65,33	65,00	9,05	9,05	3,81	3,79	8,72	9,01	94	101
101,26	104,72	64,55	64,80	8,84	9,05	3,96	3,75	9,07	8,77	—	92
110,54	112,96	66,19	66,20	9,25	9,13	3,64	3,45	8,40	8,41	—	52
105,88	108,56	65,33	65,06	9,05	8,94	3,81	3,48	8,72	8,85	136	92
115,12	117,43	66,79	66,73	9,44	9,60	3,54	3,25	8,10	8,12	—	112
105,88	108,56	65,33	65,57	9,05	9,10	3,81	4,03	8,72	8,54	—	105
115,12	118,30	66,79	67,03	9,44	9,43	3,54	3,34	8,10	8,40	123	102
109,82	112,40	62,80	62,83	8,96	8,82	7,32	7,51	8,38	8,47	165	136
128,29	129,45	65,71	65,84	9,89	9,69	6,38	6,58	7,31	7,18	—	126

конго. Отделив водный слой, насыщают его поташом, приливают 2—3 мл разбавленного раствора едкого натра и экстрагируют эфиром. Соединенные эфирные экстракты высушивают над прокаленным сульфатом натрия, отгоняют растворитель и остаток перегоняют в вакууме.

Четвертичные соли аминоэфиров соли. В эфирный раствор аминоэфира приливают алкилоидиты с избытком. При стоянии выпадает осадок, который отсасывают и тщательно промывают эфиром.

Хлоргидраты аминоэфиров. В эфирный раствор аминоэфира при перемешивании приливают эфирный раствор хлористого водорода до слабо кислой реакции на лакмус. Выделившийся осадок отсасывают и тщательно промывают эфиром.

Институт тонкой органической химии
Академии наук Армянской ССР

Ա. Լ. ՄՆՋՈՅԱՆ, Վ. Գ. ԱՖՐԻԿՅԱՆ, Վ. Ե. ԲԱԴՄԼՅԱՆ ԵՎ Ա. Ա. ԴՈՒԽԿՅԱՆ

Հետազոտությունը p-ալկիլսիբենզոական քրուների բնագավառում

Հաղորդում XVIII. p-ալկիլմերկապտոէթօքսիբենզոական քրուների մի բանի ամինոէսթերների սինթեզը

p-մեթիլմերկապտոէթօքսիբենզոական թթվի ամինոէսթերների բիոլոգիական հատկությունների ուսումնասիրությունները ցույց տվեցին, որ երկարժեք ծծմբի մուտքը պ-պրոպօքսիբենզոական թթվի կառուցվածքի մեջ ութեղացնում է նրանց ազդեցությունը, հատկապես միաբջիջ և սլատոգեն միկրոօրգանիզմների վրա:

Նպատակ ունենալով հետազոտել ալկիլմերկապտոէթերների ազդեցությունը p-ալկօքսիբենզոական թթվի էսթերների ալտիվումթյան վրա, մենք սինթեզեցինք p-ալկիլմերկապտոէթօքսիբենզոական թթվի ամինոէսթերների 5 փոքրիկ հոմոլոգիական շարքեր, որոնց մեջ ալկիլ ռադիկալը փոփոխվում է էթիլից—բուտիլ: Այդ ամինոէսթերների սինթեզի համար օգտագործել ենք տարբեր կառուցվածքի ամինոսպիրտներ:

Այս աշխատանքում նկարագրվում են 60 ամինոէսթերներ և նրանց ջրում լուծելի աղերը, որոնք ստացված են բիոլոգիական ուսումնասիրությունների համար:

p-ալկիլմերկապտոէթօքսիբենզոական թթուները, նրանց քլորանհիդրիդները, ինչպես նաև ամինոէսթերները նկարագրվում են առաջին անգամ:

ЛИТЕРАТУРА — ԳՐԱԿԱՆՈՒԹՅՈՒՆ

¹ Фогель А., Textbook of Practical Organic Chemistry 481, 1947 (С. А. 42. 2611 (1948)).