

УДК 547.583.5.

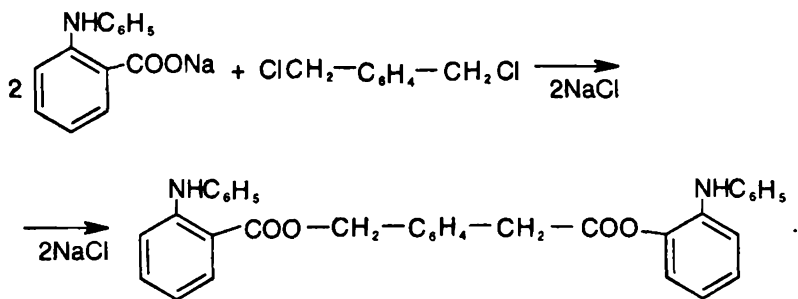
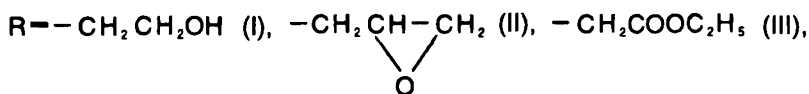
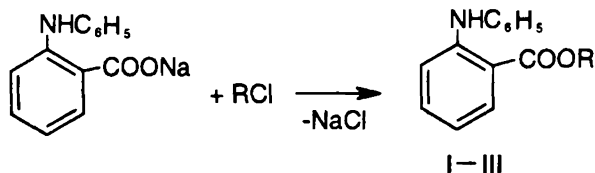
Э.Г. МЕСРОПЯН, Г.Б. АМБАРЦУМЯН, А.А. АВETИСЯН, М.Г. САРКИСЯН

### СИНТЕЗ НОВЫХ ПРОИЗВОДНЫХ N-ФЕНИЛАНТРАНИЛОВОЙ КИСЛОТЫ

Взаимодействием натриевого производного N-фенилантраниловой кислоты с этиловым эфиром монохлоруксусной кислоты, эпихлоргидрином, этиленхлоргидрином и 1,4-ди(хлорметил)бензолом синтезирован ряд новых производных N-фенилантраниловой кислоты – потенциально биологически активные вещества.

Производные антраниловой кислоты нашли широкое применение во многих отраслях народного хозяйства, в медицине и технике. Из производных антраниловой кислоты наиболее широкое применение имеет N-фенилантраниловая кислота, на базе которой получают акридон, акрихин, желтый риванол [1] и т.д.

В продолжение исследований по синтезу новых производных N-фенилантраниловой кислоты [2–4] изучено взаимодействие 1,4-ди(хлорметил)бензола, этиленхлоргидрина, эпихлоргидрина и этилового эфира монохлоруксусной кислоты с натриевой солью N-фенилантраниловой кислоты:



Изучено влияние факторов на ход реакции и на выход полученных продуктов. В результате разработаны оптимальные условия проведения реакции.

Установлено, что выходы продуктов наибольшие, когда реакцию проводят в среде апротонного растворителя – диметилформамиде при эквимольном соотношении реагентов, а в случае 1,4-ди(хлорметил)бензола – при соотношении [N-фенилантраниловая кислота]:[1,4-ди(хлорметил)бензол] = 2:1.

**Экспериментальная часть.** ИК-спектры сняты на приборе ИК-20, спектры ПМР регистрировались на приборе Tesla BS 497 (100 МГц), растворитель  $\text{CDCl}_3$ , внутренний стандарт – ГМДС.

Индивидуальность и чистоту полученных соединений контролировали методом ТСХ на пластинках «Silufol UV-254» в системе четыреххлористый углерод – хлороформ (3:2), проявляли парами йода.

**$\beta$ -Оксиэтиловый эфир N-фенилантраниловой кислоты (I).** К 0,02 моль натриевой соли N-фенилантраниловой кислоты, растворенной в 25 мл абсолютного диметилформамида, добавляют 0,02 моль этиленхлоргидрина. Смесь нагревают на кипящей водяной бане 6–7 часов. После удаления осадка и растворителя остаток промывают этанолом, в котором растворяются непрореагировавшие исходные вещества. Образованные кристаллы промывают диэтиловым эфиром и сушат.

Полученное кристаллическое вещество коричневого цвета хорошо растворимо в хлороформе, диоксане, четыреххлористом углероде, плохо – в холодном этаноле, диэтиловом эфире, диметилсульфоксиде, нерастворимо в воде.

ИК-спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 1600 (Ar); 1730 (C=O); 3100–3600 (OH).

Спектр ПМР,  $\delta$ , м.д.: 7,6–7,4 м (5H, Ar); 8,2–8,4 м (4H, Ar); 9,3 с (NH).

**Глицидиловый эфир N-фенилантраниловой кислоты (II).** К 0,02 моль натриевой соли N-фенилантраниловой кислоты в 30 мл абсолютного диметилформамида добавляют 0,02 моль эпихлоргидрина. Смесь нагревают на кипящей водяной бане 5 часов. После удаления осадка и растворителя остаток перегоняют в вакууме, собирая фракцию, кипящую при температуре 144–150°C/2 мм рт.ст., выход 50%.

ИК-спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 1605 (Ar); 1730 (C=O). Спектр ПМР,  $\delta$ , м.д.: 6,7–8,1 сл. м (9H, Ar); 4,2 к (2H,  $-\text{OCH}_2$ ); 2,7 м (1H,  $-\text{CHOCH}_2$ ), 3,1 м (2H,  $-\text{CHOCH}_2$ ).

**1-(N-Фениламинобензоил)-этиловый эфир уксусной кислоты (III).** К 0,02 моль натриевой соли N-фенилантраниловой кислоты в 30 мл абсолютного диметилформамида добавляют 0,02 моль этилового эфира монохлоруксусной кислоты.

Смесь нагревают на кипящей водяной бане 3 часа. После удаления осадка и растворителя к остатку добавляют абсолютный эфир. Целевой продукт осаждается, а исходные реагенты растворяются в эфире. Целевой продукт перегоняют в вакууме, собирая фракцию, кипящую при температуре 150–155°C/2 мм рт.ст., выход 50%.

ИК-спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 1610 (Ar); 1730 (C=O). Спектр ПМР,  $\delta$ , м.д.: 6,8–8,2 м (9H, 2Ar); 4,2 к (2H,  $-\text{OCH}_2$ ); 1,2 т (3H,  $\text{CH}_3$ ).

**1,4-Бис(N-фениламинобензоилметил)бензол (IV).** К 0,02 моль натриевой соли N-фенилантраниловой кислоты в 50 мл абсолютного диметилформамида добавляют 0,01 моль 1,4-ди(хлорметил)бензола. Смесь нагре-

вают на кипящей водяной бане 7 часов. После удаления осадка и растворителя к остатку добавляют воду, в которой целевой продукт не растворяется. Полученное вещество IV кристаллическое, коричневого цвета, с температурой плавления 141–145°C (этанол). Хорошо растворяется в бензоле, диоксане, хлороформе, четыреххлористом углероде, плохо – в этаноле и диметилформамиде, не растворяется в воде и диэтиловом эфире.

ИК-спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 1600 (Ar); 1730 (C=O), 3520 (NH). Спектр ПМР,  $\delta$ , м.д.: 6,7–8,2 м (22H, Ar); 4,1 к (4H, -OCH<sub>2</sub>).

Кафедра органической химии

Поступило 20.01.2000

## ЛИТЕРАТУРА

1. Несмеянов А.Н., Несмеянов Н.А. Начала органической химии. М., 1974, т.2, с.170.
2. Месропян Э.Г., Амбарцумян Г.Б., Мартиросян Э.В., Оганесов А.С. – Уч. записки ЕГУ, 1982, №3, с.111.
3. Месропян Э.Г., Мартиросян Э.В., Амбарцумян Г.Б., Галоян Л.А., Аветисян А.А. – Арм. хим. ж., 1991, т.45, №6, с.383.
4. Месропян Э.Г., Мартиросян Э.В., Амбарцумян Г.Б., Казинян Г.А., Аветисян А.А. – Арм.хим.ж., 1994, т.48, №1, с.93.

Է.Գ.ՄԵՍՐՈՊՅԱՆ, Գ.Բ.ՀԱՄԲԱՐՏՈՒՄՅԱՆ, Ա.Ա.ԱՎԵՏԻՍՅԱՆ, Մ.Հ.ՍԱՐԳՍՅԱՆ

N-ՖԵՆԻԼԱՆՏՐԱՆԻԼԱԹԹՎԻ ՆՈՐ ԱԾԱՆՑՅԱԼՆԵՐԻ ՍԻՆԹԵԶ

### Ամփոփում

Սինթեզել ենք ֆենիլանտրանիլաթթվի մի շարք ածանցյալներ՝ փոխազդեցության մեջ դնելով N-ֆենիլանտրանիլաթթվի նատրիումական աղը մոնոքլորաքացալաթթվի էթիլէսթերի, էպիքլորհիդրինի, եթիլենքլորհիդրինի և 1,4-դի(քլորմեթիլ)բենզոլի հետ:

E.G.MESROPYAN, G.B.HAMBARTSOUMYAN,  
A.A.AVETISYAN, V.H.SARKISYAN

## SYNTHESIS OF N-PHENYLANTRANLYLIC ACID'S NEW DERIVATIVES

### Summary

By interaction of sodium derivatives of N-phenylantranlylic acid with ethyl ester of monochloroacetic acid, epychlorhydrine, ethylenchlorhydrine and 1,4-di(chlormethyl) benzol the new derivatives of N-phenylantranlylic acid have been synthesized.