



Государственный комитет
СССР
по делам изобретений
и открытий

О П И С А Н И Е ИЗОБРЕТЕНИЯ

К АВТОРСКОМУ СВИДЕТЕЛЬСТВУ

(61) Дополнительное к авт. свид-ву -

(22) Заявлено 19.10.77 (21) 2534881/23-04

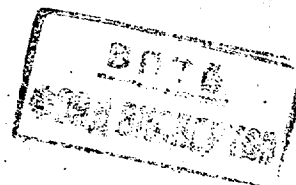
с присоединением заявки № -

(23) Приоритет -

Опубликовано 25.05.80. Бюллетень № 19

Дата опубликования описания 25.05.80

(11) 735593



(51) М. Кл.²

C 07 D 513/04//
A 01 N 9/22
A 61 K 31/44
C 08 F 28/00

(53) УДК 547.789.61'
'83.07(088.8)

(72) Авторы
изобретения

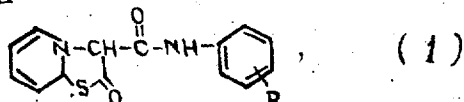
Ю.В.Светкин, Г.И.Дружинина, А.Ю.Светкин и Г.П.Бойко

(71) Заявитель

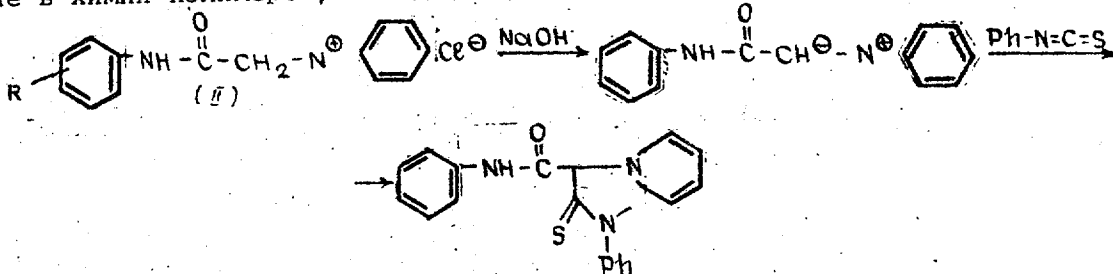
Днепропетровский химико-технологический институт
им. Ф.Э.Дзержинского

(54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ 2-ОКСО-3-АРИЛКАРБАМОИЛТИАЗОЛИДИНО-
-[3,2-a]-1,2-ДИГИДРОПИРИДИНОВ

Изобретение относится к новому способу получения новых соединений 2-оксо-3-арилкарбамоилтиазолидино-[3,2-a]-1,2-дигидропиридинов общей формулы



где R - водород, метил или метокси-группа, которые могут найти применение в химии полимеров, как диеновые



Однако этим способом нельзя получить соединения формулы I.

Целью изобретения является расширение сырьевой базы соединений, которые могут найти применение в различных областях промышленности, медицине и сельском хозяйстве.

мономеры на основе пиридинового цикла, в медицине как аналоги стрихнина, секурина и в сельском хозяйстве.

Известен способ получения 1-фенил-2-тио-3-арилкарбамоилимидазолидино-[3,2-a]-1,2-дигидропиридинов [1], заключающийся в том, что фенилтиоцианат подвергают взаимодействию с N-(N-фенилкарбамоилметил)-пиридиний хлоридом.

Реакция проходит по схеме

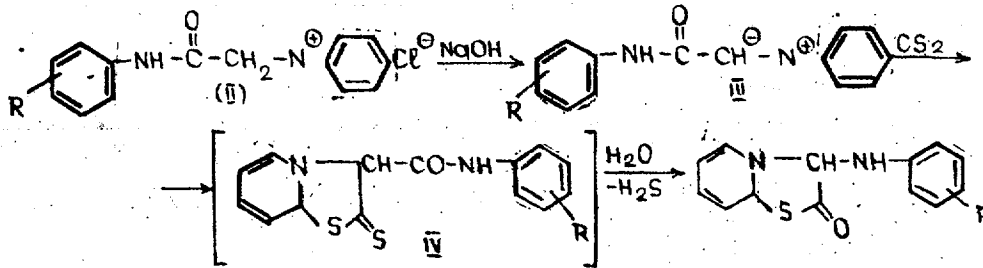
Это достигается предлагаемым способом, который заключается в том, что соединение формулы II подвергают взаимодействию с сероуглеродом в присутствии щелочи в среде растворителя. В качестве растворителя предпочтительно используют этиловый

25

30

спирт. Взаимодействие указанных соединений происходит через 2-тио-3-(арилкарбамоил)-тиазолидино [3,2-а]-1,2-дигидропиридин, который в ус-

ловиях реакции гидролизуется до конечного продукта 2-оксо-3-(арилкарбамоид)-тиазолидино [3,2-а]-дигидропиридина по схеме



Пример 1. В трехгорлую колбу снабженную механической мешалкой, помещают 7,81 г (0,03 г-моля) N-(N-о-толуидилкарбамоилметил)-пиридиний хлорида, 15 мл 2н NaOH, 7,5 г этанола. При перемешивании добавляют к раствору 2,28 г (0,03 г-моля) сероуглерода. Через 3 мин после прибавления сероуглерода начинает выпадать обильный красный осадок. Перемешивают 5 мин. Образовавшийся осадок отфильтровывают, промывают небольшим количеством воды, сушат. Выход 6,74 г (88,8% от теории). Перекристаллизовывают из спирта и получают красные кристаллы, т.пл. 189-190°C.

Найдено, %: С 63,13; Н 5,02; N 10,03; S 11,69.

$C_{14}H_{14}N_2SO$
Вычислено, %: С 63,0; Н 4,90; N 9,78; S 11,17.

Пример 2. К перемешиваемому раствору 5,57 г (0,02 г-моля) N-(N-п-анизилкарбамоилметил)-пиридиний хлорида, 10 мл 2н NaOH и 5 мл спирта прибавляют 1,52 г (0,02 г-моля) сероуглерода. Через 5 мин реакцию прекращают и образовавшийся осадок отфильтровывают, промывают небольшим количеством воды, сушат, выход 5,1 г (84,5% от теории). Перекристаллизовывают из спирта и получают красные кристаллы, т.пл. 163-164°C.

Найдено, %: С 60,0; Н 5,00; N 9,47; S 10,80.

$C_{14}H_{14}N_2O_2$
Вычислено, %: С 59,5; Н 4,62; N 9,25; S 10,56.

Пример 3. В трехгорлую колбу снабженную механической мешалкой помещают 5,23 г (0,02 г-моля) N-(N-п-толуидилкарбамоилметил)-пиридиний хлорида, 10 мл 2 н. NaOH, 5 мл спирта. При перемешивании к раствору прибавляют 1,52 г (0,02 г-моля) сероуглерода. Выпавший осадок отфильтровывают, промывают небольшим количеством воды, сушат. Выход 4,8 г (83,7% от теории). Перекристаллизовывают из спирта и получают красные кристаллы, т.пл. 175-176°C.

Найдено, %: С 63,00; Н 5,17; N 9,84; S 11,0.

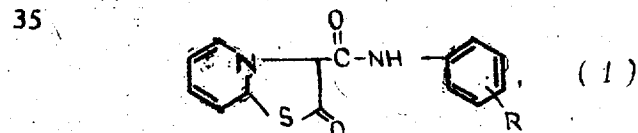
$C_{14}H_{14}N_2OS$
Вычислено, %: С 63,0; Н 4,90; N 9,78; S 11,17.

В ИК-спектрах синтезированных соединений наблюдают полосы поглощения, cm^{-1} 1670-1680 ($\nu C=O$); 1340-1350 ($\nu C-N$); 1610 (νN); 1590 ($\nu C=C$ - кольца пиридина).

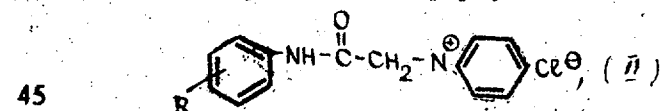
Предлагаемый способ позволит получить новые химические соединения, которые могут найти применение в химии полимеров, медицине и сельском хозяйстве.

30 Формула изобретения

1. Способ получения 2-оксо-3-арилкарбамоилтиазолидино-[3,2-а]-1,2-дигидропиридинов общей формулы



40 где R - водород, метил или метокси-группа, заключенный в том, что соединение формулы



45 где R имеет вышеуказанные значения, подвергают взаимодействию с сероуглеродом в присутствии щелочи в среде органического растворителя.

50 2. Способ по п.1, отличающийся тем, что в качестве органического растворителя используют водный этиловый спирт.

55 Источники информации, принятые во внимание при экспертизе

60 1. Мухаметова Д.Я., Акманова Н.А., Светкин А.Ю., Светкин Ю.В. Циклопри-соединение фенилизотиоцианата к илидам пиридиния. Известия ВУЗов, 1977, т.20, 187.