

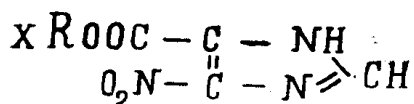
ФЕНИЛОВЫЕ И НАФТИЛОВЫЕ ЭФИРЫ 4(5)-НИТРОИМИДАЗОЛ- 5(4)-КАРБОНОВОЙ КИСЛОТЫ

[Л. П. КУЛЕВ], Л. С. НИКОНОВА

Производные 4(5)-нитроимидазол-5(4)-карбоновой кислоты описаны в литературе мало.

Из эфиров этой кислоты изучены главным образом эфиры алифатических спиртов [1, 2], проявившие в опытах вне организма сравнительно невысокую антимикробную активность.

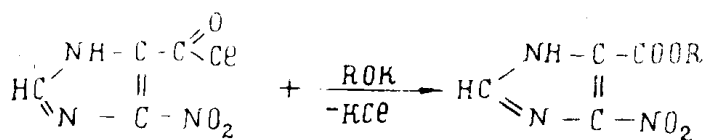
Учитывая, что введение фенильных радикалов может оказать существенное влияние на свойства эфиров в сторону усиления этой активности, нами были получены эфиры общей формулы.



Нитроимидазолкарбоновая кислота получалась по разработанному одним из нас совместно с А. М. Рожковым и усовершенствованному с Р. Н. Гиревой способу [3, 4].

Все описанные ниже соединения получались путем взаимодействия хлорангидрида нитроимидазолкарбоновой кислоты с соответствующими фенолятами по схеме

где R = C₆H₅, C₁₀H₇; x = CH₃, NO₂



Хлорангидрид получен действием тионилхлорида на нитроимидазолкарбоновую кислоту.

Эфиры представляют собой кристаллические вещества, очень хорошо растворимые в ацетоне, значительно хуже в других обычных органических растворителях; с минеральными и органическими кислотами солей и комплексных соединений не образует. УФ-спектры (рис. 1) получены на спектрофотометре СФ-4 в ацетоне.

Введение нитрогруппы в бензольное кольцо эфира приводит к смещению максимума поглощения в сторону коротких длин у орто- и метанитрофениловых эфиров на 280Å и 250Å соответственно и на 40Å у паранитрофенильного (табл. 1). Характерные полосы поглощения и соответствующий им молекулярный коэффициент экстинкции приведены в табл. 1.

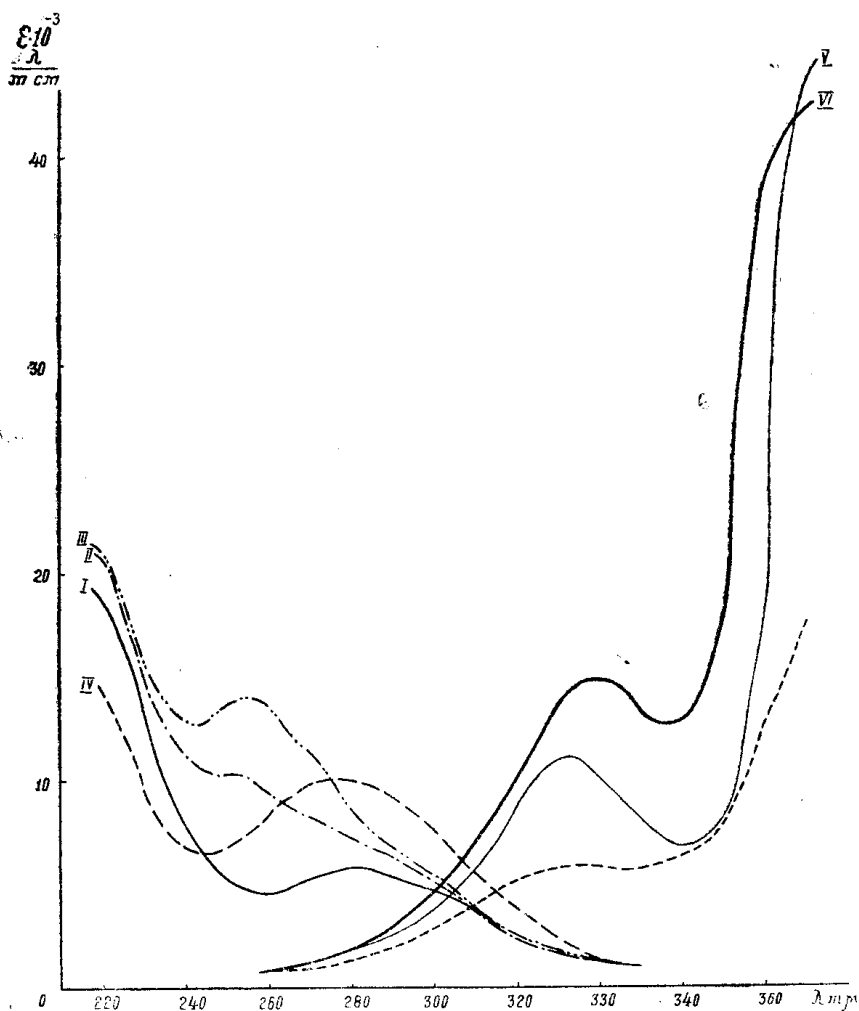
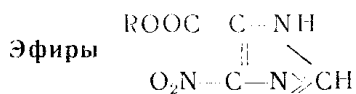
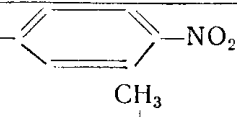
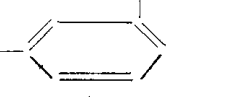
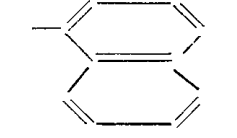
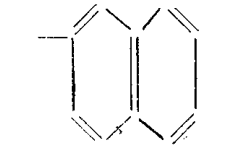


Рис. 1. Ультрафиолетовые спектры поглощения. I—фениловый эфир, II—ортонитрофениловый, III—метанитрофениловый, IV—паранитрофениловый, V—1-нафтиловый, VI—2-нафтиловый, VII—метаметилфениловый.

Таблица 1



№ п/п	Название эфира	R	с.м.	l, с.м.	$\frac{\epsilon_{\text{max}}}{m \cdot l}$	$\frac{\epsilon_{\text{max}}}{\left(\frac{\lambda}{\text{мст}}\right)}$
1	2	3	4	5	6	7
I	Фениловый		10 ⁻²	0,005	280	5800
II	o-Нитрофениловый		10 ⁻²	0,005	252	10200
III	m-Нитрофениловый		10 ⁻²	0,005	255	14000

1	2	3	4	5	6	7
IV	<i>n</i> -Нитрофениловый		10^{-2}	0,005	276	10000
V	<i>m</i> -Метилфениловый		10^{-2}	0,005	274	5800
VI	1-Нафтиловый		10^{-2}	0,005	272	11000
VII	2-Нафтиловый		10^{-2}	0,005	272	14800

Экспериментальная часть

Фениловый эфир 4(5)-нитроимидазол-5(4)-карбоновой кислоты (I). К раствору фенолята калия, полученного действием 25%-ного водного раствора KOH на 1,61 г фенола, вносят 3 г хлорангидрида 4(5)-нитроимидазол-5(4)-карбоновой кислоты, хорошо перемешивают в течение часа при 50° и оставляют стоять на 5—6 часов в термостате при той же температуре. Добавляют небольшое количество воды, перемешивают, декантируют, фильтруют, высушивают осадок сначала на воздухе, а затем в вакуумэксихаторе. После перекристаллизации из спирта получают 1,69 г (42% теор.) эфира в виде белых блестящих кристаллов с т. пл. 189,5—191°. Найдено %: N 18,27. C₁₀H₇O₄N₃. Вычислено %: N 18,02.

o-Нитрофениловый эфир (II). Получен аналогично (I) из o-нитрофенолята калия (из расчета на 2,38 г o-нитрофенола) и 3 г хлорангидрида нитроимидазолкарбоновой кислоты из спирта с т. пл. 194—195°. Выход 1,33 г (30% теор.). Найдено %: N 19,79. C₁₀H₆O₆N₄. Вычислено %: N 20,14.

m-Нитрофениловый эфир (III). Получен аналогично (II). Белые кристаллы из спирта с т. пл. 195—197° (с разлож.). Выход 2,03 г (59,3% теор.). Найдено %: N 20,39. C₁₀H₆O₆N₄. Вычислено %: N 20,14.

n-Нитрофениловый эфир (IV). Получен аналогично (II). Белые кристаллы из спирта с т. пл. 195—197° (с разлож.). Выход 2,03 г (42,7% теор.). Найдено %: N 20,42. C₁₀H₆O₆N₄. Вычислено %: N 20,14.

m-Метилфениловый эфир (V). Получен аналогично (I) из 1,85 г *m*-крезола. Белые кристаллы из спирта с т. пл. 204—204,5°. Найдено %: N 16,59. C₁₁H₉O₄N₃. Вычислено %: N 17,00.

1-Нафтиловый эфир (VI). Получен аналогично (I) из 2,47 г 1-нафтола. Золотистые блестящие иглы с т. пл. 237—238° (с разложением). Выход 3,68 г. (76% теоретич.). Найдено %: N 15,21. C₁₄H₉O₄N₃. Вычислено %: N 14,84.

2-Нафтиловый эфир (VII). Получен аналогично (I) из 2,47 г 2-нафтола. Блестящие иглы с т. пл. 219—220° (с разлож.). Выход 3,65 г (75,3% теоретич.). Найдено %: N 15,16. C₁₄H₉O₄N₃. Вычислено %: N 14,84.

Выводы

Получены фениловый, *о*, *м*, *п*-нитрофениловые, *м*-метилфениловый, 1,2-нафтиловые эфиры 4(5)-нитроимидазол-5(4)-карбоновой кислоты, проведен их анализ и сняты УФ-спектры поглощения.

ЛИТЕРАТУРА

1. Windaus, Langenlen, Ber. 56, 683, 1923.
 2. Л. П. Кулев и А. М. Рожков. ЖОХ, 27, 1389, 1957.
 3. Л. П. Кулев и А. М. Рожков. Авторское свидетельство № 102033, 1955.
 4. Л. П. Кулев и Р. Н. Гирева. ЖПХ, 30, 118, 1957.
-