

Таблица 2

2-N-Алкил-N-бензимидазол-4,6-замещенные-с.и.м-триазины (III)

R'	R	X	Выход, %	Т. пл., °C	R _f	N, %	
						найдено	вычислено
CH ₃	изо-C ₃ H ₇	изо-NHC ₃ H ₇	75	150—151	0,48	34,09	33,90
C ₂ H ₅	изо-C ₃ H ₇	изо-NHC ₃ H ₇	70	128—130	0,41	33,00	32,86
CH ₃	C ₂ H ₅	NHC ₂ H ₅	85	147—149	0,38	37,30	37,08
CH ₃	изо-C ₃ H ₇	OCH ₃	82	182—183	0,45	31,20	31,40
CH ₃	изо-C ₃ H ₇	SCN ₃	75	154—156	0,50	30,24	29,86

Л И Т Е Р А Т У Р А

1. Н. Н. Мельников, Химия и технология пестицидов, Изд. «Химия», М., 1974, стр. 637.
2. Пат. США 3141213 (1971), РЖХ, '171 690 (1971).
3. А. А. Атакузов, Ч. Ш. Кадиров, С. А. Хасанов, ДАН Уз. ССР, 1973, № 1, 33, РЖХ, 13ж, 293 (1973).

Армянский химический журнал, т. 35, № 5, стр. 341—343 (1982 г.).

УДК 547.752

ЧЕТВЕРТИЧНЫЕ ПИРИДИНИЕВЫЕ СОЛИ
ПРОИЗВОДНЫХ ИНДОЛА

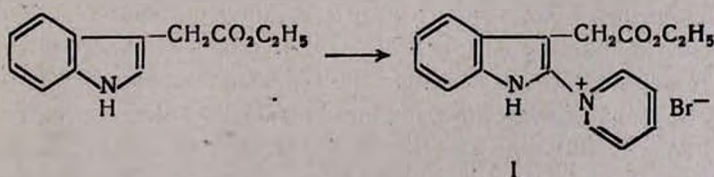
З. В. ЕСАЯН, А. А. ЧАЧОЯН и Г. Л. ПАПАЯН

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

Поступило 26 I 1981

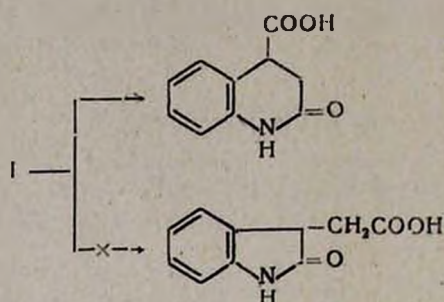
Амиды индолил-3-уксусной кислоты, обладающие биологической активностью, находят применение в синтезах производных триптамина [1].

Наряду с производными триптамина—аминоэтил-индола—представляло интерес иметь также аминоэтилпроизводные с оксоиндольным ядром с целью получения сравнительных биологических данных для обеих групп соединений. Необходимую для синтеза оксоиндолил-3-уксусную кислоту было намечено получить из индолил-3-уксусной кислоты. Для этого эфир индолил-3-уксусной кислоты был обработан бромсукцинимидом в присутствии пиридина, что привело к образованию соли пиридина во втором положении индольного ядра (I).

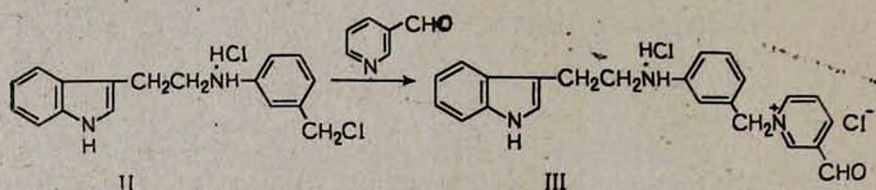


Следует отметить, что при работе с метиловым эфиром индолил-3-уксусной кислоты четвертичную соль не выделяли в кристаллическом виде [2]. Аналогичная соль этилового эфира является кристаллическим веществом.

Для образования оксоиндольных кислот четвертичную соль подвергают кислотному гидролизу, что, в частности, показано на примерах солей индолилпропионовой и индоилмасляной кислот [2]. Однако гидролиз соли индолил-3-уксусной кислоты приводит к известной 2-оксо-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-карбоновой кислоте.



К четвертичным пиридиновым солям относится также продукт конденсации *m*-хлорметилфенилтриптамина (полученный, в свою очередь, сплавлением индолил-3-уксусной кислоты с *m*-аминобензойной кислотой, восстановлением полученного амида АГЛ и переводением оксиметильной группы в хлорметильную действием хлористого тионила) с пиридин-3-альдегидом, выделенный в виде смешанной двойной соли.



Изучение противоопухолевой активности этих солей в дозе 1/6 от ЛД₅₀ (I ЛД₅₀ = 162,5, II — 225 мг/кг) показало, что они проявляют умеренную противоопухолевую активность на саркоме 180 (51 и 44%, соответственно). В отношении асцитной карциномы Эрлиха и саркомы 45 соединения оказались неактивными.

Экспериментальная часть

N-(3-Карбэтоксиметилиндолил-2)пиридиный бромид (I). К перемешиваемой смеси 5,075 г (0,025 моля) этилового эфира индолил-3-уксусной кислоты, 5,925 г (0,075 моля) пиридина и 80 мл сухого диоксана при 12—15° добавляют в течение 5 мин 4,43 г свежеприготовленного *N*-бромсукцинимид. Смесь перемешивают еще 2 ч и оставляют на ночь в холодильнике. Выпавший осадок отфильтровывают, дважды промывают абс. эфиром для удаления исходных продуктов и перекристаллизовывают

из смеси абс. спирт-сухой эфир Выход 5,38 г (59,6%), т. пл. 181—182°, R_f 0,8 (ТСХ: силуфол; метанол: уксусная кислота: вода, 5 : 4 : 1). Найдено %: С 56,78; Н 4,72; N 8,09; $\overline{Br}$ 21,62. $C_{17}H_{17}N_2OBr$. Вычислено %: С 56,50; Н 4,47; N 7,75; $\overline{Br}$ 22,16.

Гидрохлорид [3-(индолил-3-этиламино)бензил]-3-формилпиридиний хлорида (III). 1 г гидрохлорида N-м-хлорметилфенилтриптамина (II) растворяют в 30 мл абс. спирта, добавляют 0,7 г пиридин-3-альдегида и оставляют при комнатной температуре на 5 дней. Затем отфильтровывают и по каплям прибавляют к сухому эфиру. Выделившиеся желтые кристаллы отфильтровывают. Перекристаллизовывают из смеси абс. спирт-сухой эфир. Выход 1,1 г (82,7%), т. пл. 290—292°, R_f 0,4 (ТСХ: силуфол; метанол: уксусная кислота: вода, 4 : 4 : 1). Найдено %: С 64,37; Н 6,78; N 11,06; Cl^- 16,78. $C_{23}H_{23}N_3Cl_2O$. Вычислено %: С 64,48; Н 6,29; N 10,65; Cl^- 16,55. ИК спектр, cm^{-1} : 3200—3400 (NH).

Л И Т Е Р А Т У Р А

1. Э. В. Есаян, Г. Л. Папаян, Ж. С. Застухова, С. Г. Чшмаритян, Арм. хим. ж., 34, 884 (1981).
2. Т. Kobyasht, N. Jnokacht, Tetrah., 20, 2055 (1964).