

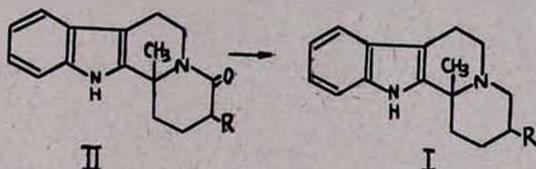
КРАТКИЕ СООБЩЕНИЯ

К ВОПРОСУ О СИНТЕЗЕ ЗАМЕЩЕННЫХ
 4-ОКСО-ОКТАГИДРОИНДОЛО(2,3-а)ХИНОЛИЗИНОВ

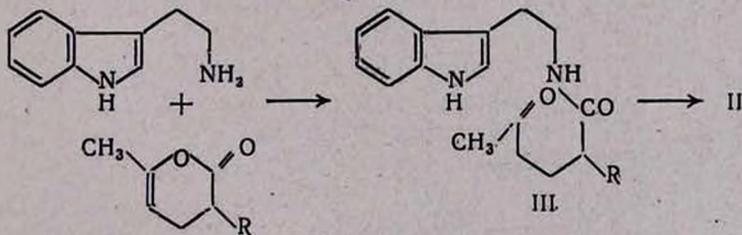
Ф. Р. ШИРОЯН, А. Г. ТЕРЗЯН и Г. Т. ТАТЕВОСЯН

Основания 1,2,3,4,6,7,12,12b - октагидроиндоло(2,3-а)хинолизинового ряда рекомендуются в литературе в качестве седативных средств и антигипертензивных веществ [1].

Один из общих методов синтеза этих оснований заключается в восстановлении алюмогидридом лития соответствующих тетрациклических лактамов. Так, в частности, описано получение октагидроиндолохинолизиновых оснований с ангулярной метильной группой в положении 12b (I) восстановлением соответствующих лактамов (II) [2, 3].

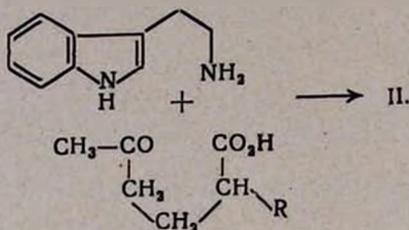


Лактамы (II) получались циклизацией триптамов соответствующих замещенных γ -ацетилмасляных кислот (III), производившейся кипячением в метанольном растворе соляной кислоты. Замещенные же триптамы, в свою очередь, получались нагреванием триптамина с энolakтонами γ -ацетилмасляных кислот в хлористом метиле [2] или в бензоле [3].



В литературе имеются указания на то, что в ряду производных триптамина благодаря повышенной электронной плотности и, вследствие этого, легкого протекания реакций электрофильного замещения в α -положении индольного ядра, циклизации указанного типа могут быть осуществлены и в отсутствии катализатора—кислоты, путем продолжительного кипячения нейтральных растворов исходных компонентов [4].

Ниже описывается одностадийная, некаталитическая конденсация триптамина с γ -ацетилмасляной кислотой и ее α -метил-гомологом, происходящая при продолжительном капячении ксилольных растворов эквимолярных количеств компонентов в атмосфере азота.



Лактамы (II) получают с выходами около 60%.

Экспериментальная часть

12b-Метил-4-оксо-1,2,3,4,6,7,12,12b-октагидроиндоло (2,3-а) хинолизин (II, R=H). Раствор 1,6 г (0,01 моля) триптамина и 1,3 г (0,01 моля) γ -ацетилмасляной кислоты в 100 мл ксилола в токе азота кипятился в течение 24 часов с обратным холодильником, присоединенным к колбе через водоотделитель. По мере образования тетрациклический лактам выделялся из кипящего раствора в виде масла. По истечении 24 часов часть ксилола, отогнавшаяся в водоотделитель, слита, а остаток в колбе разбавлен трехкратным объемом петролейного эфира (т. кип. 60—80°). После некоторого стояния жидкость слита с выделившегося твердого продукта, последний растерт с 5%-ной соляной кислотой, затем с разбавленной щелочью и промыт водой. Сырой продукт растворен в 50 мл метанола, раствор прокипячен с углем, отфильтрован и осажден добавлением большого количества воды. Отфильтрованное, промытое малым количеством спирта и высушенное бесцветное вещество плавится при 255° (в литературе [3] указана т. пл. 256°). Выход 1,5 г (59%). Найдено %: С 75,50; Н 7,17; N 11,28. $\text{C}_{16}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}$. Вычислено %: С 75,59; Н 7,08; N 11,02.

3,12b-Диметил-4-оксо-1,2,3,4,6,7,12,12b-октагидроиндоло (2,3-а) хинолизин (II). Раствор 4,8 г (0,03 моля) триптамина и 5 г (0,035 моля) α -метил- γ -ацетилмасляной кислоты в 200 мл ксилола кипятился в атмосфере азота 24 часа. Дальнейшая обработка реакционной смеси и очистка продукта производились как описано выше. Получено 5 г (62,1%) бесцветного вещества с т. пл. 273—274° (в литературе [3] указана т. пл. 274°). Найдено %: С 76,54; Н 7,70; N 10,15. $\text{C}_{17}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}$. Вычислено %: С 76,11; Н 7,46; N 10,44.

Л И Т Е Р А Т У Р А

1. Пат. США 3.120.538; С. А., 61, 5655 (1964); 3.151,116; С. А., 61, 16080 (1964); Голл. пат. 638.406; С. А., 62, 13151 (1965); Бельг. пат. 103.512; С. А., 62, 10438 (1965); Япон. пат. 107 ('66); С. А., 64, 11212 (1966).
2. *E. Winterfeldt*, Chem. Ber., 97, 2463 (1964).
3. *Ф. Р. Широян, А. Г. Терзян, А. Р. Мкртчян, Л. В. Хажакян, Г. Т. Татевосян*, Арм. хим. ж., 20, 649 (1967); *Ф. Р. Широян, А. Г. Терзян, Л. В. Хажакян, Г. Т. Татевосян*, Арм. хим. ж., 21, 44 (1968).
4. *A. Mondon, G. Hasselmeier*, Chem. Ber., 92, 2552 (1959); *S. Wawzonek, J. D. Hordstram*, J. Med. Chem., 8, 265 (1965).