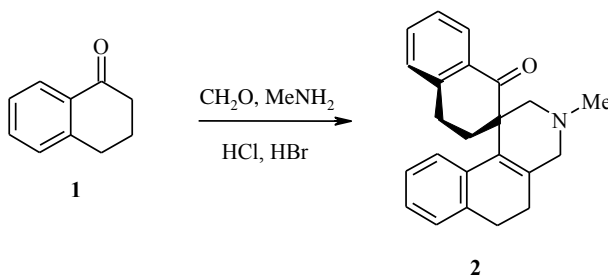


**ОДНОРЕАКТОРНЫЙ СИНТЕЗ
СПИРО-N-МЕТИЛГЕКСАГИДРОБЕНЗО[*f*]ИЗОХИНОЛИН-1,2'-
(ТЕТРАГИДРОНАФТАЛИН-1'-ОНА) КОНДЕНСАЦИЕЙ α -ТЕТРАЛОНА
С ФОРМАЛЬДЕГИДОМ И МЕТИЛАМИНОМ**

Ключевые слова: метиламин, спиро-N-метил-1,2,3,4,5,6-гексагидробензо[*f*]-изохинолин-1,2'-(1',2',3',4'-тетрагидронафталин-1'-он), α -тетралон, формальдегид.

При конденсации трехкомпонентной смеси, состоящей из ацетофенона, формальдегида и метиламина в условиях реакции Манниха образуется двойное основание Манниха, которое может быть затем превращено действием щелочи в 3-бензоил-4-гидрокси-4-фенилпиридин [1], который при кипячении в HBr претерпевает дегидратацию и циклизацию с образованием тетрагидроиндено[2,1-*c*]пиридина, обладающего антигистаминной активностью [2]. В настоящей работе установлено, что в случае использования в аналогичной смеси циклического аналога ацетофенона – α -тетралона (**1**), возможна одnoreакторная конденсация, которая приводит в одну стадию к спиро-соединению **2**. Это пентациклическое соединение является, насколько нам известно, первым примером подобной гетероциклической системы.



В соответствии с предсказанием интернет-системы PASS [3], соединение **2** может обладать антинейротоксической и психотропной (анти-эпилептической) активностью с вероятностью 71 и 75% соответственно. Кроме того, оно может быть ингибитором обратного захвата нейромедиаторов и проявлять антипаркинсоническое действие (75%).

Спектры ЯМР ^1H зарегистрированы на спектрометре Bruker WP-400 (400 МГц) в CDCl_3 , внутренний стандарт остаточные протоны дейтерированного растворителя, масс-спектры (ЭУ) – на масс-спектрометре Finnigan MAT Incos 50 (70 эВ). ИК спектры записаны на спектрометре IR-75 в таблетках KBr.

Спиро-N-метил-1,2,3,4,5,6-гексагидробензо[*f*]изохинолин-1,2'-(1',2',3',4'-тетрагидронафталин-1'-он) (2). Смесь 23.4 г (0.16 моль) α -тетралона (**1**), 12 мл 38% формалина, 5.4 г (0.08 моль) гидрохлорида метиламина и 10 мл 10% раствора HCl нагревают 1 ч при 90 °С при перемешивании до образования гомогенного раствора. Затем к реакционной смеси добавляют 50 мл 48% водного раствора HBr, кипятят 2 ч и выдерживают 20 ч при 20 °С. Образовавшуюся смесь разбавляют 50 мл воды, подщелачивают до pH 9 и экстрагируют эфиром. Экстракт сушат, растворитель отгоняют в вакууме, остаток разделяют на колонке с Al_2O_3 , элюент эфир–гексан. Получают 1.9 г (18%) соединения **2** в виде светло-бежевых кристаллов. Т. пл. 159–161 °С. ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1673 (C=O). Спектр ЯМР ^1H δ , м. д. (*J*, Гц): 2.16–2.27 (3H, м, C–CH₂); 2.36 (3H, с, CH₃); 2.72–2.94 (4H, м, C–CH₂); 2.86 (2H, с, NCH₂); 3.07–3.28 (3H, м, NCH₂ и C–CH₂); 6.74, 6.93, 7.01 и 7.10 (1H каждый, ABCD-система, $^3J = 7.4$, $^3J = 7.2$ и $^3J = 7.1$, $\text{H}_{\text{аром}}$); 7.29, 7.36, 7.53 и 8.16 (1H каждый ABCD-система, $^3J = 7.7$, $^3J = 7.6$ и $^3J = 7.1$, $\text{H}_{\text{аром}}$). Масс-спектр, *m/z* ($I_{\text{отн}}$, %): 329 (97), 328 (14), 286 (21), 285 (40), 184 (19), 183 (22), 182 (18), 170 (100), 165 (22), 141 (38), 128 (23), 115 (31), 91 (20), 90 (21), 57 (95). Найдено, %: C 83.92; H 7.21; N 4.36. $\text{C}_{23}\text{H}_{23}\text{NO}$. Вычислено, %: C 83.85; H 7.04; N 4.25.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. J. T. Plati, W. Wenner, *J. Org. Chem.*, **14**, 543 (1949).
2. J. T. Plati, W. Wenner, *J. Org. Chem.*, **15**, 209 (1950).
3. <http://195.178.207.233/PASS/>

**А. Т. Солдатенков, С. В. Волков, К. Б. Полянский,
С. А. Солдатова**

Российский университет дружбы народов,

Поступило 18.03.2008

Москва 117198

[e-mail: asoldatenkov@mail.ru](mailto:asoldatenkov@mail.ru)

ХГС. – 2008. – № 5. – С. 790