

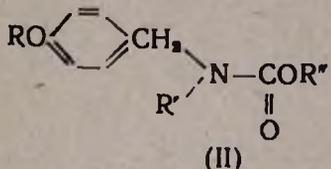
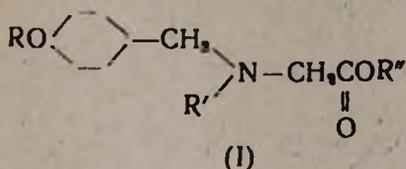
А. Л. Мнджоян, В. Г. Африкян и А. А. Дохикян

Исследования в области аминов и их производных

Сообщение IV. Синтез эфиров фенол-, бензил- и *p*-алкоксибензилалкиламиноуксусных кислот

В первом сообщении [1] был описан ряд *p*-алкоксибензилалкиламинов использованных для синтеза уретанов [2], с целью изучения их способности задерживать развитие злокачественных новообразований

Желая расширить исследования в области производных упомянутых выше вторичных аминов, мы синтезировали эфиры двузамещенных аминоксусных кислот (I) для сравнения их канцеролитических и антимиотических свойств с структурно сходными уретанами (II).



Сравнительная оценка свойств двух типов соединений позволила

бы установить значение карбамидной $\text{>N}-\text{C}(=\text{O})\text{OR}''$ и карбалкиламин-

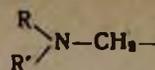
ной $\text{>N}-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})\text{OR}''$ групп при одинаковых заместителях у третичного

азота в обеспечении антимиотического и канцеролитического действия.

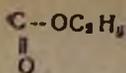
В настоящее время известны многочисленные примеры соединений как природного происхождения, так и полученных синтетическим путем, которые содержат аналогичные группировки и обладают способностью задерживать митоз клеток или рост злокачественных опухолей.

Накопление данных по изучению антимиотических и канцеролитических свойств производных двузамещенных аминов в аспекте связи между строением и действием на наш взгляд может привести к отбору селективно действующих препаратов, в которых в настоящее время нуждается практическая медицина.

Синтез двузамещенных аминоксусных кислот был осуществлен

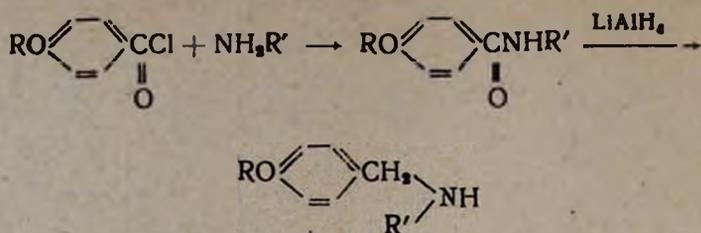


R	R'	Выход в %	Т. кип. в °С	Давление в мм	n_D^{20}	d_D^{20}
<chem>COc1ccc(C)cc1</chem>	CH ₃	76,0	140	3	1,0558	1,5180
<chem>COc1ccccc1C</chem>	C ₂ H ₅	80,0	167	5	1,0429	1,5025
<chem>COc1ccc(C)cc1</chem>	CH ₃	68,0	147—148	3	1,0394	1,5000
<chem>COc1ccc(C)cc1</chem>	C ₂ H ₅	60,3	165	5	1,0269	1,4975
<chem>COc1ccc(C)cc1</chem>	CH ₃	70,2	156	3	1,0177	1,4990
<chem>COc1ccc(C)cc1</chem>	C ₂ H ₅	72,0	175	5	1,0103	1,4980
<chem>COc1ccc(C)cc1</chem>	CH ₃	62,0	150	3	1,0257	1,4970
<chem>COc1ccc(C)cc1</chem>	C ₂ H ₅	50,1	170	5	1,0103	1,6020
<chem>COc1ccc(C)cc1</chem>	CH ₃	60,8	154	3	1,0177	1,4960
<chem>COc1ccc(C)cc1</chem>	C ₂ H ₅	60,0	180	5	0,9817	1,5000
<chem>COc1ccc(C)cc1</chem>	CH ₃	83,0	160	3	1,0121	1,4950
<chem>COc1ccc(C)cc1</chem>	C ₂ H ₅	73,2	174	5	0,9806	1,4550
<chem>c1ccc(C)cc1</chem>	CH ₃	50,0	70	3	1,0675	1,5305
<chem>c1ccc(C)cc1</chem>	C ₂ H ₅	60,0	134	3	1,0362	1,5285
<chem>c1ccc(C)cc1</chem>	CH ₃	53,0	112	3	1,0156	1,5000
<chem>c1ccc(C)cc1</chem>	C ₂ H ₅	65,0	130	3	0,9934	1,4940



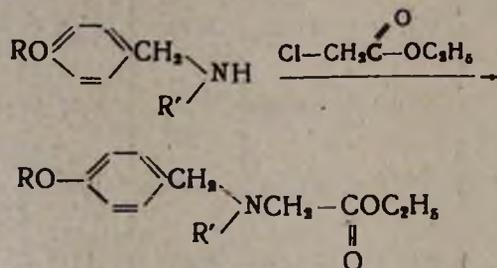
MR _D		А н а л и з в %					
найдеНО	вычис-лено	С		Н		N	
		найдеНО	вычис-лено	найдеНО	вычис-лено	найдеНО	вычис-лено
65,87	66,37	65,82	66,00	8,07	8,30	5,90	5,89
70,48	71,17	66,93	67,09	8,42	8,29	5,57	5,56
70,48	71,01	66,91	66,60	8,40	8,40	5,57	5,41
75,10	75,67	67,90	67,88	8,73	8,77	5,28	5,14
75,10	76,55	67,90	67,46	8,73	8,80	5,28	5,42
79,72	81,05	68,80	68,93	8,30	8,37	5,01	4,90
75,10	75,69	67,90	68,15	8,73	9,11	5,28	5,25
79,72	81,25	68,81	68,94	8,30	8,70	5,01	4,62
79,72	80,34	68,80	69,10	9,02	9,15	5,01	5,39
84,34	87,90	69,62	69,61	9,21	9,36	4,77	4,45
79,12	80,49	68,80	68,68	9,02	9,12	5,01	5,11
84,34	86,73	69,62	69,91	9,21	9,21	4,77	5,03
54,92	55,96	68,39	68,30	7,77	7,89	7,24	7,22
59,60	61,64	69,56	69,73	8,27	8,51	6,76	7,01
59,60	60,24	69,56	69,47	8,27	8,11	6,76	6,66
64,22	64,84	70,59	70,39	8,59	8,56	6,33	6,57

путем взаимодействия хлорангидридов кислот с алкиламинами и восстановлением промежуточных амидов алюмогидридом лития:



Кроме алкоксибензилпроизводных были получены также бензил-алкил- и фенилалкиламины путем восстановления алюмогидридом лития соответствующих амидов бензойной кислоты, форманилида и ацетанилида.

Амины вводились в реакцию с этиловым эфиром хлоруксусной кислоты, образовавшиеся эфиры двузамещенных аминоксусных ки-



слот очищались через хлористоводородную соль.

Способы получения амидов и аминов описаны ранее [2]. В настоящей работе, в экспериментальной части, приводится синтез этилового эфира *p*-метоксибензилметиламиноуксусной кислоты, по примеру которого получены остальные представители этого ряда.

Некоторые физикохимические константы полученных эфиров сведены в таблицу.

Элементарный анализ произведен сотрудниками аналитического отдела А. А. Алоян и Р. А. Мегроян.

Для испытания биологических свойств приготовлены водные растворы, в большинстве своем некристаллизующихся, хлоргидратов и модалкилатов. Данные исследований будут опубликованы отдельно.

Экспериментальная часть

Этиловый эфир p-метоксибензилметиламиноуксусной кислоты. 12,2 г (0,1 моля) этилового эфира хлоруксусной кислоты в 50 мл абсолютного бензола нагревают с 15,1 г (1,5 моля) *p*-метоксибензилметиламина в течение 6—8 часов. По охлаждении отсасывают выпавший в осадок хлоргидрат *p*-метоксибензилметиламина и фильтрат об-

рабатывают 10%-ным раствором соляной кислоты до кислой реакции на конго. Отделяют бензольный слой, промывают его водой и присоединяют к основному продукту; последний насыщают карбонатом натрия, приливают 2—3 мл 10%-ного раствора едкого натра и экстрагируют эфиром. Объединенные эфирные экстракты высушивают над прокаленным сульфатом натрия, отделяют растворитель и остаток перегоняют в вакууме.

В ы в о д

Для испытания канцеролитических и антимиотических свойств синтезировано 16 этиловых эфиров фенол-, бензил-, *n*-алкоксибензил-алкиламиноуксусных кислот, не описанных в литературе.

Институт тонкой органической химии
АН АрмССР

Поступило 25 VI 1958

Ս. Լ. ՄՅԵՈՅԱՆԸ, Վ. Գ. ԱՅԻՐԻԿՅԱՆԸ և Ա. Զ. ԴՈՒԻԿՅԱՆԸ

ՀԵՏԱՀՈՏՈՒԹՅՈՒՆՆԵՐ ԱՄԻՆՆԵՐԻ ԵՎ ՆՐԱՆՑ ԱԾԱՆՑՅԱԼՆԵՐԻ ԲՆԱԳԱՎԱՌՈՒՄ

Հաղորդում IV: Ֆենիլ-, բենզիլ-, և *n*-ալկոքսիբենզիլալկիլամինաքացախակաճ բրուների էսթրների սինթեզը

Ա Մ Փ Ո Փ Ո Ւ Մ

Նախորդ հաղորդումներից մեկում [1] նկարագրված են ալ-ալկոքսիբենզիլալկիլամիններից ստացված մի շարք ուրեթաններ, որոնց ստացման հիմնական նպատակն է ուսումնասիրել այդ միացությունների հակամիտոտիկ և կանցերոլիտիկ հատկությունները:

Ծանկանալով պարզել ուրեթանային խմբի առանձնահատկությունն այս շարքի նյութերի մեջ, մենք նպատակ դրինք ոչ միայն համեմատել նրանց բիոլոգիական հատկությունները ելանյութ բարդ ամինների հատկությունների հետ, այլև սինթեզել այդ նույն ռադիկալները պարունակող այնպիսի երկտեղակալված ամինաքացախաթթուների էսթերներ, որոնք իրենց կառուցվածքով տարբերվեին համապատասխան ուրեթաններից ամինային և կարբոնիլային խմբերի արանքում կանգնած մեթիլենային խմբով:

Այդ հնարավորություն կտար համեմատելու բաղադրությունը շատ մոտ, բայց քիմիական հատկություններով իրարից հեռու նյութերի հատկությունները նամանավանդ, որ բջիջների բաժանումը կամ չարորակ տարբեր ուռուցքների աճը կանխելու ունակություն ցույց տված ինչպես բնական, այնպես էլ սինթետիկ միացությունների շարքում կան նմանորինակ ամինային, ամինաթթվային, ամիդային (ուրեթանային) խմբեր:

Ստացված երկտեղակալված ամինաքացախաթթուների էսթերների մի քանի հատկությունները բնորոշող տվյալները բերված են աղյուսակում:

Մեզ թվում է, որ նմանորինակ ուսումնասիրությունների միջոցով կու-

տակրած տվյալները պետք է որ նախադրյալներ ստեղծեն ընտրողական ազ-
գեցութիւն ունեցող պրեպարատներ ստանալու համար:

Л И Т Е Р А Т У Р А

1. А. Л. Мнджоян, Н. А. Бабиян, А. А. Дохякян, Изв. АН АрмССР, ХН 11, 273 (1958).
2. А. Л. Мнджоян, Н. А. Бабиян, Изв. АН АрмССР, ХН 11, 351 (1958).