

N^1 - α -Campholenoyl-p-aminobenzenesulfonamide

及びそのデヒドロ化合物の製造¹⁾

塚本 長太郎

Preparation of N^1 - α -Campholenoyl-p-aminobenzenesulfonamide and its Dihydro Compound.

Tyo-tarō Tukamoto.

従来癩治療に用いられている大風子油の成分である Hydnocarpic Acid, Chaulmoograic Acid は何れも Cyclopenten 核を有する脂肪酸誘導体であるが、樟腦より容易に製造される α -Campholenic Acid も亦 Cyclopenten 核を有する脂肪酸誘導体であるので、癩菌と同じく抗酸菌に属する結核菌に対する α -Campholenic Acid のスルホンアミド誘導体の作用を調べる

ため、これを合成した。動物試験は当大学日置内科学教室に於て α -Campholenic Acid, N^1 - α -Campholenoyl-p-acetylaminobenzenesulfonamide, N^1 - α -Campholenoyl-p-aminobenzenesulfonamide, N^1 -Dihydro- α -Campholenoyl-p-aminobenzenesulfonamide の4種の化合物について行われたが陰性の結果に終つた²⁾。

実験之部

N^1 - α -Campholenoyl-p-acetylaminobenzenesulfonamide: α -Campholenic Acid にチオニルクロリドを作用せしめて得たる酸クロリド (1 モル) をピリジン中 p-Acetylaminobenzenesulfonamide (1, 2 モル) と反応せしめた後、冷後稀塩酸中に投入せば飴状物質の傍ら少量の白色結晶を析出する。この際の白色結晶は未反応の p-Acetylaminobenzenesulfonamide である。飴状物質は長く氷室に放置すると固化するから酒精に溶解し少量の水を加えて放置せば白色結晶を析出する。更に酒精より再結晶を繰り返すと、mp 217° の白色結晶となる。アセトンに易溶、アルコールに熱時易溶、エーテルに難溶にして $KMnO_4$, Br を脱色する。

試料 4.160mg: CO_2 9.100mg. H_2O 2.340
mg. $C_{18}H_{24}O_4N_2S$ 計算値 C 59.34, H

6.59. 実験値 C 59.66, H 6.83.

N^1 - α -Campholenoyl-p-aminobenzenesulfonamide: 上記アセチル化合物を稀アルカリと処理後 HCl を滴下して析出せしめたる白色物質を 60% 酒精より再結晶すると初め油状物を析出するが暫く後に固化する。mp は 160° 過ぎで軟化し 190° 頃透明となる。精製困難なり。

N^1 -Dihydro- α -campholenoyl-p-acetylaminobenzenesulfonamide: α -Campholenic Acid を Pd-炭で接触還元すると容易にデヒドロ化合物が得られる。bp₂₀ 151°. これをチオニルクロリドで処理して酸クロリドにする。bp₃₃ 117° 次にこれをピリジン中 p-Acetylaminobenzenesulfonamide と反応せしめたる物は稀メタノールより再結晶を繰り返すと mp 206° の白色結晶となる。アセトン、アルコールに可溶、エーテ

1) 金沢医科大学結核研究所年報, 第2年発表. 2) 中源作太郎: 金沢医科大学結核研究所年報, 第2年.

ルに難溶にして KMnO_4 , Br に対し安定である。

試料 3.920mg: CO_2 8.500mg, H_2O 2.400mg.

$\text{C}_{18}\text{H}_{20}\text{O}_4$ N_2S 計算値 C 59.02,

H 7.10. 実験値 C 59.14, H 6.85.

N^1 -Dihydro- α -camphenoyl-p-aminobenzene-

sulfonamide: 上記アセチル化合物を稀アルカリと処理後, HCl を滴下して得る白色結晶はメタノール, 酒精, アセトン等に易溶にして精製困難なり. 40° 頃より軟化し始め 95° 頃発泡して熔融する.