

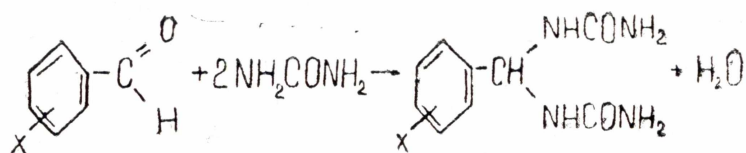
СИНТЕЗ И ФАРМАКОЛОГИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ
НЕКОТОРЫХ ПРОИЗВОДНЫХ БЕНЗАЛЬБИСМОЧЕВИНЫ
и 1-(α -УРЕИДОБЕНЗИЛ)-НАФТОЛОВ-2

А. Г. ПЕЧЕНКИН, Л. И. БУГАЕВА, Э. В. МАСТ, Т. В. МИХАЙЛОВА

(Представлена научно-методическим семинаром органических кафедр ХТФ)

При поисках противосудорожных препаратов нами были синтезированы и проверены на физиологическую активность некоторые производные бензальбисмочевины (I) и 1-(α -уреидобензил)-нафтолов-2 (II).

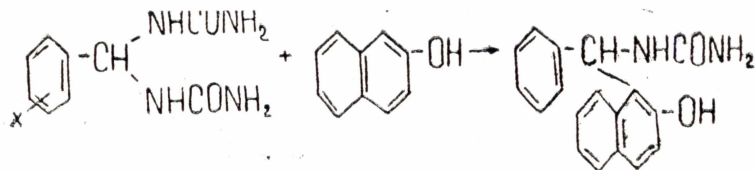
Бензальбисмочевины были получены по описанной ранее методике [1] по следующей схеме:



$x = \text{H}; p\text{-Cl}; p\text{-Br}; o, p\text{-OCH}_3; o, m, p\text{-NO}_2$.

Все соединения представляют собой белые кристаллические вещества, нерастворимые в воде и органических растворителях. Характеристика полученных бензальбисмочевин приведена в табл. 1.

1-(α -уреидобензил)-нафтолы-2 получались конденсацией β -нафтола с бензальбисмочевинами [2, 3].



$x = \text{H}; m, p\text{-NO}_2$.

В реакции конденсации с β -нафтолом использовались все вышеприведенные бензальбисмочевины. Однако в чистом виде выделены только 3 продукта, указанные в схеме реакции. Остальные продукты очистить не удалось.

Экспериментальная часть

1. 0,1 г-моля мочевины растворяли в 50 мл абсолютного спирта, содержащего несколько капель соляной кислоты, к раствору при перемешивании добавляли 0,05 моля бензальдегида и оставляли стоять при комнатной температуре 0,5—3 часа. Осадок отфильтровывали и промывали эфиром и метанолом для удаления бензальдегида, затем водой до отрицательной реакции на мочевины.

Таблица 1

$$R-CH < \begin{matrix} NHCONH_2 \\ NHCONH_2 \end{matrix}$$

R	Т _{пл}	% азота		Выход в %
		выч.	найд	
o—NO ₂ —C ₆ H ₄ —	205—200	27,67	26,93	86,0
p—NO ₂ —C ₆ H ₄ —	172—174	27,67	26,90	50,0
m—NO ₂ —C ₆ H ₄ —	172—174	27,67	27,10	27,2
p—Cl—C ₆ H ₄ —	201—204	23,10	22,90	77,0
p—OCH ₃ —C ₆ H ₄ —	225—226	23,53	22,00	40,0
o—OCH ₃ —C ₆ H ₄ —	230—232	23,53	23,00	42,0
p—Br—C ₆ H ₄ —	236—238	19,51	19,28	70,4
C ₆ H ₅ —	221—225	26,92	27,20	80,0

Сушили на воздухе, определяли температуру плавления, анализировали на азот.

2. 0,05 г-моля β-нафтола и 0,05 г-моля бензальбисмочевины кипятили 2 часа в 25 мл абсолютного спирта с несколькими каплями концентрированной соляной кислоты. По охлаждении выливали в воду, выделившийся осадок отфильтровывали, перекристаллизовывали из спирта с водой (1:1).

1-(α-уреидобензил)-нафтол-2 — белый кристаллический порошок, Т_{пл.} — 182—184° С, N_в 9—62%, N_н 9—73%.

1-(α-уреидо-м-нитробензил)-нафтол-2 — желтый кристаллический порошок, Т_{пл.} — 188—190° С, N_в — 12,46%, N_н — 12,58%.

1-(α-уреидо-п-нитробензил)-нафтол-2 — желтый кристаллический порошок, Т_{пл.} — 155—156° С, N_в — 12,46%, N_н — 12,61%.

Все соединения в противосудорожном отношении оказались неактивными.

ЛИТЕРАТУРА

1. В. П. Мамаев. Диссертация на соискание ученой степени доктора хим. наук. Новосибирск, 1968.
2. В. Ф. Седова, Л. Д. Диканская, В. П. Мамаев. Изв. СО АН СССР, сер. хим. № 3, 98, 1966.
3. В. П. Мамаев, В. М. Игнатьев. Изв. АН СССР, в. 6, 1107, 1965.