

СИНТЕЗ ЕСТЕРІВ

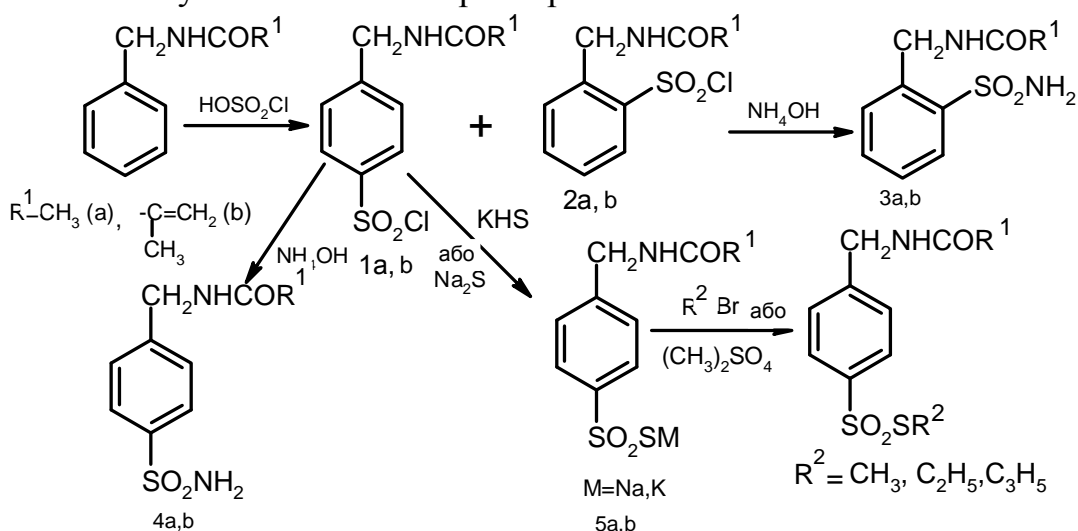
4-АЦЕТИЛАМІНОМЕТИЛБЕНЗОЛТІОСУЛЬФОКИСЛОТ

Н.Я. Монька Г.М. Хоміцька, Г.Б. Шиян, Д.Б. Баранович,
Ю.А. Копельців, В.І. Лубенець, В.П. Новіков

Національний університет „Львівська політехніка”, 79013, м. Львів, вул. С. Бандери, 12,
vnovikov@polynet.lviv.ua, vlubenets@gmail.com

Відомо, що 4-амінометилбензолсульфаміди, заміщені по аміногрупі, в тому числі ацилпохідні, проявляють фізіологічну активність, в тому числі на відміну від відомих сульфаниламідів, вони пригнічують аеробні бактерії, а їх солі є антибактеріальними препаратами широкого спектру дії. Зокрема солі 4-амінометилбензолсульфаміду широко вивчаються за кордоном для лікування опікових інфекцій. Тому перспективним є синтез невідомих раніше естерів 4 – N- ациламінометилбензолтіосульфокислот.

Вихідною сполукою для синтезу естерів ми використовували бензиламін, який ацилювали оцтовим ангідридом або метакрилоїлхлоридом. Постадійно синтез естерів 4- N-ациламінометилбензолтіосульфокислот можна представити наступною схемою перетворень:



При сульфохлюванні N-бензилацетиаміду і N-бензилметакрилоїламіду були отримані суміші орто- та пара-сульфохлоридів, кожен з яких був виділений у чистому вигляді. Для підтвердження будови виділених сульфохлоридів дані ізомери дією аміаку перетворювали у відповідні 4-N-ацетиламінометилбензолсульфаміди та 2-N-ацетиламінометилбензолсульфаміди.

Індивідуальність отриманих ізомерних сульфохлоридів підтверджена методом ТШХ, ІЧ- та ЯМР-спектроскопією і даними елементного аналізу.

Для синтезу естерів тіосульфокислот досліджено окисно-відновну взаємодію пара-ізомерних сульфохлоридів (1a,b) з водними розчинами калію гідросульфіді та натрію сульфіді з утворенням відповідних солей тіосульфокислот (5a,b), які були використані для синтезу нових перспективних біологічно активних естерів тіосульфокислот, для яких проведено прогнозований скринінг за програмою PASS, та експериментально встановлено достатньо високу антимікробну активність до ряду бактерій та грибів.