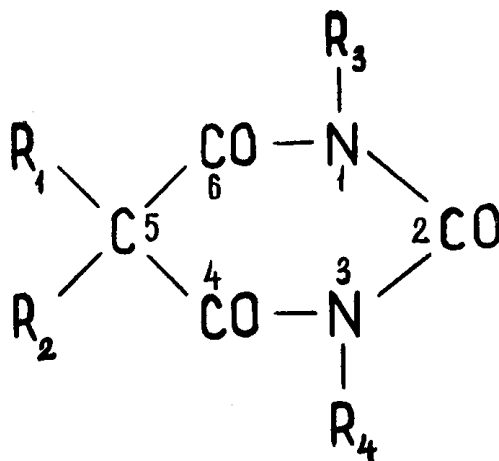


СИНТЕЗ НЕКОТОРЫХ ПРОИЗВОДНЫХ БАРБИТУРОВОЙ КИСЛОТЫ

А. А. ШЕСТЕРОВА, С. Д. ЯРОСЛАВЦЕВА, А. Г. ПЕЧЕНКИН

(Представлена научно-методическим семинаром органических кафедр
химико-технологического факультета)

В предыдущих исследованиях [1, 2] показано, что введение бензоильного радикала к азоту в молекуле 5,5-замещенных барбитуровых кислот приводит к значительному увеличению их противосудорожной активности.

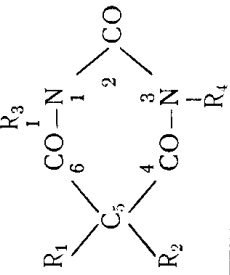


Представляло интерес выяснить влияние различных заместителей в ацильном остатке на противосудорожную активность ацилбарбитуратов. С этой целью мы предприняли синтез некоторых ацилпроизводных барбитуровых кислот, содержащих в ацильном остатке нитрогруппу и галоген. Для получения этих ацилпроизводных барбитуровых кислот в качестве ацилирующего средства использовали хлорангидриды мета-нитробензойной, орто-нитробензойной и пара-хлорбензойной кислот.

Реакцию ацилирования барбитуратов проводили в присутствии пиридина при соотношении реагентов — барбитурат: хлорангидрид кислоты: пиридин = 1 : 1 : 1. Температура реакции 125—130° (масляная баня), продолжительность — 6 часов. По окончании реакции массу закристаллизовывали путем тщательной промывки охлажденной льдом водой и перекристаллизовывали из спирта до постоянной температуры плавления. Все полученные соединения — бесцветные порошки, не растворимые в воде и хорошо растворимые в бензоле, спирте, эфире. Перечень полученных соединений и их некоторые характеристики приведены в таблице.

Следует отметить, что при ацилировании барбитуратов хлорангидридами орто- и мета-нитробензойных кислот не наблюдается образования

Таблица 1

№ п.п.	Название соединения		Брутто-формула	Температура плавления, в °С	Выход чистого продукта, в %	Анализ на N %	
						вычислено	найдено
1	5,5-диэтил-1(3)-мета-нитробензоилбарбитуровая кислота		$C_{15}H_{15}N_3O_5$	182—184	40	12,61	13,00
2	5-этил-5-изоамил-1(3)-мета-нитробензоилбарбитуровая кислота		$C_{18}H_{21}N_3O_5$	102—103	39	11,17	11,55
3	5-этил-5-фенил-1(3)-мета-нитробензоилбарбитуровая кислота		$C_{19}H_{15}N_3O_5$	157—158	42	11,02	11,20
4	5-этил-5-фенил-1(3)-орто-нитробензоилбарбитуровая кислота		$C_{19}H_{15}N_3O_5$	137—139	45	11,02	10,75
5	5-этил-5-фенил-1(3)-пара-хлорбензоилбарбитуровая кислота		$C_{19}H_{15}N_2O_4Cl$	194—196	34	7,56	7,33
6	5-этил-5-фенил-1,3-дипарахлорбензоилбарбитуровая кислота		$C_{26}H_{18}N_2O_5Cl_2$	158—160	14	5,50	5,50
7	5-этил-5-изоамил-1,3-парахлорбензоилбарбитуровая кислота		$C_{18}H_{21}N_2O_4Cl$	140—142	50	7,67	7,83
8	5-этил-5-изоамил-1,3-дипарахлорбензоилбарбитуровая кислота		$C_{25}H_{24}N_2O_5Cl_2$	125—127	15	5,56	5,15

N, N¹ — диацилпроизводных, в то время как при ацилировании (в одинаковых условиях) хлорангидридом незамещенной бензойной кислоты и хлорангидридом парахлорбензойной кислоты диацилпроизводные образуются.

Вывод

Синтезировано и передано для фармакологических испытаний восемь не описанных в литературе N-орто-нитробензоил-, N-мета-нитробензоил- и N-пара-хлорбензоилбарбитуровых кислот.

ЛИТЕРАТУРА

1. Л. П. Кулев, Г. М. Степнова, В. Г. Столярчук, О. Н. Нечаева. ЖОХ, 30, в. 4, 1385, (1960).
 2. Л. П. Кулев, А. А. Шестерова. ЖОХ, 31, в. 4, 1378 (1961).
-