

ИССЛЕДОВАНИЯ В ОБЛАСТИ СИНТЕЗА  
 ПРОИЗВОДНЫХ АМИНОКЕТОНОВ

IV. СИНТЕЗ И ИССЛЕДОВАНИЕ НЕКОТОРЫХ 1-(*п*-АЛКОКСИФЕНИЛ)-3-  
 -ДИМЕТИЛАМИНО- И 1-(*п*-АЛКОКСИФЕНИЛ)-1-ЦИКЛОГЕКСИЛ-3-ДИ-  
 МЕТИЛАМИНОПРОПАНОЛОВ-1

О. Л. МНДЖОЯН, Г. А. ГЕВОРГЯН, М. З. ПАХЛЕВАНЯН и С. Н. АСРАТЯН

Институт тонкой органической химии АН Армянской ССР

Поступило 17 I 1969

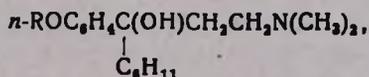
Осуществлен синтез восемнадцати новых 1-(*п*-алкоксифенил)-1-циклогексил-3-диметиламинопропанолов-1 и 1-(*п*-алкоксифенил)-3-диметиламинопропанолов-1. Установлена оптимальная температура образования *п*-алкоксиацетофенонов при ацилировании алкоксибензолов в присутствии фосфорной кислоты. УФ спектры показывают смещение главного максимума в сторону больших длин волны при введении алкоксильной группы в бензольное кольцо. По данным предварительных фармакологических испытаний, гидрохлориды и йодметилаты полученных аминокетонных и аминокислот не оказывают влияния на периферические и центральные М- и Н-холинореактивные структуры. Большинство из них имеет умеренные гипотензивные свойства, а некоторые обладают местноанестезирующим действием.

Табл. 5, библиограф. ссылок 10.

Среди активных соединений, используемых при лечении паркинсонизма, в основном, находятся препараты, имеющие выраженное центральное холинолитическое действие.

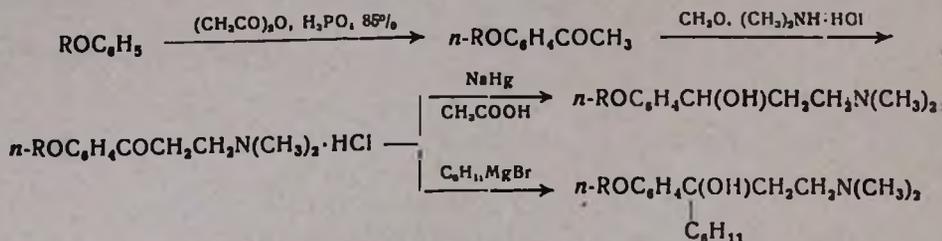
К препаратам такого типа относятся арпенал, динезин, циклодол и др. Циклодол [1] представляет собой гидрохлорид 1-фенил-1-циклогексил-3-*N*-пиперидилпропанола-1. По литературным данным, препарат оказывает сильное центральное и периферическое холинолитическое действие. В связи с периферическим действием наблюдаются побочные явления; поэтому получение избирательно действующих препаратов является необходимостью для медицинской практики.

Учитывая это обстоятельство, а также для установления влияния алкоксильной группы на фармакологическую активность циклодола были получены аминокислоты следующего строения:



где R=CH<sub>3</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, включая изорадикалы.

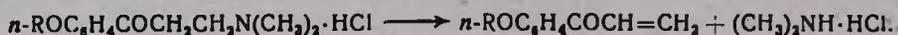
Синтез этих соединений осуществлен по следующей схеме:



Исходные *n*-алкоксиацетофеноны получены взаимодействием алкоксибензолов и уксусного ангидрида в присутствии 85%-ной ортофосфорной кислоты. Ранее этот метод использовался при получении *n*-алкоксибензофенонов [2]. Как видно из таблицы 1, результаты ацилирования удовлетворительны и с удлинением и разветвлением алкильного радикала алкоксильной группы выходы увеличиваются только при 125—130°. Дальнейшее повышение температуры положительного эффекта не дает.

При синтезе аминокетонов по реакции Манниха выходы в зависимости от изменения алкильного радикала алкоксильной группы колеблются от 45 до 80%. Полученные аминокетоны при вакуум-перегонке разлагаются; поэтому они были выделены в виде гидрохлоридов и для очистки подвергались повторной перекристаллизации из ацетона.

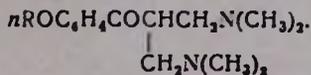
Хлористоводородные соли полученных аминокетонов в водных растворах при нагревании подвергаются расщеплению [3]:



В зависимости от длины и строения углеродной цепи алкильного радикала алкоксильной группы степень разложения меняется, причем устойчивость снижается при удлинении алкильного радикала.

Гидрохлориды аминокетонов восстанавливались до соответствующих аминоспиртов амальгамой натрия в уксуснокислой среде. Аминоспирты перегоняются в вакууме без разложения и образуют кристаллические соли—гидрохлориды и йодметилаты. Синтез конечных продуктов — 1-(*n*-алкоксифенил)-1-циклогексил-3-диметиламинопропанол-1 — осуществлен взаимодействием циклогексилмагнийбромида с гидрохлоридами соответствующих β-диалкиламинопропиофенонов; выходы довольно низки. Попытка проведения реакции не с хлористоводородными солями, а со свободными аминокетонами не дала положительных результатов.

Данные хроматографирования водных растворов хлористоводородных солей как аминокетонов, так и аминоспиртов в тонком слое окиси алюминия (растворитель—хлороформ—спирт, 30:1, проявление парами йода) приведены в таблицах. Как аминокетоны, так и аминоспирты, имеющие изостроение алкоксильной группы, проявляются в двух точках. По-видимому, появление второй точки нужно объяснить наличием дизамещенного продукта, образовавшегося при реакции Манниха:



Это предположение подтверждается следующим фактом: после двукратной перекристаллизации гидрохлорида *п*-изоамилоксифенил- $\beta$ -диметиламиноэтилкетона обнаруживаются два отдельных продукта. Первый из них — труднорастворимое соединение с т. пл. 162—163°, имеет  $R_f = 0,274$ . Найдено %: Cl 17,3.  $\text{C}_{19}\text{H}_{27}\text{Cl}_2\text{N}_2\text{O}_2$ . Вычислено %: Cl 18,22. Второй продукт, лучше растворимый в ацетоне, имеет т. пл. 154—156° и  $R_f = 0,413$ . Найдено %: Cl 13,93.  $\text{C}_{16}\text{H}_{20}\text{ClNO}_2$ . Вычислено %: Cl 13,46. Подобная картина наблюдается и в случае соответствующего аминокспирта; для труднорастворимого с т. пл. 198—199° найдено %: Cl 15,17.  $\text{C}_{25}\text{H}_{46}\text{N}_2\text{O}_2$ . Вычислено %: Cl 14,76. Для однозамещенного с т. пл. 206—208° найдено %: Cl 10,88.  $\text{C}_{22}\text{H}_{38}\text{ClNO}_2$ . Вычислено %: Cl 9,42.

Все синтезированные вещества, начиная от алкоксибензолов, подвергались очистке и хроматографированию в одинаковых условиях.

УФ спектры аминокетонов снимались на спектрофотометре СФ-4а. Установлено, что при введении алкоксильной группы в бензольное ядро аминокетона происходит сглаживание полосы и смещение главного максимума в сторону длинных волн. Одновременно происходит увеличение интенсивности поглощения. При увеличении нормального алкильного радикала больших изменений в спектре не происходит, но в случае изорадикалов усиливается как сглаживание кривой, так и интенсивность минимального значения.

Полученные соединения в виде гидрохлоридов и йодметилатов подверглись предварительному фармакологическому исследованию.

В серии опытов по изучению влияния препаратов на периферические Н- и М-холинореактивные системы было установлено, что соединения в разведении  $1 \cdot 10^{-7}$  и  $1 \cdot 10^{-6}$  не подавляют спазм отрезка тонкой кишки, вызванный ацетилхолином, хотя в отдельных случаях выявляется их слабый Н-холинолитический эффект на прямой мышце живота лягушки.

Препараты в дозе 50 мг/кг при подкожном введении intactным мышам не предупреждают никотиновые судороги и гиперкинеза, вызванного ареколином. Большинство полученных соединений в дозе 3 мг/кг при внутривенном введении крысам снижают кровяное давление примерно на 10—30 мм ртутного столба. Препараты в дозе 50 мг/кг при подкожном введении мышам не оказывают анагезирующего действия. Большинство их в той или иной степени обладают анестетической активностью. Наибольшую терминальную анестетическую активность проявляет гидрохлорид *п*-пропоксифенил- $\beta$ -диметиламинокетона. Анестетический эффект 0,5%-ного раствора этого препарата выражается 265 ед. Ренье, а 1%-ного раствора — 587, что несколько уступает эффекту, полученному от дикаина.

Гидрохлориды 1-(*п*-бутоксифенил)-3-диметиламинопропанола-1, 1-(*п*-изопропоксифенил)-1-циклогексил-3-диметиламинопропанола-1 и 1-(*п*-амилоксифенил)-1-циклогексил-3-диметиламинопропанола-1 в виде 0,1%-ного раствора вызывают обезболивание продолжительностью в 75 минут. Анагезирующее действие этих препаратов примерно аналогично действию новокаина.

Эти данные говорят о том, что в случае аминокетонов у активных соединений более выражено терминальное анестетическое действие, а в случае аминокспиртов —

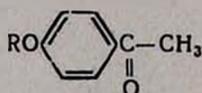
проводниковое анестетическое действие. Некоторые йодметилаты как аминокетонов, так и аминоспиртов обладают проводниковым анестезирующим действием. Среди них наиболее активным соединением является йодметилат 1-(*п*-амилоксифенил)-1-циклогексил-3-диметиламинопропанола-1, который в виде 0,1%-ного раствора вызывает обезболивание в течение 75 минут.

Некоторые физико-химические константы полученных соединений приведены в таблицах. Элементарные анализы произведены С. Н. Тонакян.

### Экспериментальная часть

*п*-Пропоксиацетофенон. Смесь 136 г (1 моль) пропоксibenзола, 102 г (1 моль) уксусного ангидрида и 20 г (0,2 моля) *о*-фосфорной кислоты нагревалась в течение двух часов при 125–130°. После охлаждения и добавления 200 мл воды происходит расслоение. Соединенные верхний слой и бензольные экстракты водного остатка высушивались сульфатом натрия и после отгонки бензола остаток перегонялся в вакууме. Собрана фракция с т. кип. 151–155°/4 мм; выход 86,0 г (48,7%). Остальные *п*-алкоксиацетофеноны получены таким же способом (см. табл. 1).

Таблица 1



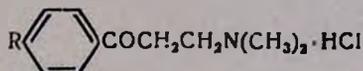
R	Выход, %	Т. кип. °С/мм	Лит. ссылка	Т. пл., °С	Молекулярная формула	d <sub>4</sub> <sup>20</sup>	n <sub>D</sub> <sup>20</sup>	MR <sub>D</sub>	
								найденно	в литературе
CH <sub>3</sub>	52,3	117–120/4	4, 5, 6	38–39	C <sub>9</sub> H <sub>10</sub> O <sub>2</sub>	—	—	—	—
C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	61,4	125–128/4	6, 7	36–37	C <sub>10</sub> H <sub>12</sub> O <sub>2</sub>	—	—	—	—
C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	65,7	151–153/4	8	—	C <sub>11</sub> H <sub>14</sub> O <sub>2</sub>	1,0930	1,5360	51,051	50,832
<i>изо</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	70,1	128–130/6	9	24	C <sub>11</sub> H <sub>14</sub> O <sub>2</sub>	—	—	—	—
C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	60,5	152–154/6	8	—	C <sub>12</sub> H <sub>16</sub> O <sub>2</sub>	1,0601	1,5250	55,563	55,869
<i>изо</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	64,5	142–145/3	8	—	C <sub>12</sub> H <sub>16</sub> O <sub>2</sub>	1,0239	1,5260	56,320	55,869
C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	70,5	165–169/4	9	30	C <sub>13</sub> H <sub>18</sub> O <sub>2</sub>	—	—	—	—
<i>изо</i> -C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	72,5	150–155/2	8	—	C <sub>13</sub> H <sub>18</sub> O <sub>2</sub>	1,0318	1,5220	60,287	60,957

По литературным данным:

	Т. кип., °С/мм	т. пл., °С
1.	CH <sub>3</sub> O — 114–121/8	CH <sub>3</sub> O — 38; 38–39
2.	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O — 160–165/8	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O — 35,5; 38–39
3.	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O — 160–162/11	<i>изо</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O — 22
4.	<i>изо</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O — 149–151/10	C <sub>3</sub> H <sub>11</sub> O — 30
5.	C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> O — 181–183/18	
6.	<i>изо</i> -C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> O — 172–173/11.	

*Хлористоводородная соль β-диметиламино-*n*-пропоксипропиофенона.* Смесь 54,4 г (0,4 моля) *n*-пропоксиацетофенона, 24 г (0,8 моля) параформа, 40 г (0,49 моля) солянокислого диметиламина, 60 мл абсолютного этилового спирта и нескольких капель соляной кислоты (рН=1) при непрерывном перемешивании нагревалась на кипящей водяной бане в течение 2 часов (до образования однородной массы). После отгонки спирта остаток закристаллизовался. Вещество дважды перекристаллизовывалось из сухого ацетона: т. пл. 135—137°; выход 70,0 г (49,1%). Хлористоводородные соли других аминокетонов получены аналогично (см. табл. 2).

Таблица 2



R	Выход, %	Т. пл., °С	Молекулярная формула	% Cl		R <sub>f</sub> <sup>**</sup>
				найде-но	вычис-лено	
H	89,5	153—155	C <sub>11</sub> H <sub>16</sub> NOCl	16,87	16,10	0,45
CH <sub>3</sub> O	71,2	181—182*	C <sub>13</sub> H <sub>18</sub> NO <sub>2</sub> Cl	14,68	14,48	0,46
C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O	73,0	141—142	C <sub>13</sub> H <sub>20</sub> NO <sub>2</sub> Cl	13,78	13,69	0,48
C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O	49,1	135—137	C <sub>14</sub> H <sub>22</sub> NO <sub>2</sub> Cl	13,24	12,99	0,52
<i>изо</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O	45,6	134—135	C <sub>14</sub> H <sub>22</sub> NO <sub>2</sub> Cl	13,31	12,99	0,55; 0,08
C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O	50,5	142—143	C <sub>15</sub> H <sub>24</sub> NO <sub>2</sub> Cl	12,22	12,34	0,56
<i>изо</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O	47,6	133—134	C <sub>15</sub> H <sub>24</sub> NO <sub>2</sub> Cl	12,55	12,34	0,56; 0,65
C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> O	46,8	132—133	C <sub>16</sub> H <sub>26</sub> NO <sub>2</sub> Cl	12,05	11,76	0,58
<i>изо</i> -C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> O	45,8	143—144	C <sub>16</sub> H <sub>26</sub> NO <sub>2</sub> Cl	11,38	11,76	0,58; 0,66

\* По литературным данным [10], т. пл. 178—178,5°.

\*\* В тонком слое окиси алюминия; растворитель—хлороформ—спирт (30:1), проявлено парами йода.

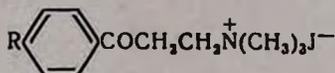
*Йодметилат β-диметиламино-*n*-пропоксипропиофенона.* 10 г солянокислой соли β-диметиламино-*n*-пропоксипропиофенона обработаны водным раствором углекислого калия. Основание экстрагировалось эфиром и после высушивания карбонатом натрия смешивалось с 5 г йодистого метила (0,035 моля). После 12-часового стояния образовались кристаллы с т. пл. 167—168°. После перекристаллизации из абсолютного ацетона т. пл. 171—173°.

Остальные йодметилаты были получены аналогично (см. табл. 3).

*1-(*n*-Пропоксифенил)-3-диметиламинопропанол-1.* К раствору 7 г (0,025 моля) хлористоводородной соли β-диметиламино-*n*-пропоксипропиофенона в 45 мл 50%-ной уксусной кислоты добавлялось 250 г 2%-ной амальгамы натрия. После окончания реакции восста-

новления и отделения ртути остаток обрабатывался 40%-ным раствором едкого натра, экстрагировался эфиром, экстракт высушивался карбонатом натрия. После отгонки эфира остаток в колбе закристаллизовался. Т. пл. 83—85°; выход 5,5 г (88,0%). С помощью сухого хлористого водорода получен гидрхлорид, который после перекристаллизации из ацетона имеет т. пл. 198—200°. Йодметилат этого же аминспирта плавится при 79—80°. Остальные аминспирты и их соли получены аналогично (см. табл. 4).

Таблица 3

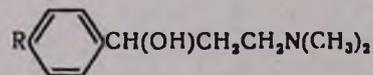


R	Выход, %	Т. пл., °C	Молекулярная формула	% J	
				найденно	вычислено
H	85,5	200—202	C <sub>12</sub> H <sub>16</sub> ONJ	40,30	39,61
CH <sub>3</sub> O	67,8	167—168	C <sub>13</sub> H <sub>20</sub> O <sub>2</sub> NJ	36,50	36,20
C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O	71,5	143—144	C <sub>14</sub> H <sub>22</sub> O <sub>2</sub> NJ	34,97	34,80
C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O	50,6	171—173	C <sub>15</sub> H <sub>24</sub> O <sub>2</sub> NJ	33,50	33,50
изо-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O	48,7	181—183	C <sub>15</sub> H <sub>24</sub> O <sub>2</sub> NJ	33,40	33,50
C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O	51,8	162—164	C <sub>16</sub> H <sub>26</sub> O <sub>2</sub> NJ	31,90	32,29
изо-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O	49,8	155—157	C <sub>16</sub> H <sub>26</sub> O <sub>2</sub> N <sub>2</sub>	31,87	32,29
C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> O	47,5	164—166	C <sub>17</sub> H <sub>28</sub> O <sub>2</sub> NJ	31,66	32,12
изо-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> O	50,5	150—152	C <sub>17</sub> H <sub>28</sub> O <sub>2</sub> NJ	31,43	32,12

*1-(*n*-Пропоксифенил)-1-циклогексил-3-диметиламинопропанол-1.*

К эфирному раствору циклогексилмагнийбромида, полученному из 10,69 г (0,44 г-ат) магния и 69,2 г (0,4 моля) циклогексилбромида, при охлаждении льдом добавлено в течение 0,5 часа 27,1 г (0,1 моля) хлористоводородной соли β-диметиламино-*n*-пропоксипропиофенона. Смесь кипятилась в течение 3 часов, затем к ней добавлялась уксусная кислота до кислой реакции и 170 г колотого льда. После отделения эфира декантацией остаток обрабатывался раствором едкого кали, экстрагировался эфиром, высушивался сульфатом натрия и после отгонки эфира перегонялся в вакууме. Т. кип. 190—195°/1 мм; выход 5 г (15,4%). Остальные аминспирты получены аналогично (табл. 5).

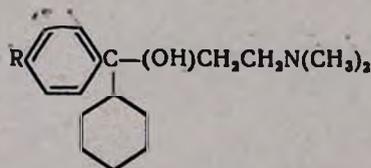
Таблица 4



R	Выход, %	Т. кип., °С/мм	Т. пл., °С	Молекулярная формула	Т. пл. гидрохлорида	% Cl		Т. пл. йодметилата	% J		R <sub>i</sub>
						найдено	вычислено		найдено	вычислено	
H	70,7	128—130/3	—	C <sub>11</sub> H <sub>17</sub> NO	124—126	16,29	16,35	115—116	39,25	39,55	0,42
CH <sub>3</sub> O	38,7	135—137/1	—	C <sub>12</sub> H <sub>19</sub> NO <sub>2</sub>	201—202	14,61	14,37	125—127	36,12	35,98	0,42
C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O	64,6	175—178/1	—	C <sub>13</sub> H <sub>21</sub> NO <sub>2</sub>	180—182	14,21	13,58	97—98	34,48	34,60	0,41
C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O	52,3	—	83—85	C <sub>14</sub> H <sub>23</sub> NO <sub>2</sub>	197—200	12,54	12,88	93—94	33,57	33,31	0,42
<i>μ</i> зо-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O	37,0	163—164/1	—	C <sub>14</sub> H <sub>23</sub> NO <sub>2</sub>	188—190	13,68	12,88	88—89	33,23	33,31	0,41
C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O	49,6	162—163/1	—	C <sub>15</sub> H <sub>25</sub> NO <sub>2</sub>	118—120	12,19	12,25	99—101	31,66	32,11	0,43
<i>μ</i> зо-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O	49,1	160—162/1	—	C <sub>15</sub> H <sub>25</sub> NO <sub>2</sub>	179—181	12,68	12,25	66—67	31,01	32,11	0,432; 0,371
C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> O	51,8	188—189/1	—	C <sub>16</sub> H <sub>27</sub> NO <sub>2</sub>	192—193	11,87	11,68	87—88	31,20	31,00	0,44
<i>μ</i> зо-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> O	45,2	175—176/1	—	C <sub>16</sub> H <sub>27</sub> NO <sub>2</sub>	124—125	11,88	11,68	116—117	30,65	31,00	0,45; 0,39

\* В тонком слое окиси алюминия; растворитель—хлороформ—спирт (30:1); проявлено парами йода.

Таблица 5



R	Выход, %	Т. кип., °С/мм	Молекулярная формула	d <sub>4</sub> <sup>20</sup>	n <sub>D</sub> <sup>20</sup>	MR <sub>D</sub>		А н а л и з, %				Т. пл. солей, °С		R <sub>f</sub>
						найдено	вычислено	Cl		J		гидро-хлорид	водне-тилат	
								найдено	вычислено	найдено	вычислено			
H	10,5	148—150	C <sub>17</sub> H <sub>27</sub> ON	1,0031	1,5240	79,49	79,27	12,30	11,84	31,90	31,06	188—190	150—151	0,412
CH <sub>3</sub> O	10,0	175—180	C <sub>18</sub> H <sub>29</sub> O <sub>2</sub> N	1,0759	1,5362	86,33	86,63	10,67	10,75	28,95	29,14	202—203	168—169	0,406
C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O	18,6	179—181	C <sub>19</sub> H <sub>31</sub> O <sub>2</sub> N	1,0739	1,5450	89,93	91,24	10,69	10,31	28,65	28,22	164—166	171—172	0,426
C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O	15,4	190—195	C <sub>20</sub> H <sub>33</sub> O <sub>2</sub> N	1,0329	1,5277	95,24	95,86	10,17	9,90	28,10	27,38	182—183	188—190	0,446
изо-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O	12,5	189—191	C <sub>20</sub> H <sub>33</sub> O <sub>2</sub> N	1,0338	1,5278	95,13	95,86	9,92	9,90	27,11	27,38	128—129	181—182	0,416
C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O	17,9	205—209	C <sub>21</sub> H <sub>35</sub> O <sub>2</sub> N	1,0390	1,5180	99,68	100,48	10,01	9,52	27,04	26,57	—	138—140	0,408
изо-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O	18,0	162—164	C <sub>21</sub> H <sub>35</sub> O <sub>2</sub> N	1,0218	1,5297	100,75	100,48	9,86	9,52	26,39	26,57	145—146	166—167	0,440; 0,400
C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> O	11,3	207—210	C <sub>22</sub> H <sub>37</sub> O <sub>2</sub> N	1,0111	1,5265	105,89	105,10	8,84	9,17	26,32	25,79	—	183—185	0,407
изо-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> O	8,47	205—207	C <sub>22</sub> H <sub>37</sub> O <sub>2</sub> N	1,0052	1,5200	105,07	105,10	8,90	9,17	26,32	25,79	186—187	182—183	0,447; 0,373

\* Хроматография в тонком слое окиси алюминия; растворитель—хлороформ—спирт (30:1); проявлено парами йода.

ՀԵՏԱԶՈՏՈՒԹՅՈՒՆՆԵՐ ԱՄԻՆԱԿԵՏՈՆՆԵՐԻ ԱՄԱՆՑՅԱԼՆԵՐԻ  
ՍԻՆԹԵԶԻ ԲՆԱԳԱՎԱՌՈՒՄ

IV. ՄԻ ՔԱՆԻ 1-(պ-ԱԼԿՓՍԻՅԵՆԻԼ)-3-ԴԻՄԵԹԻԼԱՄԻՆԱ -Լ- 1-(պ-ԱԼԿՓՍԻՅԵՆԻԼ)-  
-1-ՑԻԿԼՈՉԵՔՍԻԼ-3-ԴԻՄԵԹԻԼԱՄԻՆԱԳՐՈՊԱՆՈՒ-1-ՆԵՐԻ ՍԻՆԹԵԶ ԵՎ ՀԵՏԱԶՈՏՈՒԹՅՈՒՆ:

Հ. Լ. ՄԵՋՈՅԱՆ, Գ. Ա. ԳԵՎՈՐԳՅԱՆ, Մ. Զ. ՓԱԽԼԵՎԱՆՅԱՆ Ե Ս. Ն. ՀԱՍՐԱԹՅԱՆ

Ա մ փ ո փ ու մ

Ճարմակոլոգիական ուսումնասիրության նպատակով պ-ալկոքսիացետո-  
ֆենոններից Մաննիխի ռեակցիայով սինթեզել ենք մի քանի 1-(պ-ալկոքսի-  
ֆենիլ)-3-դիմեթիլամինա- և 1-(պ-ալկոքսիֆենիլ)-1-ցիկլոհեքսիլ-3-դիմե-  
թիլամինապրոպանոլներ-1:

Դտնված է ֆոսֆորական թթվի ներկայությամբ ալկոքսիբենզոլների  
ացիլացմամբ պ-ալկոքսիացետոֆենոնների ստացման օպտիմալ շերմաստի-  
ճանը: Սինթեզված միացությունների ուլտրամանիշակազուլն սպեկտրների  
ուսումնասիրությունը ցույց է տվել, որ բենզոլային օղակի մեջ ալկոքսի  
խմբի մուտքը գլխավոր մաքսիմումը շեղում է մեծ երկարություն ունեցող  
ալիքների կողմը: Նախնական ֆարմակոլոգիական տվյալներով ստացված  
միացությունների քլորանհիդրիդներից և լողմեթիլատներից շատերն ունեն  
հիպոտենզիվ, իսկ որոշ մասը անէսթետիկ հատկություն:

Л И Т Е Р А Т У Р А

1. H. Pfanz, E. Jassmann, Герм. пат. 1,049,378 (1959); С. А., 55, 3621 (1961).
2. О. Л. Мнджоян, Н. М. Морозова, Изв. АН АрмССР, ХН, 15, 553 (1962).
3. О. Л. Мнджоян, Г. М. Погосян, Изв. АН АрмССР, ХН, 13, 361 (1960).
4. В. И. Максимов, Э. А. Прякина, ЖОХ, 28, 248 (1958).
5. H. D. Hartough, A. I. Kosak, Пат. США, 2,475,564 5 (1949); (С. А., 43, 7966h (1949).
6. K. V. Answers, Lieb. Ann., 408, 242 (1915).
7. R. Stewart, K. Yates, J. Am. Chem. Soc., 80, 6355 (1958).
8. E. Profft, Chem. Tech., 4, 241 (1962).
9. A. McCoubrey, N. K. Iyenger, J. Chem. Soc., 1951, 2931.
10. Wm. S. Johnson, E. Robert, Пат. США, 2, 842, 559, 8 (1958); (С. А., 53, 3156h (1959)).