

ՀԱՅԱՍՏԱՆԻ ՀԱՆՐԱՊԵՏՈՒԹՅԱՆ ԳԻՏՈՒԹՅՈՒՆՆԵՐԻ
ԱԶԳԱՅԻՆ ԱՎԱԴԵՄԻԱ
НАЦИОНАЛЬНАЯ АКАДЕМИЯ НАУК РЕСПУБЛИКИ
АРМЕНИЯ

Հայաստանի քիմիական հան դեռ 64, №4, 2011 Химический журнал Армении

УДК 547.233+547.59

СИНТЕЗ НОВЫХ N-ЗАМЕЩЕННЫХ
1-ФЕНИЛ-1-ЦИКЛОПЕНТИЛМЕТИЛАМИНОВ

А. А. АГЕКЯН, Г. Г. МКРЯН, А. С. ЦАТИНЯН, О. С. НОРАВЯН, Т. Г. ГУКАСЯН,
Э. А. ШИРИНЯН и Э. А. МАРКАРЯН

Научно-технологический центр органической и фармацевтической химии

НАН Республики Армения

Институт тонкой органической химии им. А.Л.Мнджояна

Армения, 0014, Ереван, пр. Азатутян, 26

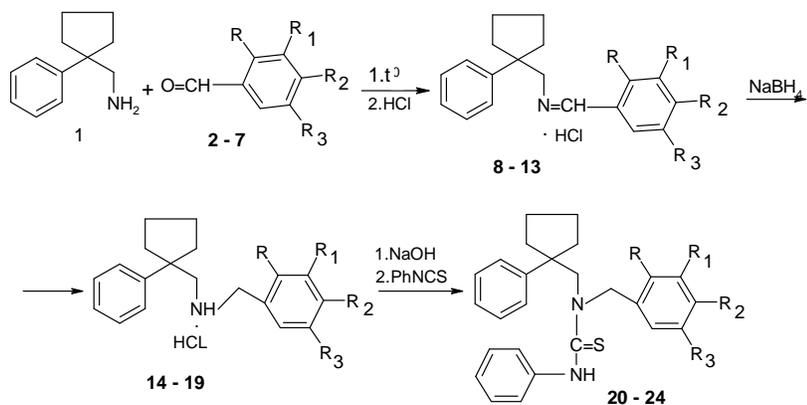
Факс: (28-83-37) E-mail: avagal@mail.ru

Поступило 20 XII 2010

Взаимодействием фенилциклопентилметиламина с нитро-, ди- или триалкоксибензальдегидами синтезированы основания Шиффа. Последние восстановлены боргидридом натрия до соответствующих аминов, на основе которых получены 1,1,3-тризамещенные тиомочевины. Изучены биологические свойства всех синтезированных соединений.

Библ. ссылок 9.

Ранее сообщалось об исследованиях в области синтеза N-алкилзамещенных производных фенилциклопентилметиламина, обладающих широким спектром биологического действия [1-3]. В продолжение исследований в этой области в настоящей работе описан синтез N-бензилзамещенных производных, на основе которых получены тризамещенные тиомочевины. Синтез вторичных аминов осуществлен через основания Шиффа, которые также представляют интерес с точки зрения биологической активности [4,5].



2,8,14,20. R=R₁=R₃=H, R₂=NO₂; **3,9,15,21.** R=R₂=R₃=H; R₁=NO₂; **4,10,16,21.** R₁=R₃=H, R=R₂=OCH₃; **5,11,17,22.** R=R₃=H, R₁=R₂=OCH₃; **6,12,18,23.** R=R₃=H, R₁=OCH₃, R₂=OC₂H₅; **7,13,19,24.** R₁=H, R=R₂=R₃=OCH₃.

Взаимодействием фенилциклопентилметиламина **1** [6] с бензальдегидами **2-7**, содержащими электронодонорные и электроноакцепторные заместители, получены основания Шиффа с 60-70% выходами. Все они, кроме соединения **8**, являются маслообразными веществами и разлагаются при перегонке, поэтому они охарактеризованы в виде гидрохлоридов **8-13**. Соединения **8-13** восстановлены боргидридом натрия до соответствующих аминов, которые являются маслообразными соединениями и во избежание быстрой карбонизации переведены в гидрохлориды **14-19**. Последние перед использованием подщелачивались разбавленным раствором едкого натра. Взаимодействием полученных оснований с фенилизотиоцианатом синтезированы несимметричные 1,1,3-тризамещенные тиомочевины **20-24**.

В ИК-спектрах гидрохлоридов вторичных аминов **14-19** имеются полосы поглощения в области 1590,1610 cm^{-1} , характерные для ароматического кольца, 2700-2800 cm^{-1} – для NH₂⁺ связи, и отсутствуют полосы поглощения в области 1660-1680 cm^{-1} , характерные для C=N связи оснований Шиффа **8-13**.

Строение синтезированных соединений подтверждено также ЯМР¹H спектральным методом, чистота установлена хроматографическим методом, а состав – элементным анализом.

В *in vivo* экспериментах исследовалась способность воздействия синтезированных соединений на β₁- и β₂-адренорецепторные структуры сердца и сосудов, а также на повышение выносливости лабораторных животных (крысы) к недостатку кислорода во вдыхаемом воздухе. В *in vitro* опытах на семявыносящем протоке крыс изучались симпатолитические и адренопозитивные свойства соединений [7-9].

Выявлено, что синтезированные соединения не обладают β-адреноблокирующими и антигипоксическими эффектами, а также свойством

блокировать α -адренорецепторную реакцию органа на экзогенный норадреналин.

Однако у некоторых представителей изучаемого ряда (10-12, 16-18, 21) проявлялась тенденция к проявлению в опытах *in vivo* нерезко выраженной β_1 - и β_2 -адреномиметической активности (от 15 до 40%), а в опытах *in vitro* – кратковременных симпатолитических и норадреналин-опосредуемой α -адреномиметических свойств. Среди N-замещенных 1-фенилциклопентилметиламинов наиболее активным и перспективным является гидрохлорид N-(2',4',5'-триметоксибензил)-1-фенилциклопентил-1-метиламина (19), у которого выявлена почти 100% симпатолитическая активность, проявляющаяся в течение всего эксперимента.

Экспериментальная часть

Спектры ЯМР¹ Н сняты на приборе “Mercury -300 Varian” с рабочей частотой 300 МГц в DMSO-d₆, внутренний стандарт – ТМС. ИК-спектры сняты на спектрометре “Nicolet Avatar 330 FT-IR” в вазелиновом масле. Температуры плавления определены на микронагревательном столике «Боэциус». ТСХ проведена на пластинках “Silufol UV-254” в системах бутанол–уксусная кислота–вода (5:3:3) для гидрохлоридов 14-19 и бензол–эфир (3:1) для соединений 20-24; проявитель – пары йода.

Фенилциклопентилметиламин 1 получен по [6].

N-(4'-Нитробензилиден)-1-фенилциклопентил-1-метиламин (8). Смесь 3,5 г (0,02 моля) амина 1 и 3 г (0,02 моля) 4-нитробензальдегида (2) в 100 мл абс.бензола кипятят в аппарате Дина-Старка 8 ч. Отгоняют растворитель и кристаллический остаток перекристаллизовывают из спирта. Выход 3,8 г (61,6%), т.пл. 54-55°C. Найдено, %: С 73,86, Н 6,39, N 9,17. С₁₉Н₂₀N₂O₂. Вычислено, %: С 74,00; Н 6,54, N 9,08. ИК-спектр, ν , см⁻¹: 1643 (N=CH); 1597,1585 (аром.кольцо). Спектр ЯМР ¹Н, δ , м.д., Гц: 1.68-2.01 (м, 6Н) и 2.11-2.22 (м, 2Н, С₅Н₈); 3.71 (д, 2Н, J=1.4, NCH₂); 7.04-7.10 (м, 1Н) и 7.14-7.23 (м, 4Н, С₆Н₅); 7.82 (м, 2Н) и 8.20 (м, 2Н, С₆Н₄); 8.01(т, 1Н, J=1.4, NH). Т. пл. гидрохлорида 185-187°C (ацетон).

Общая методика получения гидрохлоридов оснований Шиффа 9-13. Смесь 0,02 моля амина 1 и 0,02 моля замещенного бензальдегида (3-7) в 100 мл абс. бензола кипятят в аппарате Дина-Старка до прекращения выделения воды (8-10 ч). Отгоняют растворитель, остаток растворяют в эфире и действием эфирного раствора хлористого водорода получают гидрохлорид, перекристаллизовывают из ацетона.

Гидрохлорид N-(3'-нитробензилиден)-1-фенилциклопентил-1-метиламина (9). Выход 65%, т.пл.167-169°C. Найдено,%: С 66,31; Н 6,04; N 8,27; Cl 10,35. С₁₉Н₂₀N₂O₂·HCl. Вычислено, %: С 66,18; Н 6,13; N 8,12; Cl 10,28. ИК-спектр, ν , см⁻¹: 1651 (N=CH); 1593, 1590 (аром.кольцо).

Гидрохлорид N-(2',4'-диметоксибензилиден)-1-фенилциклопентил-1-метиламина (10). Выход 61%, т.пл. 175-177°C. Найдено, %: С 70.23; Н 7.39; N 3.76; Cl 9.71. $C_{21}H_{25}NO_2 \cdot HCl$. Вычислено, %: С 70.08; Н 7.28; N 3.89; Cl 9.85. ИК-спектр, ν , cm^{-1} : 1645 (N=CH), 1602, 1590 (аром. кольцо). Спектр ЯМР 1H , δ , м.д., Гц: 1.68-1.82 (м, 2H), 1.90-2.03 (м, 4H) и 2.25-2.35 (м, 2H, C₅H₈); 3.79 (с, 3H, OCH₃); 3.80 (ш, 2H, NCH₂); 3.94 (с, 3H, OCH₃); 6.54 (д, 1H, J=2.2, 3-Н С₆Н₃); 6.71 (дд, 1H, J₁=9.0, J₂=2.2, 5-Н С₆Н₃); 7.16-7.31 (м, 5H, С₆Н₅); 7.53 (д, 1H, J=16.0, N=CH); 8.68 (д, 1H, J=9.0, 6-Н С₆Н₃); 13.85 (уш.д., 1H, J=16.0, HCl).

Гидрохлорид N-(3',4'-диметоксибензилиден)-1-фенилциклопентил-1-метиламина (11). Выход 68%, т.пл. 173-175°C. Найдено, %: С 71.17; Н 7.39; N 4.01; Cl 9.98. $C_{21}H_{25}NO_2 \cdot HCl$. Вычислено, %: С 70.08; Н 7.28; N 3.89; Cl 9.85. ИК-спектр, ν , cm^{-1} : 1657 (N=CH); 1597, 1590 (аром. кольцо). Спектр ЯМР 1H , δ , м.д., Гц: 1.70-1.84 (м, 2H), 1.91-2.05 (м, 4H) и 2.31-2.44 (м, 2H, C₅H₈); 3.80 (ш, 2H, NCH₂); 3.91 (с, 3H, OCH₃); 3.95 (с, 3H, OCH₃); 6.94 (д, 1H, J=8.4, 5-Н С₆Н₃); 7.13 (дд, 1H, J₁=8.4, J₂=1.9, 6-Н С₆Н₃); 7.15-7.27 (м, 5H, С₆Н₅); 7.35 (уш.д., 1H, J=14.7, =CH); 8.58 (д, 1H, J=1.9, 2-Н С₆Н₃); 14.60 (ш, 1H, HCl).

Гидрохлорид N-(3'-метокси-4'-этоксibenзилиден)-1-фенилциклопентил-1-метиламина (12). Выход 63%, т.пл. 160-162°C. Найдено, %: С 70.53; Н 7.41; N 3.54; Cl 9.65. $C_{22}H_{27}NO_2 \cdot HCl$. Вычислено, %: С 70.67; Н 7.55; N 3.74; Cl 9.48. ИК-спектр, ν , cm^{-1} : 1661 (N=CH); 1593, 1590 (аром. кольцо). Спектр ЯМР 1H , δ , м.д., Гц: 1.46 (т, 3H, J=7.0, $\underline{CH_3CH_2O}$); 1.72-1.84 (м, 2H), 1.91-2.05 (м, 4H) и 2.31-2.43 (м, 2H, C₅H₈); 3.79 (ш, 2H, NCH₂); 3.95 (с, 3H, OCH₃); 4.15 (к, 2H, J=7.0, OCH₂); 6.91 (д, 1H, J=8.4, 5-Н С₆Н₃); 7.11 (дд, 1H, J₁=8.4, J₂=1.8, 6-Н С₆Н₃); 7.15-7.27 (м, 5H, С₆Н₅); 7.32 (ушир.д., 1H, J=15.0, N=CH); 8.58 (ушир., 1H, 2-Н С₆Н₃); 14.59 (ушир.д., 1H, J=15.0, HCl).

Гидрохлорид N-(2',4',5'-триметоксибензилиден)-1-фенилциклопентил-1-метиламина (13). Выход 61%, т.пл. 156-158°C. Найдено, %: С 67.91; Н 7.43; N 3.31; Cl 8.75. $C_{22}H_{27}NO_3 \cdot HCl$. Вычислено, %: С 67.76; Н 7.24; N 3.59; Cl 9.09. ИК-спектр, ν , cm^{-1} : 1660 (N=CH); 1600, 1595 (аром. кольцо). Спектр ЯМР 1H , δ , м.д., Гц: 1.69-1.83 (м, 2H), 1.90-2.06 (м, 4H) и 2.28-2.40 (м, 2H, C₅H₈); 3.73 (с, 3H, OCH₃); 3.76 (ш, 2H, CH₂N); 3.90 (с, 3H, OCH₃); 3.95 (с, 3H, OCH₃); 6.57 (с, 1H, С₆Н₂); 7.16-7.30 (м, 5H, С₆Н₅); 7.37 (д, 1H, J=16.3, =CH); 8.47 (с, 1H, С₆Н₂); 14.04 (ушир.д., 1H, J=16.3, HCl).

Общая методика получения гидрохлоридов 14-19. К 0,01 моля соединений **8-13** в 50 мл метанола при 0° маленькими порциями прибавляют 0,05 моля боргидрида натрия. Оставляют на ночь при комнатной температуре. Отгоняют растворитель, к остатку добавляют 50 мл воды и экстрагируют бензолом (3(30 мл)). Бензольный экстракт сушат сернокислым натрием. Растворитель отгоняют. К остатку добавляют 50 мл абс. эфира и

действием эфирного раствора хлористого водорода получают гидрохлориды **14-19**, перекристаллизованные из сухого ацетона.

Гидрохлорид N-(4'-нитробензил)-1-фенилциклопентил-1-метиламина (14). Выход 73%, т.пл. 202-204°C, R_f 0.51. Найдено, %: С 65.91; Н 6.53; N 7.89; Cl 10.09. С₁₉H₂₂N₂O₂·HCl. Вычислено, %: С 65.79; Н 6.68; N 8.07; Cl 10.22. Спектр ЯМР¹H, δ, м.д., Гц: 1.60-1.85 (м, 4H) и 1.95-2.15 (м, 4H, C₅H₈); 3.02 (т, 2H, J=5.4, NCH₂); 4.01 (т, 2H, J=4.2, NCH₂Ar); 7.16-7.31 (м, 5H, C₆H₅); 7.50 (м, 2H) и 7.81 (м, 2H, C₆H₄); 9.32 (ш, 2H, NH+HCl).

Гидрохлорид N-(3'-нитробензил)-1-фенилциклопентил-1-метиламина (15). Выход 71%, т.пл. 188-190°C, R_f 0.55. Найдено, %: С 65.85; Н 6.79; N 8.18; Cl 10.12. С₁₉H₂₂N₂O₂·HCl. Вычислено, %: С 65.79; Н 6.68; N 8.07; Cl 10.22. Спектр ЯМР¹H, δ, м.д., Гц: 1.58-1.83 (м, 4H) и 1.94-2.14 (м, 4H, C₅H₈); 3.01 (т, 2H, J=5.4, NCH₂); 4.01 (т, 2H, J=4.2, NCH₂Ar); 7.15-7.30 (м, 5H, C₆H₅); 7.56 (т, 1H, J=8.0, 5-Н C₆H₄); 7.98 (ушир.д, J=8.0, 6-Н C₆H₄); 8.16 (ддд, 1H, J₁=8.0, J₂=2.2, J₃=1.0, 4-Н C₆H₄); 8.27 (дд, 1H, J₁=2.2, J₂=1.0, 2-Н C₆H₄); 9.57 (ш, 2H, NH+HCl)

Гидрохлорид N-(2',4'-диметоксибензил)-1-фенилциклопентил-1-метиламина (16). Выход 70%, т.пл. 168-170°C, R_f 0.61. Найдено, %: С 69.57; Н 7.95; N 3.98; Cl 9.96. С₂₁H₂₇NO₂·HCl. Вычислено, %: С 69.69; Н 7.80; N 3.87; Cl 9.80. Спектр ЯМР¹H, δ, м.д., Гц: 1.59- 1.84 (м, 4H), 1.96 (м, 2H) и 2.10 (м, 2H, C₅H₈); 2.96 (м, 2H, NCH₂); 3.61 (с, 3H, OCH₃); 3.79 (с, 3H, OCH₃); 3.79 (ш, 2H, NCH₂Ar); 6.35 (д, 1H, J=2.4, 3-Н C₆H₃); 6.42 (дд, 1H, J₁=8.4, J₂=2.4, 5-Н C₆H₃); 7.18-7.30 (м, 6H, C₆H₅ и 6-Н C₆H₃); 8.87 (ш, 2H, NH+HCl).

Гидрохлорид N-(3',4'-диметоксибензил)-1-фенилциклопентил-1-метиламина (17). Выход 72%, т.пл. 176-178°C, R_f 0.58. Найдено, %: С 69.74; Н 7.98. N 4.02; Cl 9.71. С₂₁H₂₇NO₂·HCl. Вычислено, %: С 69.69; Н 7.80; N 3.87; Cl 9.80. Спектр ЯМР¹H, δ, м.д., Гц: 1.57-1.76 (м, 4H) и 1.93-2.11(м, 4H, C₅H₈); 2.92 (м, 2H, NCH₂); 3.73 (м, 2H, NCH₂Ar); 3.74 (с, 3H, OCH₃); 3.79 (с, 3H, OCH₃); 6.74- 6.80 (м, 2H, 5,6-Н C₆H₃); 7.16-7.31 (м, 5H, C₆H₅); 7.27 (д, 1H, J=1.6, 2-Н C₆H₃); 9.29 (ш, 2H, NH+HCl).

Гидрохлорид N-(3'-метокси-4'-этоксibenзил)-1-фенилциклопентил-1-метиламина (18). Выход 70%, т.пл. 155-156°C, R_f 0.59. Найдено, %: С 70.62; Н 8.17; N 3.84; Cl 9.58. С₂₂H₂₉NO₂·HCl. Вычислено, %: С 70.28; Н 8.04; N 3.73; Cl 9.43. Спектр ЯМР¹H, δ, м.д., Гц: 1.51 (т, 3H, J=7.0, CH₃CH₂O); 1.72-1.85 (м, 4H) и 1.93-2.05 (м, 4H, C₅H₈); 2.92 (ш, 2H, NCH₂); 3.75 (м, 2H, NCH₂Ar); 3.81 (с, 3H, OCH₃); 4.05 (к, 2H, J=7.0, OCH₂), 6.76-6.81 (м, 2H, 5,6-Н C₆H₃); 7.15-7.30 (м, 5H, C₆H₅); 7.27 (д, 1H, J=1.6, 2-Н C₆H₃); 9.29 (ш, 2H, NH+ HCl).

Гидрохлорид N-(2',4',5'-триметоксибензил)-1-фенилциклопентил-1-метиламина (19). Выход 68%, т.пл. 130-132°C, R_f 0.60. Найдено, %: С 67.56; Н 7.89; N 3.69; Cl 9.21. С₂₂H₂₉NO₃·HCl. Вычислено, %: С 67.41; Н 7.71; N 3.57; Cl 9.05. Спектр ЯМР¹H, δ, м.д., Гц: 1.58-1.81 (м, 4H) и 1.91-2.13 (м,

4H, C₅H₈); 2.95 (т, 2H, J=5.9, NCH₂); 3.67 (с, 3H, OCH₃); 3.71 (с, 3H, OCH₃); 3.81 (т, 2H, J=4.8, NCH₂Ar); 3.83 (с, 3H, OCH₃); 6.49 (с, 1H, 3-Н C₆H₂); 7.18 (с, 1H, 6-Н C₆H₂); 7.16-7.30 (м, 5H, C₆H₅); 8.99 (ш, 2H, NH+HCl).

Общая методика получения тризамещенных тиомочевин 20-24. Смесь 0,01 моля оснований **14-18** и 0,01 моля фенилизотиоцианата в 50 мл абс. спирта кипятят в течение 3 ч. По охлаждении отфильтровывают образовавшиеся кристаллы, перекристаллизовывают из спирта.

1-(4'-Нитробензил)-3-фенил-1-(1-фенилциклопентил-1-метил)тиомочевина (20). Выход 72%, т.пл. 102-103°C. R_f 0.48. Найдено, %: С 70.23; Н 6.29; N 9.56; S 7.29. C₂₆H₂₇N₃O₂S. Вычислено, %: С 70.09; Н 6.11; N 9.43; S 7.18. ИК-спектр, ν, см⁻¹: 3246 (NHC=S); 1605, 1595 (аром.кольцо).

1-(3'-Нитробензил)-3-фенил-1-(1-фенилциклопентил-1-метил)тиомочевина (21). Выход 76%, т.пл. 112-114°C, R_f 0.50. Найдено, %: С 70.19; Н 6.23; N 9.52; S 7.30. C₂₆H₂₇N₃O₂S. Вычислено, %: С 70.09; Н 6.11; N 9.43; S 7.18. Спектр ЯМР¹H, δ, м.д., Гц: 1.63 (м, 2H), 1.88 (м, 2H) и 1.96-2.16 (м, 4H, C₅H₈); 4.09 (с, 2H, NCH₂); 4.49 (с, 2H, NCH₂Ar); 7.08 (тт, 1H, J₁=7.1, J₂=1.5, 4-Н NC₆H₅); 7.15-7.28 (м, 5H) и 7.32-7.41 (м, 5H, NC₆H₅, C₆H₅ и 6-Н C₆H₄); 7.52 (т, 1H, J=8.0, 5-Н C₆H₄); 7.77 (дд, 1H, J₁=2.2, J₂=1.8, 2-Н C₆H₄); 8.04 (ддд, 1H, J₁=8.0, J₂=2.2, J₃=0.9, 4-Н C₆H₄); 9.04 (с, 1H, NH).

1-(2',4'-Диметоксибензил)-3-фенил-1-(фенилциклопентил-1-метил)тиомочевина (22). Выход 73%, т.пл. 92-94°C, R_f 0.54. Найдено, %: С 73.18; Н 7.13; N 6.13; S 7.12. C₂₈H₃₂N₂O₂S. Вычислено, %: С 73.02; Н 7.00; N 6.08; S 6.95. ИК-спектр, ν, см⁻¹: 3254 (NHC=S); 1600, 1590 (аром.кольцо).

1-(3',4'-Диметоксибензил)-3-фенил-1-(1-фенилциклопентил-1-метил)тиомочевина (23). Выход 71%, т.пл. 99-100°C, R_f 0.49. Найдено, %: С 73.21; Н 7.17; N 6.20; S 7.15. C₂₈H₃₂N₂O₂S. Вычислено, %: С 73.02; Н 7.00; N 6.08; S 6.95. ИК-спектр, ν, см⁻¹: 3246 (NHC=S). Спектр ЯМР¹H, δ, м.д., Гц: 1.63 (м, 2H), 1.81-2.03 (м, 4H), 2.07-2.17 (м, 2H, C₅H₈); 3.73 (с, 3H, OCH₃); 3.75 (с, 3H, OCH₃); 4.03 (с, 2H, NCH₂); 4.25 (с, 2H, NCH₂); 6.43 (дд, 1H, J₁=8.2, J₂=2.0, 6-Н C₆H₃); 6.51 (д, 1H, J=2.0, 2-Н C₆H₃); 6.73 (д, 1H, J=8.2, 5-Н C₆H₃); 7.05 (тт, 1H, J₁=7.0, J₂=1.6, 4-Н NC₆H₅); 7.15-7.26 (м, 5H) и 7.31-7.41 (м, 4H C₆H₅ и NC₆H₅); 8.86 (с, 1H, NH).

1-(3'-Метокси-4'-этоксibenзил)-3-фенил-1-(1-фенилциклопентил-1-метил)тиомочевина (24). Выход 70%, т.пл. 96-98°C, R_f 0.56. Найдено, %: С 73.50; Н 7.35; N 6.02; S 6.67. C₂₉H₃₄N₂O₂S. Вычислено, %: С 73.39; Н 7.22; N 5.90; S 6.74. Спектр ЯМР¹H, δ, м.д., Гц: 1.38 (т, 3H, J 7.0, CH₃CH₂O); 1.56-1.70 (м, 2H), 1.82-2.03 (м, 4H) и 2.07-2.17 (м, 2H, C₅H₈); 3.73 (с, 3H, OCH₃); 3.96 (к, 2H, J=7.0, OCH₂); 4.03 (ш, 2H, NCH₂); 4.24 (ш, 2H, NCH₂); 6.41 (дд, 1H, J₁=8.1, J₂=2.0, 6-Н C₆H₃); 6.50 (д, 1H, J=2.0, 2-Н C₆H₃); 6.71 (д, 1H, J=8.1, 5-Н C₆H₃); 7.05 (тт, 1H, J₁=7.0, J₂=1.6, 4-Н NC₆H₅); 7.15-7.26 (м, 5H) и 7.31-7.41 (м, 4H, C₆H₅ и NC₆H₅); 8.86 (с, 1H, NH).

N-ՏԵՂԱԿԱԼՎԱԾ 1-ՖԵՆԻԼ-1-ՑԻԿԼՈՊԵՆՏԻԼՄԵԹԻԼԱՄԻՆՆԵՐԻ ՄԻՆԹԵԶ

Ա. Ա. ԱՂԵԿՅԱՆ, Գ. Գ. ՄԿՐՅԱՆ, Ա. Ս. ԾԱՏԻՆՅԱՆ, Հ. Ս. ՆՈՐԱՎՅԱՆ,
Տ. Գ. ՂՈՒԿԱՍՅԱՆ, Է. Ա. ՇԻՐԻՆՅԱՆ և Է. Ա. ՄԱՐԳԱՐՅԱՆ

Ֆենիլցիկլոպենտիլամինի և նիտրո-, դի- կամ տրիալկոբսիբենզալդեհիդների փոխազդեցությամբ սինթեզվել են Շիֆֆի հիմքեր, որոնք նատրիումի բորհիդրիդով վերականգնվել են մինչև համապատասխան ամիններ: Վերջիններիս հիման վրա ստացվել են թիոմիզանյութի 1,1,3-էռտեղակալված ածանցյալներ: Ուսումնասիրվել են սինթեզված նյութերի կենսաբանական ակտիվությունը:

SYNTHESIS OF NEW N-SUBSTITUTED 1-PHENYL-1-CYCLOPENTYLMETHYLAMINES

A. A. AGHEKYAN, G. G. MKRYAN, A. S. TSATINYAN, H. S. NORAVYAN,
T. G. GUKASYAN, E. A. SHIRINYAN and E. A. MARGARYAN

The Scientific Technological Centre of Organic
and Pharmaceutical Chemistry NAS RA
A. L. Mnjoyan Institute of Fine Organic Chemistry
26, Azatutyan Str., Yerevan, 0014, Armenia
E-mail: avagal@mail.ru

The reaction of phenylcyclopentylmethylamine with mono-, di- and trisubstituted benzaldehydes is realized. By the hydrogenation of resulting Schiff's bases with sodium borohydride appropriate secondary benzylamines are obtained. The interaction of the latter with phenylisothiocyanates leads to trisubstituted thioureas. The results of biological activity of all synthesized compounds are discussed.

ЛИТЕРАТУРА

- [1] Агекян А.А., Соломина Л.П., Пирджанов Л.Ш., Маркарян Э.А. // Арм. хим. ж., 1995, т. 48, 11-3, с. 88.
- [2] Агекян А.А., Мкрян Г.Г., Маркарян К.Ж., Асатрян Т.О., Григорян А.В., Хачатрян А.Г., Маркарян Э.А. // Вестник мед. института им.Меграбяна, 2007, т. 3, с. 146.
- [3] Агекян А.А., Мкрян Г.Г., Гукасян Т.Г., Цатинян А.С., Ширинян Э.А., Асатрян Т.О., Маркарян К.Ж., Григорян А.В., Маркарян Э.А. // Хим.ж.Армении, 2010, т. 63, 13, с. 398.
- [4] Дикусар Е.А., Поткин В.И., Козлов Н.Г., Огородникова М.М. // ЖОрХ, 2009, т. 45, вып.10, с. 1512.
- [5] Дикусар Е.А., Поткин В.И., Жуковская Н.А. // ЖОрХ, 2010, т. 46, вып. 5, с. 655.
- [6] Мнджоян А.Л., Татевосян Г.Т. // ДАН Арм.ССР, ХН, 1958, т. 17, 12, с. 93.
- [7] Норавян О.С., Авакян О.М. // Журнал экспер. и клин. медицины, 1976, 18, с. 8.
- [8] Авакян О.М. Симпато-адреналовая система. Л., Наука, 1977.
- [9] Ширинян Э.А., Арутюнян С.А., Гукасян Т.Г. // Вестник МАНЭБ, 2003, т. 8, 14, с. 132.