

Исабаева Меруерт Бердешевна

АМИНОМЕТИЛИРОВАНИЕ ТИОМОЧЕВИНЫ И АЦЕТИЛТИОМОЧЕВИНЫ ВТОРИЧНЫМИ АМИНАМИ

Адрес статьи: www.gramota.net/materials/1/2010/9/17.html

Статья опубликована в авторской редакции и отражает точку зрения автора(ов) по рассматриваемому вопросу.

Источник

Альманах современной науки и образования

Тамбов: Грамота, 2010. № 9 (40). С. 60-62. ISSN 1993-5552.

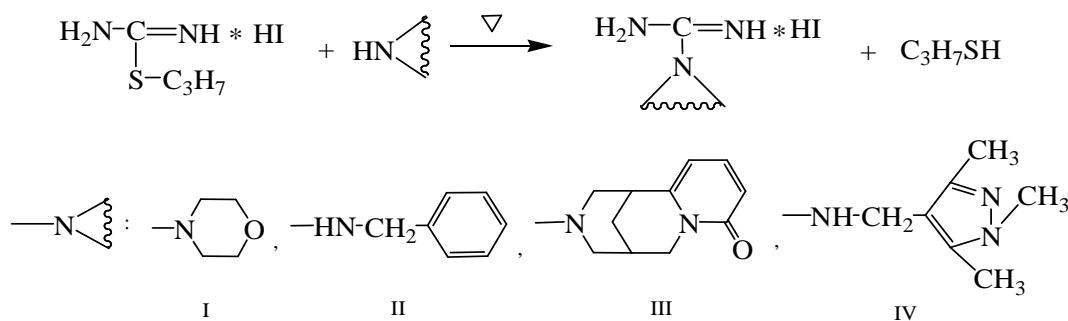
Адрес журнала: www.gramota.net/editions/1.html

Содержание данного номера журнала: www.gramota.net/materials/1/2010/9/

© Издательство "Грамота"

Информация о возможности публикации статей в журнале размещена на Интернет сайте издательства: www.gramota.net

Вопросы, связанные с публикациями научных материалов, редакция просит направлять на адрес: almanac@gramota.net



Синтезированные соединения (I-IV) представляют собой белые кристаллические вещества, которые хорошо растворимы в воде и практически не растворимы в органических растворителях.

ИК-спектры получены на приборе AVATAR-320 в таблетках KBr. Температуры плавления определяли на приборе Voetius. Контроль за ходом реакции осуществляли с помощью ТСХ на пластинках Silufol UV-254.

Список литературы

1. Грандберг Я. И. Общая органическая химия. М., 1985. Т. 8. С. 429-480.
2. Граник В. Г. Основы медицинской химии. М.: Вузовская книга, 2001. 384 с.
3. Иванский В. И. Химия гетероциклических соединений. М.: Высш. школа, 1978. 559 с.
4. Ким Д. Введение в химию гетероциклических соединений // СОЖ. 2001. № 11.
5. Лукевиц Э., Игнатович Л. Гетероциклы на мировом рынке лекарственных средств. Рига: Институт органического синтеза, 1992. 40 с.
6. Машковский М. Д. Лекарственные средства: в 2-х т. М.: Медицина, 2000.
7. Общая органическая химия / пер. с англ.; под ред. Л. И. Беленького. М.: Химия, 1985. 481 с.
8. Органикум / пер. с нем. М.: Мир, 1979. Т. 1. 453 с.
9. Смирнова Н. С., Плотников О. П., Виноградов Н. А., Сорокин В. В., Кривенько А. П. // Хим. фарм. журнал. 1995. № 1. С. 44.
10. Солдатенков А. Т., Колядина Н. М., Шендрик И. В. Основы органической химии лекарственных веществ. М.: Химия, 2001. 192 с.
11. Тюкавкина Н., Бауков Ю. Биоорганическая химия. М., 1985.
12. Химическая энциклопедия. М.: БРЭ, 1995. Т. 4. 1112 с.

УДК 547.496.3; 547.879

Меруерт Бердешевна Исабаева

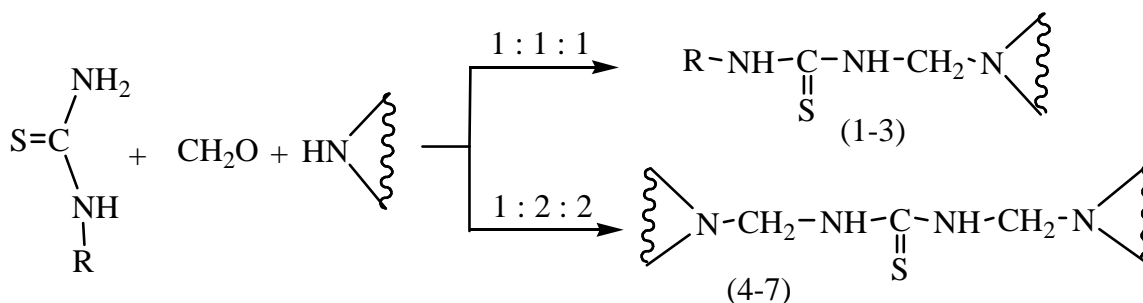
Карагандинский государственный технический университет

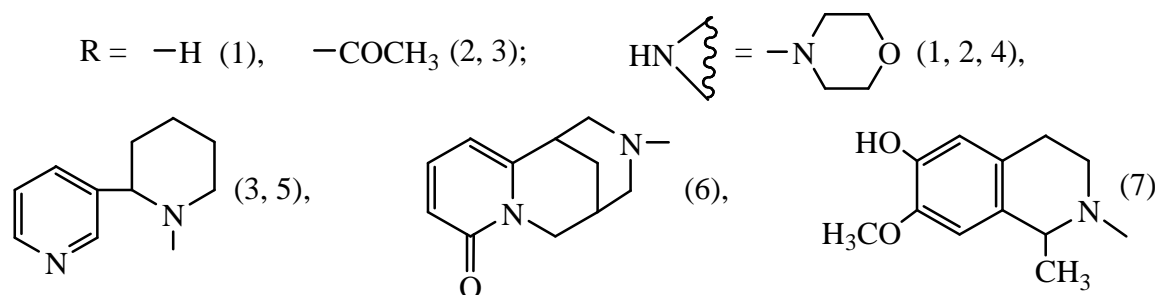
АМИНОМЕТИЛИРОВАНИЕ ТИОМОЧЕВИНЫ И АЦЕТИЛТИОМОЧЕВИНЫ ВТОРИЧНЫМИ АМИНАМИ[©]

Тиомочевинные производные обладают ценными фармакологическими свойствами, проявляют инсектицидную, фунгицидную и другие виды биологической активности [1; 2; 3; 6].

Аминометилирование соединений с подвижным атомом водорода действием формальдегида и аммиака или аминов – реакция, открытая Маннихом - широко применяется в органическом синтезе, особенно в синтезе природных веществ и фармакологических препаратов [4].

Для аминометилирования тиомочевины и ее N-ацилпроизводного по Манниху были выбраны биогенные амины, такие как морфолин, анабазин, цитизин и сольсолин. В зависимости от соотношения реагентов можно получить моно- и ди- замещенные тиомочевины [5]:





Реакция аминотетирования при использовании в роли аминного компонента морфолина протекает в «мягких» условиях: без применения катализирующих количеств кислоты и при комнатной температуре. В случае остальных аминов в качестве катализатора было применено небольшое количество соляной кислоты, и смесь нагревали до температуры кипения течение 2-3 часов. В этих случаях вместо водного раствора формальдегида - формалина был применен его низкомолекулярный полимер - параформ.

Нами было изучено влияние растворителя на выход продуктов реакции и установлено, что при использовании в качестве растворителя спирта выход продуктов выше, чем в случае использования воды. Но из-за малой растворимости тиомочевин и ацетилтиомочевин в спирте, а также высокой летучести формальдегида при повышении температуры, хорошие выходы продуктов наблюдаются при применении водно-спиртовой смеси при соотношении 1:1.

Полученные новые тиомочевинные производные (1-7), содержащие в структуре молекулы остатки биогенных аминов, могут быть интересными в изучение влияния закономерности «структура-активность».

Синтезированные соединения (1-7) представляют собой белые кристаллические вещества, хорошо растворимые в органических растворителях. Состав, строение и индивидуальность синтезированных соединений (1-7) доказаны данными элементного анализа, ИК-, ПМР-спектроскопии, тонкослойной хроматографии. Физико-химические константы соединений (1-7) приведены в Табл. 1.

В ИК спектрах всех синтезированных веществ (1-7) имеются слабые полосы поглощения в области 1230-1210 см⁻¹ соответствующие валентным колебаниям C=S группы, а также проявляются полосы поглощения в области 1510-1460 см⁻¹ в виде пика средней интенсивности обусловленные валентными колебаниями NH групп.

Табл. 1. Выходы, физико-химические константы и данные элементного анализа продуктов аминотетирования тиомочевин и ацетилтиомочевин

№ соед.	Выход, %	Т.пл., °С	Rf1	Найдено, %			Брутто-формула	Вычислено, %		
				С	Н	Н		С	Н	Н
1	87,7	141-142	0,60	41,07	7,51	24,03	C ₆ H ₁₃ N ₃ O ₃ S	41,12	7,48	23,98
2	65,4	175-176	0,64	48,15	7,94	20,59	C ₁₁ H ₂₂ N ₄ O ₂ S	48,15	8,08	20,42
3	75,6	144-145	0,58	44,22	7,11	19,56	C ₈ H ₁₅ N ₃ O ₂ S	44,22	6,96	19,34
4	60,3	90-95	0,73	57,57	7,00	19,34	C ₁₄ H ₂₀ N ₄ O ₃ S	57,51	6,89	19,16
5	48,2	205-206	0,67	65,23	7,75	19,72	C ₂₃ H ₃₂ N ₆ S	65,06	7,60	19,79
6	62,9	181-182	0,63	62,55	6,83	17,60	C ₂₅ H ₃₂ N ₆ O ₂ S	62,47	6,71	17,49
7	50,4	155-156	0,47	61,64	6,98	12,03	C ₂₅ H ₃₄ N ₄ O ₄ S	61,70	7,04	11,51

Примечание - элюент - ИПС : NH₃ : H₂O = 7 : 2 : 1

Список литературы

1. Вацуро К. В., Мищенко Г. Л. Именные реакции в органической химии. М.: Химия, 1976. 528 с.
2. Газалиев А., Исабаева М., Ибатаев Ж. Тиомочевина в реакции Манниха // Поиск-Изденіс. Серия естественных и технических наук. Алматы, 2008. № 4. С. 28-30.
3. Животова Т. С., Газалиев А. М., Айтпаева З. К. Синтез и строение циклических тиомочевин на основе некоторых диаминов // Изв. НАН РК. Сер. хим. 2004. № 4. С. 31-33.
4. Коваль И. В. Синтез, строение и физико-химические свойства тиолов // ЖОрХ. 2005. Т. 41. № 5. С. 647-664.
5. Методы органической химии / пер. с нем.; под ред. В. М. Родионова. М.: ОНТИ. Т. 3. 677 с.
6. Общая органическая химия / пер. с англ.; под ред. Л. И. Беленького. М.: Химия, 1983. Т. 5. 481 с.

УДК 547.496.3; 547.879

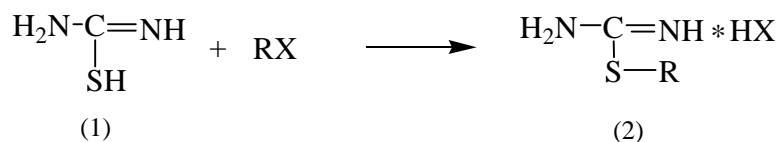
Меруерт Бердешевна Исабаева

Карагандинский государственный технический университет

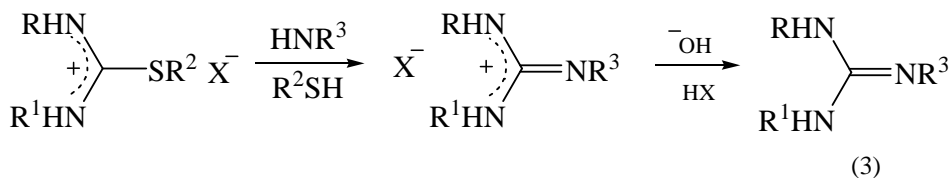
О БИОЛОГИЧЕСКОЙ АКТИВНОСТИ ПРОИЗВОДНЫХ ГУАНИДИНА[©]

Производные гуанидина широко распространены в природе. Они выделены из различных объектов животного и растительного происхождения, например мускулов, крови и мочи животных, листьев и плодов растений, из бактерий и т.п. Доказано, что производные гуанидина играют важную роль в процессе жизнедеятельности как животного, так и растительного организмов и являются необходимыми продуктами обмена живой клетки [3]. Биологическая важность соединения гуанидина видна хотя бы на примере таких производных гуанидина, как аргинин и креатин [2].

Тиомочевина и ее производные, поставляющими в состав синтезируемой молекулы группу -C(NH)NH₂, являются удобными синтонами в синтезе гуанидинов. Гидрогалогениды S-алкилтиомочевины или изотиоурониевые соли (2) легко образуются при добавлении соответствующего алкилгалогенида к тиомочевине (1) [1]. Пропил- и бутилгалогениды дают хорошо кристаллизующиеся соли:



S-алкилизотиоурониевые соли легко омыляются основаниями с образованием соответствующего гуанидинового производного (3) и меркаптана:



По этой схеме нами проведен аминолиз S-алкилизотиоурониевых солей. Алкильный радикал уходит в составе меркаптана, поэтому выбор S-алкилизотиоурониевой соли определялся кристаллизуемостью, стойкостью и чистотой соли. Кристаллизуемость соли увеличивается при увеличении длины радикала, а стойкие и чистые продукты выделялись при использовании бромпроизводных. Очень длинные радикалы образуют высококипящие меркаптаны, которые трудно удаляются из реакционной смеси. Поэтому, для аминолиза брались пропил- и бутилбромиды.