

The antiviral activity of the synthesized compounds has been studied.

ЛИТЕРАТУРА

1. А. А. Аветисян, Ц. А. Мангасарян, М. Т. Дангян, С. Г. Мацоян, Арм. хим. ж., 26, 659 (1973).
2. А. А. Аветисян, А. Н. Джанджапанян, Г. В. Симонян, М. Т. Дангян, Арм. хим. ж., 27, 954 (1974).
3. А. А. Аветисян, А. Н. Джанджапанян, М. Т. Дангян, Арм. хим. ж., 30, 841 (1977).

УДК 547+547.752

ПРОИЗВОДНЫЕ ИНДОЛА

LXV. 4a,13c-транс-1,4,4a,5,7,8,13b,13c-ОКТАГИДРО--13-Н-БЕНЗ(g) ИНДОЛО(2,3-а)ИНДОЛИЗИНЫ

С. А. ПОГОСЯН, Л. Л. ОГАНЕСЯН и Д. З. ПАРТЕВ

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

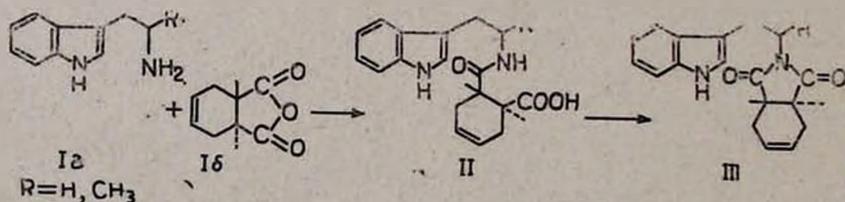
Поступило 9 VII 1980

Описан синтез 4a,13c-транс-1,4,4a,5,7,8,13b,13c-октагидро-13-Н-бенз(g)индоло(2,3-а)-индолизина и его 7-метилпроизводного. Разработан новый способ получения транс-имидов III.

Библ. ссылок 5.

Известно, что конфигурация колец Д и Е в алкалоидах иохимбинового ряда оказывает заметное влияние на их биологические свойства. То обстоятельство, что большинство природных соединений этого ряда имеет транс-конфигурацию [1, 2] колец Д и Е, побудило нас синтезировать некоторые структурные аналоги иохимбиноидов—бенз(g)индолоиндолизины транс-строения VI. Поскольку нами ранее [3, 4] были получены аналогичные соединения цис-строения, то наличие этих двух стереомерных рядов позволило бы провести сравнительное изучение их биологических свойств.

Наиболее важной стадией в синтезе оснований VI является получение промежуточных имидов циклогексен- транс-1,2-дикарбоновой кислоты III.



транс-Имиды III были синтезированы нами по видоизмененному способу [5] в тетрагидрофуране. В ИК спектрах обнаружены два пика, характерных для имидных карбониллов с интервалом от 70 до 80 см^{-1} , поглощение двойной связи (1640—1650 см^{-1}) и иминогруппы (3380—3400 см^{-1}).

Найдено %: С 69,50; Н 7,37; N 8,35. $C_{18}H_{22}N_2O_3$. Вычислено %: С 69,91; Н 6,79; N 8,58.

Имиды Δ^4 -циклогексен-транс-1,2-дикарбоновой кислоты III. К раствору 0,01 моля моноамида II в 150 мл сухого ТГФ прибавляли 12 мл хлористого ацетила и смесь слабо нагревали 2 ч. После отгонки растворителя остаток растворяли в этилацетате и обрабатывали 5% соляной кислотой, водой, 5% едким натром. Раствор концентрировали до небольшого объема, затем пропускали через колонку с окисью алюминия. После отгонки растворителя остаток растирали в петролейном эфире и перекристаллизовывали из метанола.

III, $R=H$. Выход 69%, т. пл. 247—248°, R_f 0,68, ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1600 (аром.), 1640 (C=C), 1700, 1780 (O=C—N—C=O), 3380 (NH инд.). Найдено %: С 73,50; Н 6,21; N 9,90. $C_{18}H_{18}N_2O_2$. Вычислено %: С 73,44; Н 6,18; N 9,52.

III, $R=CH_3$. Выход 70%, т. пл. 226—228°, R_f 0,7. ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1610 (аром.), 1650 (C=C), 1710, 1780 (O=C—N—C=O), 3390 (NH инд.). Найдено %: С 73,91; Н 6,30; N 9,08. $C_{19}H_{20}N_2O_2$. Вычислено %: С 74,00; Н 6,53; N 9,08.

Оксимидины IV. К раствору 0,01 моля имида III в 150 мл сухого ТГФ по каплям прибавляли раствор 0,0065 моля АГЛ в 10 мл эфира. Смесь кипятили 1 ч, после чего охлаждали и разлагали 10% едким натром. Раствор отгоняли и остаток перекристаллизовывали из метанола.

IV, $R=H$. Выход 79%, т. пл. 179—181°, R_f 0,23. ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1620 (аром.), 1650 (C=C), 1680 (C=O амид.), 3280 (ОН), 3340 (NH инд.). Найдено %: С 72,58; Н 6,88; N 10,10. $C_{18}H_{20}N_2O_2$. Вычислено %: С 72,70; Н 6,80; N 9,45.

IV, $R=CH_3$. Выход 54%, т. пл. 200—204°, R_f 0,20. ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1620 (аром.), 1640 (C=C), 1680 (C=O амид.), 3300 (ОН), 3340 (NH инд.). Найдено %: С 73,66; Н 7,08; N 9,00. $C_{19}H_{22}N_2O_2$. Вычислено %: С 73,52; Н 7,14; N 9,02.

Лактамы V. Раствор 0,1 моля оксимидина IV и 0,2 мл конц. соляной кислоты в 200 мл метанола кипятили 24 ч. После отгонки части растворителя выпадали кристаллы пентациклического лактама, которые отфильтровывали и промывали эфиром. Перекристаллизация из метанола.

V, $R=H$. Выход 84%, т. пл. 228—229°, R_f 0,53. ИК спектр ν , cm^{-1} : 1610 (аром.), 1650 (C=C), 1690 (C=O амид.), 3350 (NH инд.). Найдено %: С 77,40; Н 5,82; N 10,41. $C_{18}H_{18}N_2O$. Вычислено %: С 77,66; Н 6,51; N 10,06.

V, $R=CH_3$. Выход 65%, т. пл. 226—231°, R_f 0,48. ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1650 (C=C), 1700 (C=O амид.), 3400 (NH инд.). Найдено %: С 78,62; Н 6,72; N 9,40. $C_{19}H_{20}N_2O$. Вычислено %: С 78,05; Н 6,89; N 9,58.

Основания VI. К раствору 0,1 моля АГЛ в 200 мл эфира при перемешивании прибавляли раствор 0,02 моля лактама V в 150 мл сухого ТГФ и смесь кипятили 18 ч. После обычной обработки основания VI очищали пропусканьем их эфирных растворов через колонки с окисью алюминия. Удалили эфир, остаток светлого цвета высушили в вакууме над едким кали. Перекристаллизация из абс. эфира.

VI, R=H. Выход 83%, т. пл. 145°, R_f 0,75. ИК спектр, ν , см^{-1} : 1625 (аром.), 1650 (C=C), 2710, 2780 (об. Больмана), 3410 (NH инд.). Найдено %: C 81,83; H 8,01; N 10,59. $\text{C}_{18}\text{H}_{20}\text{N}_2$. Вычислено %: C 81,77; H 7,62; N 10,59. Гидрохлорид, т. пл. 246—250° (с разл.). Найдено %: Cl 11,32. $\text{C}_{18}\text{H}_{20}\text{N}_2 \cdot \text{HCl}$. Вычислено %: Cl 11,78.

VI, R=CH₃. Выход 72%, аморф., R_f 0,7. ИК спектр, ν , см^{-1} : 1625 (аром.), 1640 (C=C), 3420 (NH инд.). Найдено %: C 81,68; H 7,80; N 10,12. $\text{C}_{19}\text{H}_{22}\text{N}_2$. Вычислено %: C 81,97; H 7,96; N 10,06. Гидрохлорид, т. пл. 208—212° (с разл.). Найдено %: Cl 11,05; $\text{C}_{19}\text{H}_{23}\text{N}_2 \cdot \text{HCl}$. Вычислено %: Cl 11,26.

ԻՆԴՈՒԻ ԱՄԱՆՑՅԱԼՆԵՐ

LXV. 4a, 13c-ՏՐԱՆՍ-1,4,4a,5,7,8,13b,13c-ՕԿՏԱԿՏԻԴՐՈՆ-13H-ԲԵՆԶ(g) ԻՆԴՈՒԻ (2,3-a)-
ԻՆԴՈՒԻԶՐԻՆՆԵՐ

Ս. Ն. ՊՈԴՈՍՅԱՆ, Լ. Լ. ՉՈՒՀԱՆՆԻՍՅԱՆ և Դ. Չ. ՊԱՐԹԵՎ

Հանդատացնող և հիպոտեզիվ հատկություններ ունեցող նոր նյութեր ստանալու նպատակով սինթեզվել են տրանս շարքի 1, 4, 4a, 5, 7, 8, 13b, 13c-օկտահիդրոն-13H-բենզ(g)ինդոլոն (2,3-a) ինդոլիդինը և նրա 7-մեթիլա-ծանցյալը:

INDOLE DERIVATIVES

LXV. 4a, 13c-TRANS-1,4,4a,5,7,8,13b,13c-OCTAHYDRO-13H-BENZ(g)INDOLO-
(2,3-a)INDOLIZINES

S. A. POGOSSIAN, L. L. OVANNISSIAN and D. Z. PARTEV

Trans-1,4,4a,5,7,8,13b,13c-octahydro-13H-benz(g) indolo(2,3-a)indolizine and its 7-methyl derivative have been synthesized for the purpose of studying their tranquillizing and hypotensive properties.

Л И Т Е Р А Т У Р А

1. M. M. Ianoŭ, R. Goutarel, A. Le Hir, M. Amin, V. Prelog, Bull. soc. chim. Fr., 1952, 1085.
2. A. Le Hir, R. Goutarel, Bull. soc. chim. Fr., 1953, 1023.
3. С. А. Погосян, А. Г. Терзян, О. И. Бахунц, Г. Т. Татевосян, Арм. хим. ж., 26, 173 (1973).
4. С. А. Погосян, А. Г. Терзян, А. Б. Исраелян, Г. Т. Татевосян, Арм. хим. ж., 27, 597 (1974).
5. W. Huckel, H. Muller, Ber., 64, 1981 (1931).