

СИНТЕЗ 1-(2-ФЕНЭТИЛ)-2,2-ДИМЕТИЛПИПЕРИДИН-4-ОНА

Р. С. ВАРТАНЯН, В. О. МАРТИРОСЯН и С. А. ВАРТАНЯН

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

Поступило 3 III 1983

Известно, что 1-(2-фенэтил)-пиперидин-4-оны широко используются в качестве исходных соединений для получения новых синтетических обезболивающих веществ класса 4-анилинопиперидинов [1].

В связи с этим нами впервые разработан и осуществлен синтез 1-(2-фенэтил)-2,2-диметилпиперидин-4-она. Надо отметить, что ранее синтез 2,2-дизамещенных пиперидин-4-онов считался весьма проблематичным. В качестве исходного соединения в работе использован диметилвинилэтинилкарбинол, известными методами [2] превращенный в смесь β,β -диметилдивинилкетона и его метаксипроизводных, взаимодействие которой с β -фенэтиламином приводит к искомому пиперидону.

Полученный пиперидон выделить из реакционной смеси перегонкой не удалось. Его очистка осуществлена при помощи колоночной хроматографии.

Экспериментальная часть

ИК спектр снят на приборе UR-20, ПМР спектр—на «Varian T-60» с использованием в качестве внутреннего стандарта ТМС. Подготовка силикагеля для колоночной и тонкослойной хроматографии описана в [3].

1-(2-Фенэтил)-2,2-диметилпиперидин-4-он. Смесь 68 г β,β -диметилдивинилкетона и его метоксипроизводных, 37 г фенэтиламина и 55 мл воды нагревают на кипящей водяной бане 10 ч. Охлаждают, добавляют конц. соляную кислоту до pH 2—3, экстрагируют эфиром, водный конц. нейтрализуют 40% раствором гидроокиси натрия. Экстрагируют эфиром и сушат сульфатом магния. Отгоняют растворитель, остаток (35 г) очищают при помощи колоночной хроматографии: растворяют его в 100 мл бензола и вводят в колонку (70×10 см) с 1 кг силикагеля КСК (200—250 μ), активированного в течение 6 ч при 170°. Вымывают искомый пиперидон 2000 мл бензола. После отгонки бензола получают 20 г (30%) вязкой жидкости. R_f 0.72 (бензол—ацетон, 5:1). ИК спектр (тонкий слой): 1600 (C_6H_5), 1700 cm^{-1} ($C=O$). Спектр ПМР (в CCl_4): 7,22 с (5H, C_6H_5); 3,00—2,80 м (4H, 5- CH_2 , 6- CH_2); 2,62 с (2H, 3- CH_2); 2,43—2,00 м (4H; $-NCH_2CH_2-$); 1,0 с, м. д. (6H, 2 CH_3). Найдено %: С 78,0; Н 9,3; N 5,80. M^+ 230. $C_{15}H_{21}NO$. Вычислено %: С 77,9; Н 9,1; N 6,1. M^+ 230.

1. Dr. C. Janssen, Pat. Fr., 1, 344, 366 (1963).
2. И. Н. Назаров, В. М. Романов, Изв. АН СССР, ОХН, 559 (1940).
3. А. Г. Паносян, Г. М. Аветисян, В. А. Мнацаканян, Т. А. Асатрян, С. А. Вартамян, Р. Г. Борозян, С. Г. Батраков, Биоорганич. хим., 5, 242 (1979).

Армянский химический журнал, т. 37, № 11, стр. 725—728 (1984 г.)

УДК 547.56+547.564.4

β-ФЕНИЛ-β-АМИНОЭТАНОЛЫ

С. М. ДАВТЯН, Г. Л. ПАПАЯН и В. П. АКОПЯН

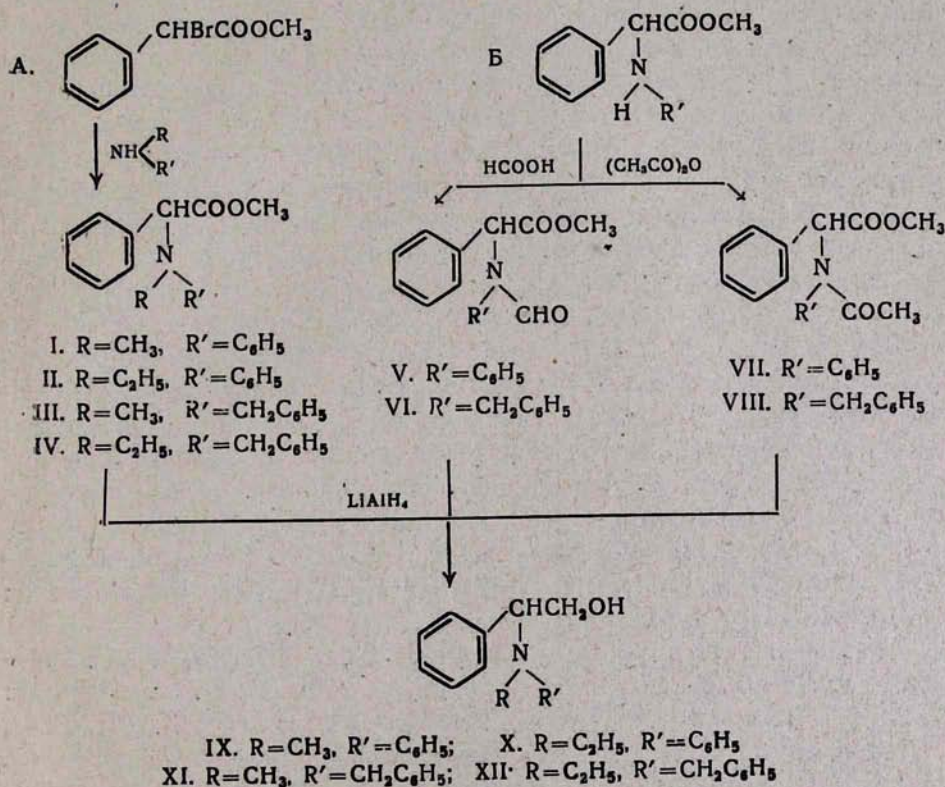
Институт тонкой органической химии им. А. Л. Миджояна

АН Армянской ССР, Ереван

Ереванский медицинский институт

Поступило 17 X 1983

В продолжение начатых работ [1] в настоящем сообщении описываются два метода синтеза новой группы β-фенил-β-аминоэтанолов по схеме.



По методу А метиловые эфиры аминифенилуксусных кислот получены конденсацией метилового эфира α-бромфенилуксусной кислоты с соответствующими аминами (I—IV). По методу же Б ранее синтези-