

сти, т. кип. 250—252°/2 мм. Найдено %: С 74,48; Н 8,01; N 6,47.  
C<sub>27</sub>H<sub>38</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub>. Вычислено %: С 74,45; Н 8,04; N 6,43. R<sub>f</sub> 0,48 (хлороформ:  
метанол, 5:1). ИК спектр, ν, см<sup>-1</sup>: 1600 (C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>), 1660 (NCEt), 1720

(OCEt).

||  
O

2,5-դիմեթիլ-1-(2'-պրոպիոնիլօքսի-2'-ֆենէթիլ)-4-պրոպիլանիլնոպիրի-  
ՊԵՐԻԴԻՆԻ ՍԻՆԹԵԶԸ ԵՎ ԱԿՏԻՎՈՒԹՅՈՒՆԸ

Բ. Ս. ՎԱՐԴԱՆԻԱՆ, Վ. Հ. ՄԱՐՏԻՐՈՍԻԱՆ, Լ. Վ. ՄԱԹԵՎՈՍՅԱՆ Ե Ս. Հ. ՎԱՐԴԱՆԻԱՆ

Ելնելով 2,5-դիմեթիլ-4-պիպերիդոնից, սինթեզված է 2,5-դիմեթիլ-1-(2'-  
պրոպիոնիլօքսի-2'-ֆենէթիլ)-4-պրոպիլանիլնոպիրիդինը և ուսումնա-  
սիրված է նրա ցավազրկող ակտիվությունը:

## SYNTHESIS AND ACTIVITY OF 2,5-DIMETHYL-1-(2'-PROPIONYL- OXY-2'-PHENETHYL)-4-PROPIONYLANILINOPIPERIDINE

R. S. VARTANIAN, V. H. MARTIROSSIAN, L. V. MATEVOSSIAN  
and S. H. VARTANIAN

Starting from 2,5-dimethyl-4-piperidone the synthesis of 2,5-di-  
methyl-1-(2'-propionyloxy-2'-phenethyl-3)-4-propionylanilino-  
piperidine has been carried out and its analgesic activity has been studied.

### Л И Т Е Р А Т У Р А

1. Yin W. Q. and others — Sci. Sin., vol. 24, № 5, p. 710, C. A., 1981, vol. 95, 115220.

Армянский химический журнал, т. 40, № 9, стр. 596—598 (1987 г.)

### КРАТКИЕ СООБЩЕНИЯ

УДК 547.552.2

## СИНТЕЗ ГЕКСАГИДРОПИРИДАЗИН-4-ОНОВ

Р. С. ВАРТАНЯН, А. Л. ГЮЛЬБУДАГЯН и А. Х. ХАНАМИРЯН

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

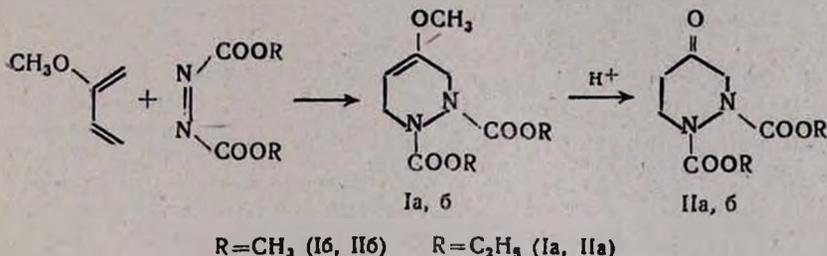
Поступило 26 V 1987

Производные гексагидропиридазина (пиперидазина) как аза-анало-  
га пиперидина представляют интерес с точки зрения изучения их био-  
логических свойств. Однако они практически не исследованы, что связа-  
но с отсутствием способов синтеза их функциональных производных.  
С целью расширения синтетических возможностей в ряду пиперидина  
нами предпринята попытка получить ранее не описанные пиперидазин-

4-оны, которые могли бы явиться ключевыми соединениями в синтезе различных замещенных пиперидазинов.

В литературе описана одна неудачная попытка гидролизовать 1,2-диэтоксикарбонил-4-хлор-1,2,3,6-тетрагидропиридазин в соответствующее оксопроизводное [1].

1,2-Диалкоксикарбонилпиперидазин-4-оны II а,б нами получены кислотным гидролизом соответствующих 1,2-диалкоксикарбонил-4-метокси-1,2,3,6-тетрагидропиридазинов I а, б, которые в свою очередь синтезированы взаимодействием 2-метокси-1,3-бутадиена с эфирами азодикарбоновой кислоты по реакции Дильса-Альдера.



Как реакция циклоприсоединения, так и гидролиз винилового эфира протекают экзотермично и приводят с высокими выходами к целевым продуктам.

### Экспериментальная часть

ИК спектры сняты на приборе UR-20 в вазелиновом масле спектры ПМР-на приборе «Varian T-60» (60 МГц) в  $\text{CCl}_4$  с использованием в качестве внутреннего стандарта ТМС. ТСХ проводили на пластинках «Silufol UV-254» в системе ацетон—гексан 1:1.

*1,2-Диэтоксикарбонил-4-метокси-1,2,3,6-тетрагидропиридазин (I а).*  
 К 17,4 г (0,1 моля) диэтилового эфира азодикарбоновой кислоты при перемешивании и охлаждении водой приливают 9,3 г (0,11 моля) 2-метокси-1,3-бутадиена. После окончания экзотермической реакции перемешивание продолжают еще 1 ч, затем смесь разгоняют. Получают 20,6 г (80%) соединения Ia с т. кип. 152—154°/2 мм,  $R_f$  0,61. Найдено %: С 51,29; Н 7,41; N 11,38.  $\text{C}_{11}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_5$ . Вычислено %: С 50,99; Н 7,00; N 10,81. ИК спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 1650 (C=C). Спектр ПМР,  $\delta$ , м. д.: 4,75—4,43 м (1H, CH), 4,40—3,66 м (4H,  $\text{CH}_2$ ), 4,08 кв (4H,  $2\text{OCH}_2$ ,  $J=7$  Гц), 3,55 с (3H,  $\text{OCH}_3$ ), 1,26 т (6H,  $2\text{CH}_3$ ,  $J=7$  Гц).

*1,2-Диметоксикарбонил-4-метокси-1,2,3,6-тетрагидропиридазин (Iб).*  
 Аналогично из 14,6 г (0,1 моля) диметилового эфира азодикарбоновой кислоты и 9,3 г (0,11 моля) 2-метокси-1,3-бутадиена получают 20,0 г (80%) соединения Iб с т. кип. 134—136°/1 мм,  $R_f$  0,55. Найдено %: С 47,11; Н 6,21; N 12,43.  $\text{C}_9\text{H}_{14}\text{N}_2\text{O}_5$ . Вычислено %: С 46,96; Н 6,09; N 12,17.

*1,2-Диэтоксикарбонилпиперидазин-4-он (IIа).* 25,8 г (0,1 моля) соединения Ia растворяют в равном объеме воды и подкисляют разбавленной соляной кислотой до слабокислой реакции. Смесь при этом разогревается. Через 0,5 ч экстрагируют 3 раза по 30 мл хлороформа, хлоро-

формные вытяжки промывают небольшим количеством воды и сушат серноокислым магнием. После отгонки растворителя остаток перегоняют. Получают 23,2 г (95%) IIa с т. кип. 145—148°/1 мм,  $R_f$  0,43. Найдено %: С 49,42; Н 6,78; N 11,80.  $C_{10}H_{16}N_2O_6$ . Вычислено %: С 49,18; Н 6,56; N 11,47. ИК спектр,  $\nu$ ,  $cm^{-1}$ : 1710 (C=O, кет.), 1720 (C=O, эфир.). Спектр ПМР,  $\delta$ , м. д.: 4,66—3,16 м (4H, 2NCH<sub>2</sub>), 4,18 кв (4H, 2CH<sub>2</sub>O, J=7 Гц), 2,52 т (2H, 5CH<sub>2</sub>, J=6 Гц), 1,26 т (6H, 2CH<sub>3</sub>, J=7 Гц).

1,2-Диметоксикарбонилпиперидазин-4-он (IIб). Аналогично из 23,0 г (0,1 моля) соединения Iб получают 19,2 г IIб с т. кип. 155—160°/2 мм,  $R_f$  0,40. Найдено %: С 44,19; Н 5,21; N 13,23.  $C_8H_{12}N_2O_6$ . Вычислено %: С 44,44; Н 5,55; N 12,96.

#### Л И Т Е Р А Т У Р А

1. Карагезян К. С., Татевосян Г. Т. — Арм. хим. ж., 1968, т. 21, № 2, с. 179.