

ПРОИЗВОДНЫЕ ИНДОЛА

XI, IX. 5-R-6-БЕНЗИЛ- И 5-R-3,6-ДИБЕНЗИЛ-1,2,3,4,5,6-ГЕКСАГИДРОАЗЕПИНО-  
 [4,5-b] ИНДОЛЫ

Л. С. ГАЛСТЯН и Г. Л. ПАПАЯН

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

Поступило 22 II 1974

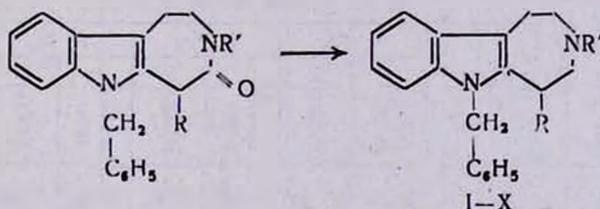
5-R-6-Бензил-4-оксо- и 5-R-3,6-дибензил-4-оксоазепиноиндолы восстановлены алю-  
 могидридом лития (АГЛ) в соответствующие азепиноиндолы.

По азепиновому азоту получен ряд 3-N-замещенных производных.

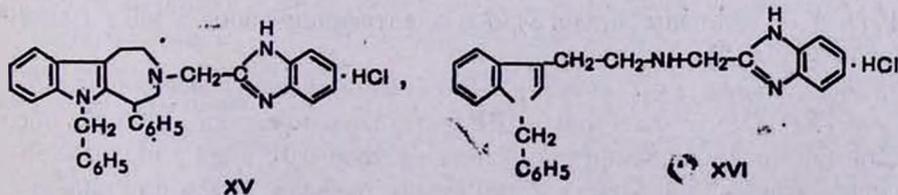
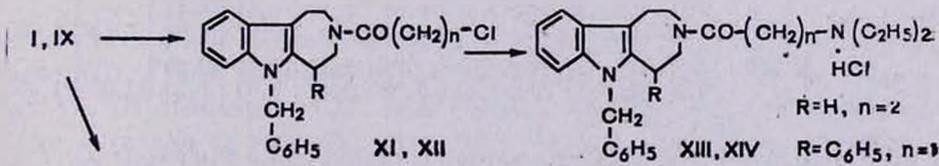
Табл. 3. биб. ссылок I.

С целью изучения фармакологических свойств 5-R-6-бензил-4-оксо-  
 и 5-R-3,6-дибензил-4-оксоазепиноиндолы [1] были восстановлены по оксо-  
 группе АГЛ и переведены в кристаллические гидрохлориды.

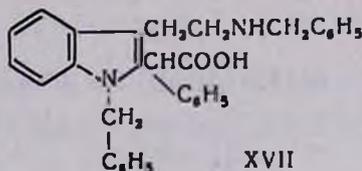
По азоту I и IX получены хлорацильные XI, XII и соответствующие  
 им диэтиламинопроизводные XIII, XIV, а из I и 1-бензилтриптамина--  
 бензимидазолметильные производные XV, XVI.



R = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>, R' = H (I); C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>CH<sub>2</sub> (II); C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>CH<sub>2</sub>, H (III); C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>CH<sub>2</sub>, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>CH<sub>2</sub> (IV);  
 C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>COCH<sub>2</sub>, H (V); C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>COCH<sub>2</sub>, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>CH<sub>2</sub> (VI); (C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, H (VII);  
 (C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>CH<sub>2</sub> (VIII); H, H (IX); H, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>CH<sub>2</sub> (X).



В условиях [1] была произведена дециклизация невосстановленного II ( $R' = C_6H_5CH_2$ ) в 1-бензил-2- $\alpha$ -карбоксивензил-N-бензилтриптамин (XVII).



Бензилирование I ( $R = H$ ) хлористым бензилом дало идентичное соединение.

### Экспериментальная часть

**5-R-6-Бензил-1,2,3,4,5,6-гексагидроазепино[4,5-b]индолы.** Смесь 0,01 моля оксазепиноиндола в 50 мл сухого бензола, 4г (0,1 моля) АГЛ в 70 мл абс. эфира нагревали на водяной бане 8 час. Реакционную массу разложили 20 мл воды, экстрагировали эфиром, экстракт промыли водой и высушили над безводным сульфатом натрия. После отгонки растворителя маслообразный остаток закристаллизовали протиранием петролейным эфиром. Перекристаллизация из бензол-петролейного эфира (табл. 1).

Таблица 1

Гидрохлориды и основания 5-R-6-бензил-1,2,3,4,5,6-гексагидроазепино[4,5-b]индолы I, III, V, VII, IX

R	Выход, %	Т. пл., °C	C, %		H, %		N, %		Cl, %	
			вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено
C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	55,5	117—119	85,23	85,80	6,82	6,75	7,95	7,59	—	—
	62,0	135—137	—	—	—	—	7,20	7,40	9,14	9,13
C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub>	52,3	75—76	85,22	85,70	7,10	7,10	7,65	7,69	—	—
	70,0	123—124	—	—	—	—	6,95	7,27	8,82	8,70
C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> COCH <sub>2</sub>	45,0	155—156	—	—	—	—	3,36	3,15	8,52	8,33
	56,8	106—107	86,91	87,64	6,54	7,14	6,54	6,71	—	—
(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	45,0	164—165	—	—	—	—	6,02	6,34	7,64	8,00
	60,0	115—116	82,61	82,08	7,24	7,42	10,15	10,50	—	—
H	57,0	173—175	72,96	73,40	6,72	7,40	8,96	9,23	11,36	11,46

**5-R-3,6-Дибензил-1,2,3,4,5,6-гексагидроазепино[4,5-b]индолы II, IV, VI, VIII, X.** Получены аналогично и идентифицированы в виде гидрохлоридов (табл. 2).

**3-Хлорацильные производные 5-R-6-бензилгексагидроазепино-[4,5-b]-индолы (XI, XII).** К раствору 0,01 моля азепиноиндола в 50 мл абс. бензола при перемешивании прикапали раствор 0,01 моля хлорангидрида хлоркарбоновой кислоты в 25 мл сухого бензола. Затем при кипении

смеси и пропускании тока азота, в течение 15 мин. прибавили 1 г порошкообразной прокаленной окиси кальция. Реакционную смесь кипятили еще 6 час., затем отфильтровали и действием петролейного эфира осадили продукт реакции. Перекристаллизация из бензол-петролейного эфира. Хроматография в тонком слое окиси алюминия II степени активности показала одно пятно (табл. 3).

Таблица 2

Гидрохлориды 5-R-3,6-дибензил-1,2,3,4,5,6-гексагидроазепино-[4,5-b]индолов II, IV, VI, VIII, X

R	Выход, %	Т. пл., °C	N, %		Cl, %	
			вычислено	найдено	вычислено	найдено
C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	38,5	121—122	5,85	6,40	7,42	7,21
C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	40,2	149—151	5,68	5,50	7,20	7,32
C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> COCH <sub>3</sub>	33,8	61—61	5,55	5,22	6,64	6,88
(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	41,6	98—99	5,16	5,45	6,54	6,41
H	45,5	70—71	6,95	7,45	8,82	9,38

Таблица 3

Гидрохлориды хлорацильных, диэтиламинобензимидазолметильных производных XI—XVI

Соединение	Выход, %	Т. пл., °C	N, %		Cl, %	
			вычислено	найдено	вычислено	найдено
XI	66,7	131—132	7,64	7,37	9,69	9,61
XII	52,7	172—173	6,53	6,09	8,28	8,65
XIII	51,3	70—73	9,55	9,51	8,37	8,17
XIV	50,2	67—68	8,37	8,02	7,07	7,47
XV	60,0	169—190	10,82	11,13	6,86	7,10
XVI	76,4	175—178	13,44	13,30	8,52	8,88

Гидрохлориды 3-диэтиламиноацильных производных азепиноиндолов XIII, XIV. К бензольному раствору 0,01 моля 3-хлорацильных производных XI, XII прибавили 0,02 моля бензольного раствора диэтиламина. Смесь оставили на ночь при комнатной температуре. После обработки вещества выделили и идентифицировали в виде гидрохлоридов (табл. 3).

Гидрохлориды 3-[2-бензимидазолметильных] производных 5-фенил-6-бензилазепиноиндола и 1-бензилтриптамина XV, XVI. К бензольному раствору 0,01 моля 5-фенил-6-бензилазепиноиндола или 0,02 моля бензилтриптамина прибавили 0,01 моля 2-хлорметилбензимидазола в 20 мл абс. спирта. Смесь нагревали 18 час. После прибавления

абс. эфира вещества осаждались в виде гидрохлоридов. Переосаждение из спирт-эфира (табл. 3).

*1-Бензил-2-α-карбоксібензил-N-бензилтриптамин (XVII).* К 4,5 г (0,01 моля) 5-фенил-3,6-добензил-1,2,3,4,5,6-гексагидро-4-оксоазепино[4,5-б] индола в 60 мл ледяной уксусной кислоты прибавили 30 мл 4н ортофосфорной кислоты. Кипятили 48 час. Экстрагировали бензолом, промыли водой и высушили над сульфатом натрия. После отгонки растворителя остаток закристаллизовали протиранием петролейным эфиром. Перекристаллизация из бензол-петролейного эфира. Выход 1,9 г (40%), т. пл. 128—130°. Найдено %: С 80,80; Н 6,80; N 6,34.  $C_{32}H_{29}N_2O_2$ . Вычислено %: С 81,18; Н 6,13; N 5,92.

### ԻՆՎՈՒԻ ԱՇԱՆՑՅԱԼՆԵՐ

XLIX. 5-R-6-ԲԵՆԶԻԼ- և 5-R-3,6-ԴԻԲԵՆԶԻԼ-1,2,3,4,5,6-  
ՀԵՔՍԱՀԻԴՐՈԱԶԵՊԻՆՈ[4,5-Ե]ԻՆՎՈՒՆԵՐ

Վ. Ս. ԳԱԼՍՏՅԱՆ և Հ. Լ. ՊԱՊԱՅԱՆ

Ֆարմակոլոգիական ուսումնասիրության նպատակով սինթեզված են 5-R-6-բենզիլ- և 5-R-3,6-դիբենզիլ-1,2,3,4,5,6-հեքսահիդրոազեպինո[4,5-բ]-ինդոլներ, որոնք ստացվել են 5-R-6-բենզիլ-4- և 5-R-3, 6-դիբենզիլ-4-օքսոազեպինոինդոլների վերականգնումով:

Ստացված են վերականգնված նյութերի մի շարք ածանցյալներ:

### INDOLE DERIVATIVES

XLIX. 5-R-6-BENZYL- AND 5-R-3,6-DIBENZYL-1,2,3,4,5,6-HEXAHYDRO-AZEPINO[4,5-b]INDOLES

L. S. GALSTIAN and H. L. PAPAYAN

Several 5-R-benzyl- and 5-R-3,6-dibenzyl-1,2,3,4,5,6-hexahydroazepino[4,5-b] indoles and their derivatives have been synthesized.

### Л И Т Е Р А Т У Р А

Վ. Л. С. Галстян, Г. Л. Папаян, Арм. хим. ж., 27, 331 (1947).