

НЕКОТОРЫЕ АЦИЛПРОИЗВОДНЫЕ 1-БЕНЗИЛСЕМИКАРБАЗИДА

А. Г. ПЕЧЕНКИН, И. Г. ФЕДЬКОВА, З. М. МУРАВЬЕВА

(Представлена научно-методическим семинаром
органических кафедр ХТФ)

Используемые в настоящее время в качестве активных противосудорожных средств барбитураты, оксазолидин 2,4-дионы, гидантоины содержат в своей молекуле группировку $R-\overset{\overset{|}{\text{C}}}{\underset{\underset{|}{\text{C}}}{\parallel\text{O}}}-\overset{\overset{|}{\text{N}}}{\text{---}}$, которую сле-

дует считать ответственной за их противосудорожную активность [1].

Для проявления противосудорожной активности важна именно бензамидная часть молекулы (хлоракон) [2].

Н. К. Кочетков и Н. В. Дудыкина нашли, что замещение бензильного остатка в хлораконе на другие группировки полностью снимает противосудорожную активность [3].

Основываясь на работах [4, 5], можно полагать, что наличие гидразиновой группировки обуславливает противосудорожную активность арилгидразидов диарил- и диалкилгликолевых кислот.

Получен целый ряд производных гидразина [6—11], действующих на центральную нервную систему и применяющихся в психотерапии. В результате ряда работ [12—14] найдено, что введение ацильного остатка в молекулу барбитуратов или других производных мочевины значительно увеличивает противосудорожную активность исходных соединений.

Представляло интерес получить ацилпроизводные бензилсемикарбазида общей формулы: $\text{C}_6\text{H}_5\text{CH}_2\text{NH}-\overset{\overset{|}{\text{N}}}{\underset{\underset{\text{O}}{\parallel}}{\text{---}}}-\text{R}$, где R — ацил, в

которых сочетается бензильный радикал с гидразиновой группировкой, и изучить их биологическую активность. Ацилирование проводилось хлорангидами.

Получены шесть ацилпроизводных 1-бензилсемикарбазида, не описанных в литературе, и переданы для испытания на биологическую активность.

Экспериментальная часть

1-бензилсемикарбазид — полупродукт для синтеза ацилпроизводных семикарбазида получен нами по методике, описанной в литературе [15, 16].

1. 1-бензил-4-ацетил-семикарбазид.

В трехгорлую колбу, снабженную холодильником и мешалкой, загружают 5 г 1-бензилсемикарбазида и 100 мл сухого ксилола. Нагревают до 70° С и из капельной воронки прибавляют 4 мл хлористого ацетилла. Реакционную массу нагревают до 110° С и выдерживают приблизительно 2 часа, охлаждают, фильтруют. Белый, плотный порошок перекристаллизовывается из этанола.

Т пл = 204—205° С. Выход 70%

$N_v = 21,35$ $N_n = 20,88$

Остальные пять соединений получены аналогично.

II. 1-бензил-4-пропионил-семикарбазид.

Получен из 5 г 1-бензилсемикарбазида, 3 мл хлористого пропионила, 100 мл сухого ксилола.

Белый порошок, перекристаллизовывается из этанола.

Т пл = 193—194° С. Выход 70%

$C_v = 59,75$ $C_n = 60,15$

$H_v = 6,79$ $H_n = 7,1$

$N_v = 19,02$ $N_n = 19,05$

III. 1-бензил-4-бутирил-семикарбазид.

Получен из 5 г 1-бензилсемикарбазида, 3,2 мл хлористого бутирила, 100 мл сухого ксилола.

Белый порошок, перекристаллизовывается из этанола.

Т пл = 194—195,5° С. Выход 73,3%

$N_v = 17,87$ $N_n = 17,89$

$H_v = 7,21$ $H_n = 7,52$

$C_v = 61,28$ $C_n = 61,51$

IV. 1-бензил-4-изобутирил-семикарбазид.

Получен из 5 г 1-бензилсемикарбазида, 3,2 мл хлористого изобутирила, 100 мл сухого ксилола.

Белый порошок, перекристаллизовывается из этанола.

Т пл = 222—223° С. Выход 69%

$N_v = 17,87$ $N_n = 17,76$

V. 1-бензил-4-валерил-семикарбазид.

Получен из 20 г 1-бензилсемикарбазида, 14,6 г хлористого валерила, 300 мл сухого ксилола.

Белый порошок, перекристаллизовывается из этанола.

Т. пл. = 195—196° С. Выход 73,4%

$N_v = 16,86$ $N_n = 17,31$

VI. 1-бензил-4-изовалерил-семикарбазид.

Получен из 20 г 1-бензилсемикарбазида, 14,6 мл хлористого изовалерила, 300 мл сухого ксилола.

Белый порошок, перекристаллизовывается из этанола.

Т. пл. = 201—202° С. Выход 75,2%

$N_v = 16,86$ $N_n = 17,27$.

ЛИТЕРАТУРА

1. И. С. Бердинский, В. Э. Колла, З. Г. Зубова. Замещенные гидразиды оксикарбоновых кислот. Ученые записки Пермского гос. ун-та, 2, 1963.
2. S. Kushner, B. Cassel, I. H. Morton, I. H. Williams, J. Org. Chem., 16, 8, 1823 (1951).

3. Н. К. Кочетков, Н. В. Дудыкина. Некоторые *N*-замещенные β -хлорпропиоамиды, ЖОХ, 27, 1899, 1957.
4. В. Э. Колла, З. Г. Зубова. Фармакология и токсикология, 3, 287, 1964. «Противосудорожное действие арилгидразидов замещенных гликолевых кислот».
5. В. Э. Колла. Химическое строение, противосудорожная активность и токсическое действие арилгидразидов замещенных гликолевых кислот. Изв. естественно-научного ин-та при Пермском гос. ун-те им. А. М. Горького, 14, 7, 1964.
6. Швейцарский пат., 377842, РЖХ, 1966, 12Н243П.
7. Английский пат., 869575, РЖХ, 1962, 8Л314.
8. Английский пат., 981460, РЖХ, 1962, 15Н248П.
9. Пат. США, 3129259, РЖХ, 1966, 15Н236П.
10. Швейцарский пат., 377840, РЖХ, 1966, 9Н245П.
11. Австралийский пат., 247366, РЖХ, 1966, 16Н250П.
12. Л. П. Кулев, Г. М. Степнова, В. Г. Столярчук, О. Н. Нечаева. Ацилпроизводные барбитуровой кислоты. ЖОХ, 30 (ХСП).
13. Л. П. Кулев, А. А. Шестерова. Ацилпроизводные барбитуратов, гексамидина и дифенилгидантоина. ЖОХ, 27, 1399, 1957.
14. Н. С. Добычина. Синтез и исследование *N*, *N*¹-замещенных мочевины. Диссертация, Томск, 1966.
15. A. von Baeyer, Ber., 27, 1918 (1894).
16. Kessler, Rupe, Ber., 45, 26, «1-Benzilsemicarbazide».