

ПИРАЗОЛИЛАМИДЫ ТОЛУИЛОВЫХ КИСЛОТ

Г. М. СТЕПНОВА, Е. В. ШМИДТ, Л. П. ЕРМОЛАЕВА, Н. С. ГРИГОРЕВСКАЯ

(Представлена научным семинаром химико-технологического факультета)

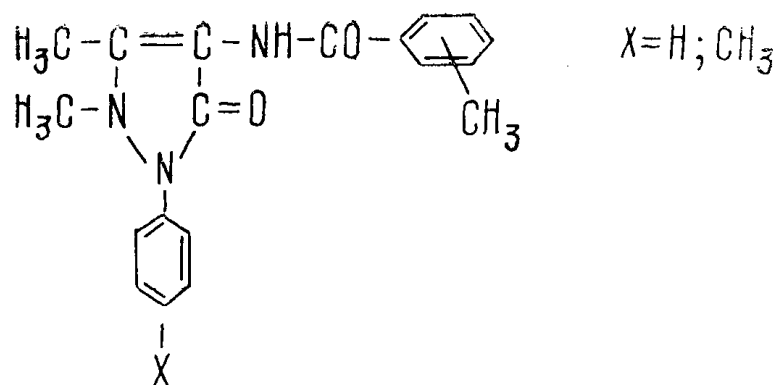
Ранее нами синтезировано и изучено большое количество ацилпроизводных 4-аминоантипирина и N-алкил-4-аминоантипиринов [1—6].

Как показали фармакологические испытания, соединения этого типа обладают противовоспалительной, жаропонижающей и болеутоляющей активностью. Некоторые из них при этом превосходят антипирин и бутадион.

При выявлении зависимости между физиологической активностью и химическим строением пиразолиламидов было установлено, что введение метильного радикала в амидную группу усиливает физиологическое действие соединения.

В связи с этим представляло интерес проследить влияние метильной группировки атомов на терапевтические свойства при наличии ее в фенильном радикале, находящемся в положении 1 пиразолонового цикла и в кислотном остатке.

С этой целью в настоящей работе нами синтезированы ацилпроизводные 4-амино-5-пиразолонов общей формулы



В качестве ацилирующих агентов выбраны изомеры толуиловых кислот, которые сами обладают некоторой противовоспалительной активностью.

Ацилирование вели кислотами в присутствии треххлористого фосфора в среде ксилола при кипячении в течение 2 часов, свойства синтезированных соединений приведены в таблице.

Таблица 8

Свойства синтезированных амидов

№ п.п.	Название соединения	Выход, %	Т. пл. °C	Брутто-формула	% азота	
					вычислено	найдено
1	Толпириламид 2-толуиловой кислоты	60	186	$C_{20}H_{21}O_2N_3$	12,53	12,64
2	Толпириламид 3-толуиловой кислоты	50	130	»	12,53	12,84
3	Толпириламид 4-толуиловой кислоты	60	199	»	12,53	12,73
4	Антипириламид 2-толуиловой кислоты	65		$C_{19}H_{19}O_2N_3$	13,08	13,23
5	Антипириламид 3-толуиловой кислоты	70	171—172	»	13,08	13,13
6	Антипириламид 4-толуиловой кислоты	60		»	13,08	13,23

Вывод

Синтезировано 6 не описанных в литературе пиразолиламидов толуиловых кислот с возможной противовоспалительной активностью.

ЛИТЕРАТУРА

1. Л. П. Кулев, Г. М. Степнова. Изв. СО АН СССР, № 5, 73, 1960.
 2. Л. А. Шаброва, Г. М. Степнова. ЖВХО им. Д. И. Менделеева, IX, № 2, 240, 1964.
 3. Г. М. Степнова, Е. В. Шмидт. ЖВХО им. Д. И. Менделеева, X, № 3, 358, 1965.
 4. Г. М. Степнова, Е. В. Шмидт. Изв. вузов СССР, химия и химич. техн., VIII, № 3, 520, 1965.
 5. Л. А. Шаброва, Г. М. Степнова. Химия гетероциклич. соед., № 1, 135, 1967.
 6. Г. М. Степнова, Л. А. Шаброва, Н. С. Почкунина. Изв. ТПИ (в печати).
-