

ՀԱՅԱՍՏԱՆԻ ՀԱՆՐԱՊԵՏՈՒԹՅԱՆ ԳԻՏՈՒԹՅՈՒՆՆԵՐԻ  
ԱԶԳԱՅԻՆ ԱԿԱԴԵՄԻԱ  
НАЦИОНАЛЬНАЯ АКАДЕМИЯ НАУК РЕСПУБЛИКИ  
АРМЕНИЯ

Հայաստանի քիմիական հանդես 58, №4, 2005 Химический журнал Армении

УДК 547.233 + 547.263

**СИНТЕЗ НОВЫХ ПРОИЗВОДНЫХ ВИЦИНАЛЬНЫХ АМИНОСПИРТОВ**

**А. С. ГАЛСТЯН**

Ереванский государственный университет

Поступило 20 VII 2004

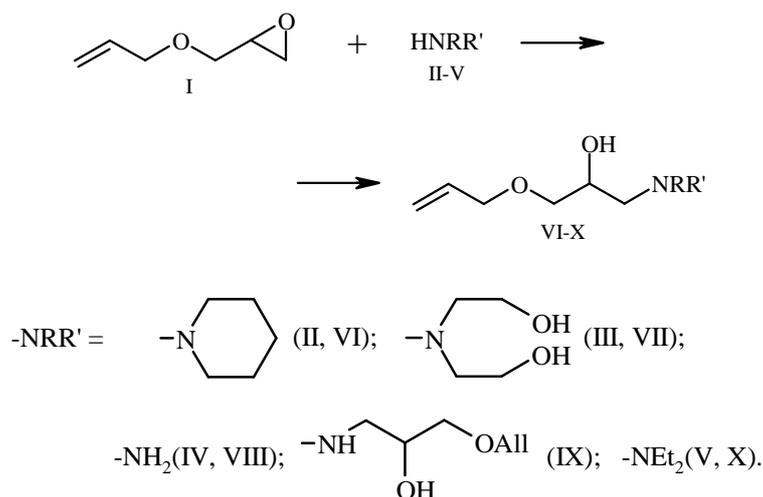
Взаимодействием аллилглицидилового эфира с пиперидином, диэтаноломином, аммиаком и диэтиламином осуществлен синтез 1-N-пиперидино-3-аллилоксипропан-2-ола, 1-N-диэтанолоамино-3-аллилоксипропан-2-ола, 1-амино-3-аллилоксипропан-2-ола, N,N-ди-(2-гидрокси-3-аллилоксипропил-1)амина и 1-N-диэтиламино-3-аллилоксипропан-2-ола.

Табл. 2, библиограф. ссылки 19.

Реакция эпоксидных соединений с аминами важна как один из наиболее удобных методов синтеза вицинальных аминоспиртов, используемых в качестве строительных блоков при конструировании молекул природных и биологически активных органических соединений [1-15]. В число действующих лекарств включены различные вицинальные аминоспирты и их производные по гидроксильной группе и атому азота, проявляющие разнообразную активность [16-18]. Следовательно, синтез новых производных вицинальных аминоспиртов актуален, что обусловлено перспективностью поиска в этом ряду новых биологически активных веществ.

В настоящей работе изучено взаимодействие аллилглицидилового эфира с некоторыми N-нуклеофилами – пиперидином, диэтаноломином, аммиаком и диэтиламином. Исследовано влияние температуры, продолжительности реакции, соотношения исходных компонентов и катализатора на ход реакции, и выявлены оптимальные условия ее проведения.

Установлено, что под действием аминов II-V раскрытие оксидного кольца происходит по правилу Красуского, т.е. гидроксильная группа образуется у наименее гидрогенизированного атома углерода [19], приводя к 1-N-пиперидино-3-аллилоксипропан-2-олу (VI), 1-N-диэтанолоамино-3-аллилоксипропан-2-олу (VII), 1-амино-3-аллилоксипропан-2-олу (VIII), N,N-ди-(2-гидрокси-3-аллилоксипропил-1)амину (IX) и 1-N-диэтиламино-3-аллилоксипропан-2-олу (X) по схеме:



### Экспериментальная часть

Спектры ЯМР  $^1\text{H}$  получены на спектрометре “Mercury-300” (фирмы Varian) с рабочей частотой 300 МГц, растворитель – ДМСО- $d_6$ ; temp = 30°C. ИК спектры сняты на спектрофотометре “Specord 75IR”. Индивидуальность и чистоту полученных соединений контролировали методом ТСХ на пластинках “Silufol UV-254”, проявляли парами йода.

**1-N-Пиперидино-3-аллилоксипропан-2-ол (VI) (и 1-N-диэтиламино-3-аллилоксипропан-2-ол (VII)).** Смесь 8 г (0,07 моля) аллилглицидилового эфира I, 0,21 моля пиперидина (или диэтиламина) и 2 мл этанола перемешивают при комнатной температуре 48 ч. После удаления избытка амина и этанола остаток перегоняют в вакууме (табл. 1, 2).

**1-Амино-3-аллилоксипропан-2-ол (VIII) и N,N-ди-(2-гидрокси-3-аллил-оксипропил-1)амин(IX).** К 137,6 мл (1,5 моля) 20% раствора аммиака при 0°C по каплям прибавляют 8,55 г (0,075 моля) эфира I. Реакционную смесь перемешивают при 0°C 5 ч, затем оставляют при комнатной температуре 48 ч. После удаления аммиака и воды остаток перегоняют в вакууме (табл. 1, 2).

**1-N-Диэтиламино-3-аллилоксипропан-2-ол (X).** К 16,76 г (0,147 моля) эфира I добавляют 32,12 г (0,44 моля) диэтиламина и 2 мл этанола. Реакционную смесь перемешивают при комнатной температуре 72 ч, затем нагревают при 55°C 30 мин. После удаления избытка диэтиламина и этанола остаток перегоняют в вакууме (табл. 1, 2).

## ՎԻՑԻՆԱԼ ԱՄԻՆԱՍՊԻՐՏՆԵՐԻ ՆՈՐ ԱԾԱՆՑՅԱԼՆԵՐԻ ՍԻՆԹԵԶ

Ա. Ս. ԳԱԼՍՏՅԱՆ

Փոխազդեցության մեջ դնելով ալիլգլիցիդային եթերը պիպերիդինի, դիէթանոլամինի, ամոնիակի և դիէթիլամինի հետ սինթեզվել են՝ 1-N-պիպերիդին-3-ալիլօքսիպրոպանոլ-2, 1-N-դիէթանոլամին-3-ալիլօքսիպրոպանոլ-2, 1-ամին-3-ալիլօքսիպրոպանոլ-2, N,N-դի-(2-հիդրօքսի-3-ալիլօքսիպրոպիլ-1)ամին և 1-N-դիէթիլամին-3-ալիլօքսիպրոպանոլ-2:

## THE SYNTHESIS OF NEW DERIVATIVES OF VICINAL AMINOALCOHOLS

A. S. GALSTYAN

Synthesis of 1-N-piperidino-3-alliloxipropanol-2, 1-N-diethanolamino-3-alliloxipropanol-2, 1-amino-3-alliloxipropanol-2, N, N-di-(2-hydroxi-3-alliloxipropyl-1)amin and 1-N-diethylamin-3-alliloxipropanol-2, is carried out of by interaction allilglycidylether with piperidin, diethanolamin, ammonia and diethylamin.

## ЛИТЕРАТУРА

- [1] *Bergmeier S.C.* // Tetrahedron, 2000, v. 56, p. 2561.
- [2] *Karpf M., Trussardi R.J.* // J. Org. Chem., 2001, v. 66, p.2044.
- [3] *Inaba T., Yamada Y., Abe H., Sagawa S., Cho H.* // J. Org. Chem., 2000, v. 65, p. 1623.
- [4] *Cristau H.-J., Pirat J.-L., Drag M., Kafarski P.* // Tetrahedron Lett., 2000, v. 41, p. 9781.
- [5] *Bennet f., Patel N.M., Girijavallabhan V.M., Ganguly A.K.* //Synlett, 1993, v. 9, p. 703.
- [6] *Tucker T.J., Lumma W.c., Payne L.S., Wai J.M., de Solms S.J., Giuliani F.A., Darke P.L., Heimbach J.C., Zugay J.A., Schleif W.A., Quinfero J.C.* // J. Med. Chem., 1992, v. 35, p. 2525.
- [7] *Sun H.-B., Hua W.-Y., Chen L., Peng S.-X., Wang T.L., Lin G.-Q.* // J. Chin. Univ., 1997, v. 18, p.730. РЖХим. 1998 1Ж 176.
- [8] *Bell D., Davies M.R., Finney F.J.L., Geen G.R., Kincey P.M., Mann I.S.* // Tetrahedron Lett., 1996, v. 37, p. 3895.
- [9] *Gnewuch C.T., Sosnovsky G.* // Chem. Rev., 1997, v. 97, p. 829.
- [10] *Hudlicky T., Abbod K.F., Entwisle D.A.,Fan R., Maurya R., Thorpe A.J., Bolonick J., Myers B.* // Synthesis, 1996, №7, p. 897.
- [11] Заявка 19724186(1998), Германия // РЖХим., 2002, 190 116П.
- [12] *Sabitha G., Babu R.S., Rajkumar M., Yadav J.S.*// Org. Lett., 2002, №4, p. 343.
- [13] *Дрюк В.Г., Карцев В.Г., Войцеховская М.А.* Оксираны – синтез и биологическая активность. М., Богородский печатник, 1997, с. 275.
- [14] *Maier M.E., Vobe F., Niestroj A.J.* // Eur. J. Org. Chem., 1999, p. 1.
- [15] *Карцев В.Г., Дрюк В.Г., Глушко Л.П.* Биологическая активность оксиранов (препринт). Черноголовка, 1992, с. 42.
- [16] *Машковский М.Д.* Лекарственные средства. М., Новая волна, 2002, т. 1,2.
- [17] *Швайка Ол.* Основи синтезу лікарських речовин. Донецьк, Східний видавничий дім, 2002, с. 300.
- [18] *Лукевиц Э.Я., Либерт Л.И., Воронков М.Г.* // Успехи химии, 1970, т. 29, с. 2005.
- [19] *Красуский К.А.* // ЖОХ, 1936, т. 6, с. 460.