ՀԱՅԿԱԿԱՆ ՔԻՄԻԱԿԱՆ ԱՄՍԱԳԻՐ
АРМЯНСКИЙ ХИМИЧЕСКИЙ ЖУРНАЛ
XXVII, № 9, 1974

УДК 547.751

ПРОИЗВОДНЫЕ ИНДОЛА

XLVIII. 1,2-ДИЗАМЕЩЕННЫЕ ТРИПТАМИНЫ

Л. С. ГАЛСТЯН и Г. Л. ПАПАЯН

Институт тонкой органической химии им. А. Л. Мнджояна АН Армянской ССР, Ереван

Поступило 31 VII 1973

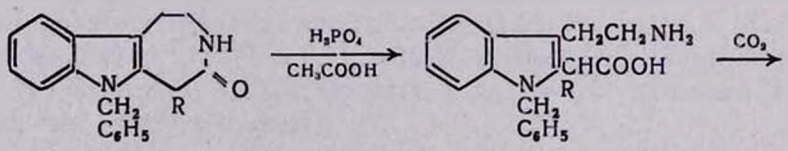
Исходя из 5,6-дизамещенных 1,2,3,4,5,6-гексагидро-4-оксоазепино(4,5-*b*)индолов получены 1-бензил-2-замещенные триптамины.

Табл. 2, библ. ссылок 2.

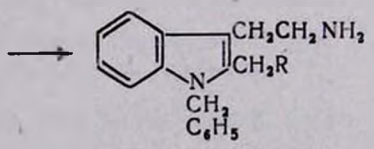
По продолжительности биологического действия 2-замещенные триптамины превосходят незамещенные производные [1]. Однако из-за малодоступности ряда исходных веществ для фишеровской циклизации существующие методы не позволяли получать многие производные названных соединений. Перспективным является метод превращения триптамина в 2-замещенные производные через соответствующие оксоазепиноиндолы, получаемые циклизацией галоидацильных производных триптамина [2, 3].

Метод заключается в размыкании конденсированного с индольным ядром семичленного оксоазепинового цикла кислотой, ведущем к замещенным по пиррольному кольцу производным триптамина.

Полученные при этом 2-α-замещенные карбоксиметильные производные 1-бензилтриптамина при нагревании выше своих температур плавления, подвергаясь декарбоксилированию, с удовлетворительными выходами превращаются в 2-замещенные 1-бензилтриптамины.



I—V



VI—X

R = C_6H_5, $C_6H_5CH_2$, ($C_6H_5COCH_2$), (C_2H_5)$_2$, H.

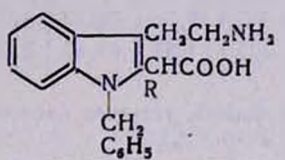
Из соединения I ($R=C_6H_5$) получено N-хлорацетильное производное (XI).

Попытки подвергнуть I и XI циклизации оказались безуспешными. Чистота полученных веществ установлена ТСХ на окиси алюминия II степени активности.

Экспериментальная часть

1-Бензил-2(α-R-карбоксиметил)триптамины (I—V). К 0,01 моля 5-R-6-бензил-1,2,3,4,5,6-гексагидро-4-оксо-азепино(4,5-b)индола в 60 *мл* ледяной уксусной кислоты при перемешивании из капельной воронки прибавлено 30 *мл* 4 *н* ортофосфорной кислоты. Смесь нагревалась 48 час., экстрагировалась бензолом и высушивалась, растворитель отгонялся, остаток обрабатывался петролейным эфиром. Выходы, т. пл. и данные анализа приведены в табл. 1.

Таблица 1



R	Выход, %	Т. пл., °C	Анализ, % C найдено	C вычислено	H найдено	H вычислено	N найдено	N вычислено	ТСХ R_f^*
C_6H_5	56,0	137—138	78,30	78,12	5,70	6,25	7,67	7,30	0,46
$CH_2-C_6H_5$	54,8	134—135	79,03	78,39	6,71	6,53	6,30	7,03	0,61
$CH_2-CO-C_6H_5$	70,0	123—125	75,48	76,05	6,11	6,10	6,78	6,57	0,47
$(C_6H_5)_2$	67,5	127—128	80,36	80,87	5,82	6,08	7,06	6,96	0,53
H	40,0	117—119	74,25	74,00	6,51	6,49	8,73	9,09	0,60

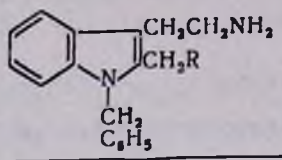
R_f^* система — хлороформ, бензол, уксусная кислота.

1-Бензил-2-замещенные триптамины (VI—X). 0,01 моля соединений I—V в фарфоровой чашке нагревалось до прекращения выделения двуокиси углерода. После охлаждения остаток растворялся в бензоле и осаждался петролейным эфиром. Константы полученных веществ VI—X приведены в табл. 2.

1-Бензил-2-(α-карбоксибензил)хлорацетилтриптамин (XI). Смесь 0,01 моля 1-бензил-2-(α-карбоксибензил)триптамина, 0,01 моля хлорангидрида хлоруксусной кислоты в абс. бензоле и 1,5 *г* порошкообразной окиси кальция в абс. бензоле нагревалась 2 часа при 75—80°, затем фильтровалась, к фильтрату добавлялся петролейный эфир. Полученный осадок XI перекристаллизовывался из бензол-петролейного эфира.

Т. пл. 107—108°. Выход 2,6 *г* (56%). Найдено %: Cl 7,58; N 5,85. $C_{27}H_{25}ClN_2O_3$. Вычислено %: Cl 7,71; N 6,08.

Таблица 2



R	Выход, %	Т. пл., °C	Анализ, % C найдено	C вычислено	H найдено	H вычислено	N найдено	N вычислено	ТСХ R_f^*
C_6H_5	49,0	151—153	84,10	84,70	6,54	7,06	8,40	8,23	0,51
$CH_2—C_6H_5$	51,6	152—153	84,82	84,74	7,46	7,34	7,35	7,91	0,58
$CH_2—CO—C_6H_5$	39,8	168—170	82,04	81,67	6,38	6,80	7,28	7,33	0,50
$(C_6H_5)_2$	69,7	131—133	86,36	86,53	7,06	6,73	6,98	6,73	0,56
H	58,9	122—123	81,38	81,81	7,48	7,57	10,87	10,61	0,55

R_f^* система — хлороформ, бензол, уксусная кислота

ԻՆԴՈԼԻ ԱԾԱՆՑՅԱԼՆԵՐ

XLVIII. 1,2-ԲՐԿՏԵՂԱԿԱԼՎԱԾ ՏՐԻՊՏԱՄԻՆՆԵՐ

Լ. Ս. ԳԱԼՍՏՅԱՆ և Հ. Լ. ՊԱՊԱՅԱՆ

5,6-Բրկտեղակալված 1,2,3,4,5,6-հեքսահիդրո-4-օքսոազեպինո- [4,5-b] ինդոլների ազեպինային օղակի բացումից առաջացած կարբօքսիածանցյալների դեկարբօքսիլացումից ստացվում են 1-բենզիլ-2-տեղակալված տրիպտամիններ։

STUDIES ON INDOLE DERIVATIVES

XLVIII. 1,2-DISUBSTITUTED TRYPTAMINES

L. S. GALSTIAN and H. L. PAPAYAN

It has been shown, that carboxyderivatives are formed by ring opening of azepine in 1,2,3,4,5,6-hexahydro-4-oxy-5-disubstituted azepino [4,5-b] indoles which on decarboxylation leads to 1-benzyl-2-substituted tryptamines.

ЛИТЕРАТУРА

1. *D. W. Wolley, E. Shaw*, J. Pharmocol., 108, 87 (1953).
2. *K. Freter*, Lieb. Ann., 721, 101 (1969).
3. *Г. Л. Папаян, Л. С. Галстян*, Арм. хим. ж., 27, 331 (1974).