

ровку (ОСНСН₂—). Этот результат говорит о том, что в этих случаях

Cl

также имеет место образование α -хлорпроизводного эфира. Отметим, что все эти реакции сопровождаются выделением HCl. Из результатов можно полагать, что первичным актом является отщепление атома хлора, в результате разрыва связи C—Cl. Известно, что этот процесс протекает при $\lambda \geq 250$ нм [4].



Образовавшиеся частицы обуславливают радикально-цепной механизм с участием α -водорода эфиров. Взаимодействие радикала с молекулой и радикала с радикалом приводят к образованию выше идентифицированных продуктов реакции. В заключение отметим, что вышеизученные фотохимические реакции являются новыми примерами реакций, где проявляется участие α -водородов простых эфиров в химических превращениях [5].

Л И Т Е Р А Т У Р А

1. Маркарян Ш. А. — Арм. хим. ж., 1982, т. 35, № 5, с. 281; 1984, т. 37, № 1, с. 51, ЖОрХ, 1983, т. 19, с. 1553.
2. Stevenson D. P., Coppinger G. M. — J. Am. Chem. Soc., 1962, v. 84, № 1, p. 149
Sheridan J. P., Martire D. E., Tewari Y. B. — J. Am. Chem. Soc., 1972, v. 94 p. 3294.
3. Sonntag von C., Heuland K., Schuchman H.-P., Weeke F., Janssen E. — J. C. S. Perkin Trans. 2, 1975, № 2, p. 171.
4. Окабе Х. — Фотохимия малых молекул: М., Мир, 1981, с. 351.
5. Общая органическая химия—М., Химия, т. 2, 1982, с. 346.

Армянский химический журнал, т. 40, № 5, стр. 335—337 (1987 г.)

УДК 615.214.31.012.1.076.9

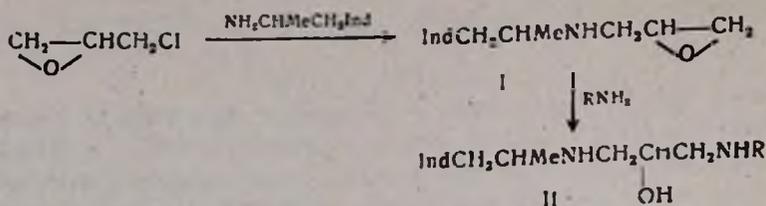
СИНТЕЗ ДИГИДРОХЛОРИДОВ N-[1-МЕТИЛ-2-(β -ИНДОЛИЛ)- ЭТИЛ]ДИАМИНОПРОПАНОЛОВ

А. Б. САРКИСЯН, Л. Ш. ПИРДЖАНОВ и Э. А. МАРКАРЯН

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

Поступило 7 IV 1986

Ранее нами было показано, что производные триптамина, имеющие в структуре аминопропанольную группировку, обладают избирательным β_2 -адреноблокирующим действием [1]. С целью дальнейшего изучения связи химической структуры с биологическим действием синтезированы соединения II.



IIa. R = *t*-Bu; б. R = CHMeCH₂Ph; в. R = CHMe(CH₂)₂Ph

Взаимодействием эпихлоргидрина с α -метилтриптамином в присутствии триэтиламина и последующей обработкой 40% водным раствором гидроокиси натрия получен эпоксипропиламин I. Раскрытие эпоксидного кольца проводили первичными аминами в присутствии каталитического количества воды. Строение конечных соединений II подтверждено ИК спектроскопией и данными элементного анализа, а чистота проверена хроматографически.

Изучение действия дигидрохлоридов II а—в на адренореактивную, сердечно-сосудистую и центральную нервную системы показало, что соединение IIа обладает умеренным β_1 -блокирующим действием, а соединение II в—слабой антиаритмической активностью. Соединения II а—в в больших дозах вызывали у животных гипотермию, угнетение двигательной активности, аддукцию конечностей, в малых дозах (10 мг/кг) не проявляют существенной психотропной активности*.

Экспериментальная часть

ТСХ проведена на окиси алюминия II степени активности в системе растворителей *n*-бутанол—уксусная кислота—вода (4 : 1 : 3). Проявитель—пары йода. ИК спектры сняты на приборе UR-20 в вазелиновом масле.

N-[1-Метил-2-(β -индолил)этил]-2,3-эпоксипропиламин (I). К 3,48 г (0,02 моля) α -метилтриптамина в 100 мл хлороформа и 2,02 г (0,02 моля) триэтиламина прибавляют при 20—22° 1,91 г (0,02 моля) эпихлоргидрина. Смесь перемешивают в течение 2—3 ч, затем нагревают при 50—55° 4—5 ч. После декантирования хлороформного раствора маслообразное вещество нагревают в 100 мл 40% водного раствора гидроокиси натрия при 60—65° в течение 2—3 ч, образовавшиеся кристаллы отделяют, промывают холодной водой, высушивают в эксикаторе. Выход 13,1 г (46%), т. пл. 72—73° (из эфир-ацетона 5 : 1), R_f 0,60. Найдено %: С 72,60; Н 8,00; N 12,13. С₁₄Н₁₈Н₂О. Вычислено %: С 73,04; Н 7,82; N 12,19. ИК спектр, ν , см⁻¹: 3400 (NH индола), 3300 (NH), 3050 (С—Н аром.), 1610 (С=С аром.).

Дигидрохлорид *N*-[1-метил-2-(β -индолил)этил]-*N'*-(1-метил-2-фенил)этил-1,3-диамино-2-пропанола (IIб). К 2,3 г (0,01 моля) соединения I в 50 мл изопропилового спирта прибавляют 2,7 г (0,02 моля) фенил-

* Авторы выражают благодарность сотрудникам биологического отдела ИТОХ тов. Норавяну О. С., Маркряну К. Ж., Саркисян Н. С. за исследование биологических свойств синтезированных соединений.

изопропиламина и I каплю воды. Смесь кипятят с обратным холодильником в течение 18—20 ч, растворитель отгоняют, от избытка амина освобождаются перегонкой при 70—72°/1 мм. Остаток растворяют в 50 мл безводного ТГФ и прибавлением эфирного раствора HCl получают дигидрохлорид IIб. Перекристаллизовывают из смеси эфир-этанол (10:1). Выход IIб 1,5 г (35%), т. пл. 152—153°, $R_{\text{осн}}$ 0,76. Найдено %: С 63,33; Н 7,63; Cl⁻ 16,18; N 9,18. $C_{22}H_{23}Cl_2N_3O$. Вычислено %: С 63,01; Н 7,53; Cl⁻ 15,98; N 9,59. ИК спектр, ν , cm^{-1} : 3600—3100

(широкая полоса ассоц. NH, OH), 2850 (NH_2^+), 1610—1590 (C=C аром.).

Дигидрохлорид N-[1-метил-2-(β -индолил)этил]-N'-(1-метил-3-фенил)пропил-1,3-диамино-2-пропанола (IIв). Получен аналогично IIб. Выход IIв 1,7 г (38%), т. пл. 115—116° (из смеси эфир-этанол 10:1), $R_{\text{осн}}$ 0,75. Найдено %: С 63,35; Н 8,02; Cl⁻ 15,33; N 8,80. $C_{24}H_{25}Cl_2N_3O$. Вычислено %: С 63,71; Н 7,74; Cl⁻ 15,73; N 9,29. ИК спектр, ν , cm^{-1} :

3600—3100 (широкая полоса ассоц. NH, OH), 2840 (NH_2^+), 1620 (C=C аром.).

Дигидрохлорид N-[1-метил-2-(β -индолил)этил]-N'-третбутил-1,3-диамино-2-пропанола (IIа). Получен аналогично IIб, но в запаянной трубке на масляной бане при 120—140°. Выход IIа 2,03 г (54%), т. пл. 140—141° (из смеси эфир-этанол 10:1), $R_{\text{осн}}$ 0,78. Найдено %: С 56,86; Н 8,78; Cl⁻ 18,98; N 10,78. $C_{25}H_{31}Cl_2N_3O$. Вычислено %: С 57,44; Н 8,24; Cl⁻ 18,88; N 11,17. ИК спектр, ν , cm^{-1} : 3600—3100

(широкая полоса ассоц. NH, OH), 2820 (NH_2^+), 1620 (C=C аром.).

ЛИТЕРАТУРА

1. Саркисян А. Б., Соломина Л. П., Пирджанов Л. Ш., Маркарян Э. А., Арзануни Э. М., Саркисян Н. С., Нораян О. С. — Хим.-фарм. ж., 1985, т. 19, № 9, с. 423.