ՀԱՅԿԱԿԱՆ ՔԻՄԻԱԿԱՆ ԱՄՍԱԳԻՐ
АРМЯНСКИЙ ХИМИЧЕСКИЙ ЖУРНАЛ
XXXI, № 5, 1978

УДК 547.759.4.547.833.3

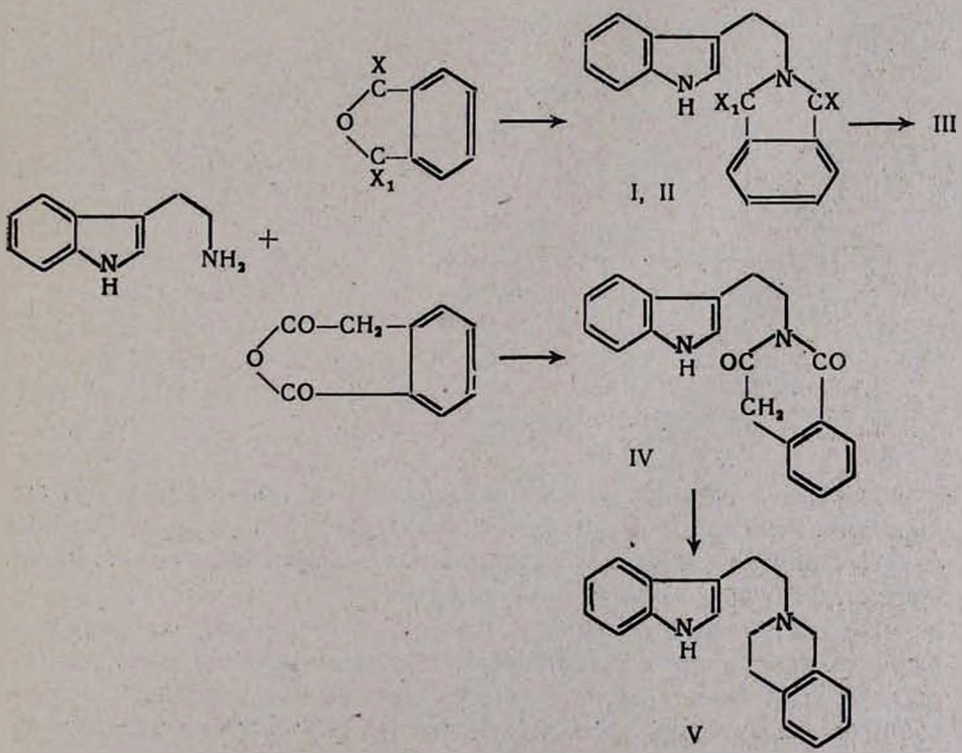
# СИНТЕЗ И ИССЛЕДОВАНИЯ НЕКОТОРЫХ N[β-(3-ИНДОЛИЛ-ЭТИЛ)]ИМИДОВ И ИХ ВОССТАНОВЛЕННЫХ АНАЛОГОВ

Л. П. СОЛОМИНА, Р. Т. ГРИГОРЯН и Э. А. МАРКАРЯН
Институт тонкой органической химии им. А. Л. Мнджояна
АН Армянской ССР, Ереван

Поступило 11 I 1977

Описаны получение и масс-спектрометрические исследования некоторых N-замещенных триптаминов.
Рис. 1, библ. ссылок 5.

В предыдущем сообщении нами предложен новый синтез дигидрогамбиртанина [1]. В продолжение этих исследований в настоящей работе сплавлением триптамина со фталидом, фталевым и гомофталевым ангидридами получены N[β-(3-индолилэтил)]фталимидин I, а также N[β-(3-индолилэтил)]имиды фталевой и гомофталевой кислот II, IV, восстановление которых АГЛ привело соответственно к продуктам III, V [2].




I. X=O, $X_1=H_2$; II. X=$X_1$=O; III. X=$X_1$=$H_2$

Строение полученных соединений подтверждено данными ИК и масс-спектров.

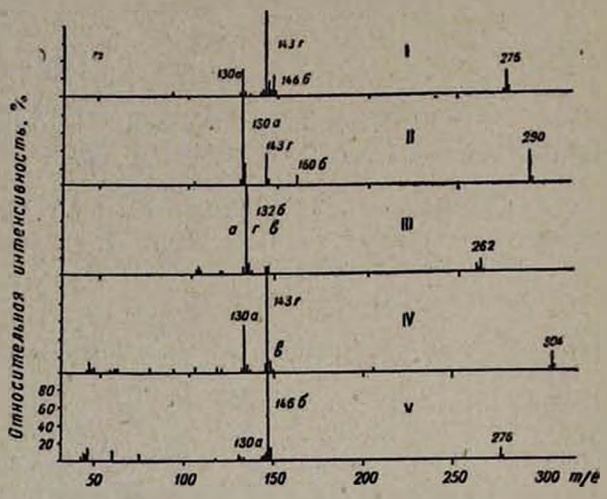
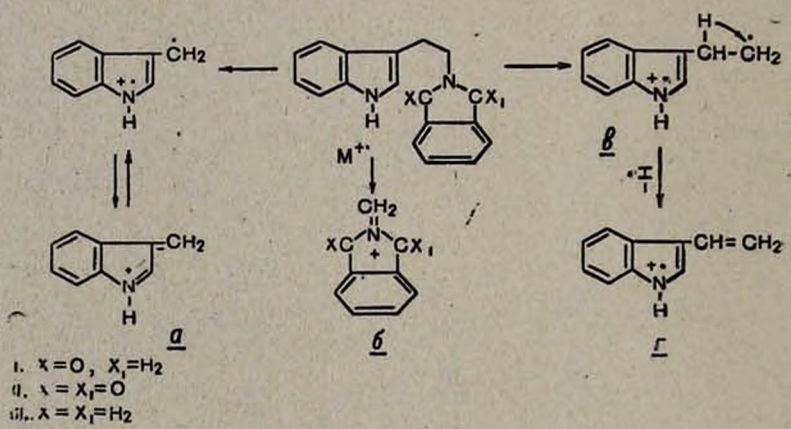



Рис. Масс-спектры соединений I—V.

В масс-спектрах I—V (рис.) присутствовал пик молекулярного иона, дальнейший распад которого для соединений I—III представлен на схеме.




Аналогично распадались соединения IV и V. Таким образом, при ионизации электронным ударом направление распада молекулярных ионов соединений I—V аналогично и спектры отличаются только интенсивностями пиков соответствующих ионов.

Так, например, в спектрах соединений I, II, IV наиболее интенсивными являлись пики ионов типа *а* и *г*, образование которых, подобно распаду триптамина [3], обусловлено локализацией заряда на атоме азота индольного ядра. Для соединений III и V предпочтительным являлся $\alpha$-разрыв по отношению к имидному азоту с образованием макси-

мального по интенсивности пика иона типа *б*. Ион типа *б* присутствовал также в спектрах соединений I, II, IV, интенсивность которого не превышала 22% от максимального. Причиной такой разницы, очевидно, явилось наличие карбонильных групп в молекулах соединений I, II и IV. Присутствием карбонильных групп может быть объяснено также увеличение относительной интенсивности иона *а* в этих молекулах.

Фармакологические исследования показали, что полученные соединения не обладают противосудорожной и адренолитической активностями.

## Экспериментальная часть

ТСХ всех веществ проводилась на пластинках «Silufol» в системах: бензол—ацетон (4 : 1)—для соединений I,II,IV; бутанол—уксусная кислота—вода (10 : 1 : 3)—для соединений III, V. Проявление—парами йода. ИК спектры снимали в вазелиновом масле на спектрометре UR-20, масс-спектры—на приборе МХ-1303 с прямым вводом образца при температурах плавлений данных соединений и энергии электронов 45 *эв*.

*N*[β-*(3-Индолилэтил)*]*имиды фталевой и гомофталевой кислот II, IV* [4]. Смесь 0,2 моля триптамина с 0,2 моля ангидрида фталевой или гомофталевой кислот сплавляли при 160—180° до окончания выделения воды, охлаждали, растворяли в хлороформе и промывали последовательно разбавленной соляной кислотой, водой, разбавленной щелочью, снова водой, высушивали над сернокислым натрием, отгоняли растворитель. Кристаллический остаток перекристаллизовывали из смеси спирт-эфир (2 : 1). Выход II, 80%, т. пл. 163—164°; $R_f$ 0,68. Найдено %: C 74,4; H 4,9; N 9,2. $C_{18}H_{14}N_2O_2$. Вычислено %: C 74,4; H 4,8; N 9,6. ИК спектр, *см*$^{-1}$: 1690 и 1760 (N—C=O), 3390 (NH-индола).

Выход IV 81%, т. пл. 195—196°. $R_1$ 0,75. Найдено %: C 74,6; H 5,3; N 9,4. $C_{19}H_{16}N_2O_2$. Вычислено %: C 74,9; H 5,3, N 9,2. ИК спектр, *см*$^{-1}$: 1720, 1780 (N—C=O), 3400 (NH-индола).

*N*[β*(3-Индолилэтил)*]*фталимидин I* получали по вышеописанному способу при 120—130°. Перекристаллизовывали из смеси спирт-эфир (2 : 1). Выход 76%, т. пл. 161—162°. $R_f$ 0,50. Найдено %: C 78,4; H 5,8; N 9,99. $C_{18}H_{16}N_2O$. Вычислено %: C 78,2; H 5,8; N 10,1. ИК спектр, *см* $^{-}$ 1650 (N—C=O), 3260 (NH-индола).

*N*[β-*(3-Индолилэтил)*] *дигидроизоиндол III* получали восстановлением I, II АГЛ в тетрагидрофуране. При этом брали стехиометрические количества АГЛ для восстановления одной или двух карбонильных групп. В обоих случаях получали соединение III. Перекристаллизовывали из смеси ацетон-эфир (2 : 1). Выход 94%, т. пл. 144—145°. $R_f$ 0,43. Найдено %: C 82,7; H 7,3; N 10,5. $C_{18}H_{18}N_2$. Вычислено %: C 82,4; H 6,9, N 10,6. ИК спектр, *см*$^{-1}$: 3200 (NH-индола). Гидрохлорид получали из тетрагидрофуранового раствора, т. пл. 200—201°. Найдено %: N 9,4; Cl 11,9. Вычислено %: N 9,4; Cl 11,9.

*N[β-(Индолилэтил)]тетрагидроизохинолин V* [5] получали аналогично вышеописанному. Перекристаллизовывали из смеси ацетон-эфир (2 : 1). Выход 70%, т. пл. 124—125°. $R_f$ 0,43. Найдено %: C 82,2; H 7,4; N 9,8. $C_{19}H_{20}N_2$. Вычислено %: C 82.5; H 7,3; N10,1. ИК спектр, $см^{-1}$: 3420 (NH-индола).

## ՄԻ ՇԱՐՔ N-[β-(3-ԻՆԴՈԼԻԼԷԹԻԼ)]ԻՄԻԴՆԵՐԻ ԵՎ ՆՐԱՆՑ ՎԵՐԱԿԱՆԳՎԱԾ ԱՆԱԼՈԳՆԵՐԻ ՍԻՆԹԵԶԸ ԵՎ ՈՒՍՈՒՄՆԱՍԻՐՈՒԹՅՈՒՆՆԵՐԸ

Լ. Պ. ՍՈԼՈՄԻՆԱ, Ռ. Թ. ԳՐԻԳՈՐՅԱՆ և Է. Ա. ՄԱՐԴԱՐՅԱՆ

*Նկարագրված են մի շարք N-տեղակալված տրիպտամինների ստացումը և մասս-սպեկտրոմետրիկ հետազոտությունները։*

*Տրիպտամինի և ֆտալիդի, ֆտալային և հոմոֆտալային անհիդրիդների հալեցումից ստացված են ֆտալաթթվի և հոմոֆտալաթթվի և N-(β-(3-ինդոլիլէթիլ))ֆտալիմիդին I, N-(β-(3-ինդոլիլէթիլ))իմիդներ II, IV, որոնց վերականգնումից լիթիումի ալյումոհիդրիդով ստացված են համապատասխան միացություններ III և V։*

*Սինթեզված միացությունների կառուցվածքը հաստատվել է ԻԿ և մասս-սպեկտրոսկոպիայով։*

## SYNTHESIS AND INVESTIGATION OF SOME N-[β-(3-INDOLYLETHYL)]-IMIDES AND THEIR REDUCED ANALOGS

L. P. SOLOMINA, R. T. GRIGORIAN and E. A. MARKARIAN

Preparation and mass spectrometric investigations of some N-substituted triptamines have been described.

N[β-(3-indolylethyl)]phthalimidine (I) and N[β-(3-indolylethyl)]imides of phthalic and homophthalic acids (II) and (IV) were obtained by fusion of triptamine with phthalide phthalic and homophthalic anhydrides. Their reduction with lithium aluminium hydride led to products III and V, respectively. The structure of all compounds obtained was confirmed by IR and mass spectra.

### ЛИТЕРАТУРА

1. *Э. А. Маркарян, Л. П. Соломина, Т. О. Асатрян, А. С. Цатинян*, Арм. хим. ж., 29, 326 (1976).
2. *S. Wawzonek, G. E. Nelson*, J. Org. Chem., 27, 1377 (1962).
3. *Р. А. Хмельницкий, В. И. Высоцкий И. И. Грандберг*, ЖОХ, 5, 417 (1969).
4. *Richard H. F. Manske*, J. Am. Chem. Soc., 51, 1202 (1929).
5. *R. C. Elderfield, B. A. Fischer*, J. Org. Chem., 23, 949 (1958).