

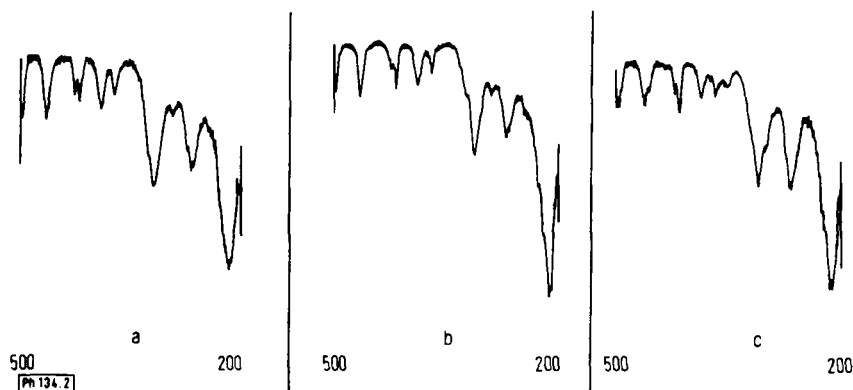


Abb. 2: Fern-IR-Spektren von $2 \cdot \text{CoCl}_2$ (a), $2 \cdot \text{ZnCl}_2$ (b) und $2 \cdot \text{FeCl}_2$ (c); in KJ

Anschrift: Doz. Dr. R. Haller, 7800 Freiburg i.Br., Hermann-Herderstr. 9

[Ph 134]

Y.S. Sadanandam, P.B. Sattur und G.S. Sidhu

Synthese und Pharmakologie von N-Chloracyl-benzylaminen.

Aus dem Regional Research Laboratory, Hyderabad (Indien)
(Eingegangen am 13. Dezember 1971).

Eine Reihe von N-Chloracyl-benzylamin-Derivaten wurde hergestellt und an Mäusen ihre pharmakologische Wirkung auf das Zentralnervensystem sowie die antikonvulsive Wirkung bei Elektroschockanwendung geprüft.

N-Chloroacyl-benzylamines

A number of N-chloroacyl-benzylamines have been synthesised and tested for their action on the Central Nervous System and anticonvulsant action against electroshock seizures in mice.

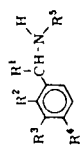
N-Chloracyl-benzylamine (I), die aus Benzylaminen (Tab 1.)^{1,3)} und Chloracetyl-beziehungsweise 2- und 3- Chlorpropionylchlorid zu gewinnen sind, stellen Zwischenprodukte bei der Synthese von N-Aminoacyl-benzylaminen (II) dar. Sie sollten auf-

1 A. McCoubrey, J. chem. Soc. (London) 1951, 2931.

2 R. Leuckart und H. Janssen, Ber. dtsch. chem. Ges. 22, 1409 (1889).

3 A.W. Ingersoll, Org. Syntheses Coll. Vol. 2, 503 (1943).

Tabelle 1: Neuere Benzylamine und ihre Eigenschaften



Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Summenformel (Mol.-Gew.)	Sdp./Torr	Ausb. %	Analyse C	H	N
1	CH ₃	OCH ₃	H	H	H	C ₉ H ₁₃ NO (151,2)	110–112/3	75	Ber. 71,49 Gef. 71,51	8,67 8,80	9,26 9,50
2	CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	C ₁₁ H ₁₇ NO ₂ (195,3)	130–132/2	65	Ber. 67,66 Gef. 67,89	8,78 8,68	7,17 7,20
3	CH ₃	H	Cl	Cl	CH ₃	C ₉ H ₁₁ Cl ₂ N (204,1)	110–112/1,5	75	Ber. 52,91 Gef. 53,10	5,43 5,51	6,86 6,90
4	CH ₃	H	Cl	Cl	C ₂ H ₅	C ₁₀ H ₁₃ Cl ₂ N (218,1)	118–120/1,5	70	Ber. 55,05 Gef. 55,21	6,00 6,15	6,42 6,39
5	CH ₃	H	Cl	Cl	C ₆ H ₁₁	C ₁₄ H ₁₉ Cl ₂ N (272,2)	180–182/3	75	Ber. 67,02 Gef. 66,98	6,16 6,30	3,72 3,81
6	C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₁₁	C ₁₅ H ₂₃ N (217,3)	132–134/3	60	Ber. 82,89 Gef. 82,90	10,67 10,91	6,45 6,58
7	C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	CH ₃	C ₁₁ H ₁₇ NO (179,3)	106–108/1,5	70	Ber. 73,70 Gef. 74,01	9,56 9,57	7,81 7,79
8	C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	C ₂ H ₅	C ₁₂ H ₁₉ NO (193,3)	114–116/2	73	Ber. 74,57 Gef. 74,61	9,91 10,61	7,25 7,58
9	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	C ₁₂ H ₁₉ NO ₂ (209,3)	128–130/2	75	Ber. 68,86 Gef. 68,89	9,15 9,20	6,69 6,67
10	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	OCH ₃	C ₂ H ₅	C ₁₃ H ₂₁ NO ₂ (223,3)	158–160/2,5	73	Ber. 69,92 Gef. 70,10	9,48 9,51	6,27 6,33

Fortsetzung Tabelle 1:

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Summenformel (Mol.-Gew.)	Sdp./Torr	Ausb. %	Analyse C	H	N
11	C ₂ H ₅	H	3,4,5-Trimethoxy	H	H	C ₁₂ H ₁₉ NO ₃ (225,3)	144–146/2	70	Ber. 63,97 Gef. 64,10	8,50 8,55	6,22 6,19
12	C ₂ H ₅	Cl	H	H	H	C ₉ H ₁₂ ClN (169,9)	94–96/1,5	75	Ber. 63,66 Gef. 63,88	7,12 7,30	8,25 8,41
13	C ₂ H ₅	H	Cl	H	H	C ₉ H ₁₂ ClN (169,6)	72–74/1,5	73	Ber. 63,66 Gef. 63,58	7,12 7,25	8,25 8,33
14	C ₂ H ₅	H	H	Cl	CH ₃	C ₁₀ H ₁₄ ClN (183,6)	99–100/1,5	70	Ber. 65,37 Gef. 65,50	7,68 7,71	7,62 7,59
15	C ₂ H ₅	H	H	Cl	C ₂ H ₅	C ₁₁ H ₁₆ ClN (197,7)	108–110/2	75	Ber. 66,80 Gef. 66,91	8,15 8,40	7,08 7,21
16	C ₂ H ₅	H	Cl	Cl	H	C ₉ H ₁₁ Cl ₂ N (204,1)	140–142/6	85	Ber. 52,91 Gef. 53,01	5,43 5,50	6,86 6,89
17	C ₂ H ₅	H	Cl	Cl	CH ₃	C ₁₀ H ₁₃ Cl ₂ N (218,1)	126–128/1,5	75	Ber. 55,05 Gef. 54,99	6,00 6,11	6,42 6,51
18	C ₂ H ₅	H	Cl	Cl	C ₂ H ₅	C ₁₁ H ₁₅ Cl ₂ N (232,1)	128–130/2	78	Ber. 57,01 Gef. 56,89	6,71 6,50	6,21 6,03
19	C ₂ H ₅	H	Cl	Cl	C ₆ H ₁₁	C ₁₃ H ₂₁ Cl ₂ N (286,2)	176–178/2	70	Ber. 62,94 Gef. 63,00	7,39 7,44	4,89 4,90
20	n-C ₃ H ₇	H	H	H	C ₆ H ₁₁	C ₁₆ H ₂₅ N (231,4)	142–144/1,5	70	Ber. 83,05 Gef. 83,11	10,89 11,00	6,05 6,10

Tabelle 2: N-Chloracetyl-benzylamine und ihre Eigenschaften

$\begin{array}{c} R^2 \quad R^1 \\ \quad \\ R^3 - CH - N - CO - CH_2 - Cl \\ \\ R^4 \end{array}$												
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Summenformel (Mol.-Gew.)	Schmp.(aus) Sdp./Torr	Ausb. %	Analyse C	G	N	Cl
1	H	H	OCH ₃	H	H	C ₁₀ H ₁₂ ClNO ₂ (213,6)	70 (Äthanol)	57 Ber. 56,22 Gef. 56,20	5,66 5,67	6,55 6,58	16,60 16,90	
2	H	H	-O-CH ₂	-O-	H	C ₁₀ H ₁₀ ClNO ₃ (227,6)	112-114 (Äthanol)	77 Ber. 52,76 Gef. 53,00	4,42 4,50	6,15 6,02	15,58 15,80	
3	CH ₃	H	H	H	CH ₃	C ₁₁ H ₁₄ ClNO (211,7)	168-170/2	71 Ber. 62,40 Gef. 62,51	6,06 6,81	6,61 6,68	16,79 16,90	
4	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	C ₁₂ H ₁₆ ClNO (225,7)	90 (Petroläth.)	66 Ber. 63,84 Gef. 63,90	7,14 7,21	6,20 6,18	15,70 15,82	
5	CH ₃	OCH ₃	HCH ₃	H	H	C ₁₁ H ₁₄ ClNO ₂ (227,7)	93 (Äthanol)	62 Ber. 58,01 Gef. 58,00	6,19 6,30	6,15 6,27	15,57 15,59	
6	CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	H	C ₁₂ H ₁₆ ClNO ₃ (257,7)	104 (Äthanol)	61 Ber. 49,17 Gef. 48,99	5,50 5,59	5,00 5,10	24,19 24,38	
7	CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	C ₁₃ H ₁₈ ClNO ₃ (271,7)	220-222/1,5	70 Ber. 57,45 Gef. 57,40	6,67 6,90	5,15 5,17	13,05 13,40	
8	CH ₃	H	3,4,5-Trimethoxy			C ₁₃ H ₁₈ ClNO ₄ (287,7)	186-188/2,5	70 Ber. 54,25 Gef. 54,50	6,30 6,51	4,86 5,10	13,35 13,29	
9	CH ₃	Cl	H	H	H	C ₁₀ H ₁₁ Cl ₂ NO (232,1)	93 (Petroläther)	65 Ber. 51,75 Gef. 51,90	4,77 4,91	6,03 6,10	30,55 30,61	
10	CH ₃	H	Cl	H	H	C ₁₀ H ₁₁ Cl ₂ NO (232,1)	68 (Äthanol)	60 Ber. 51,75 Gef. 51,88	4,77 4,81	6,03 5,99	30,55 30,80	

11	CH ₃	H	H	Cl	CH ₃	C ₁₁ H ₁₃ Cl ₂ NO (246,1)	194–196/3	71	Ber. Gef.	53,68 53,92	5,32 5,41	5,69 5,71	28,81 29,03
12	CH ₃	H	Cl	Cl	CH ₃	C ₁₁ H ₁₂ Cl ₃ NO (280,6)	220–222/1,5	88	Ber. Gef.	47,05 47,21	4,31 4,40	4,92 5,11	38,81 38,90
13	CH ₃	H	Cl	Cl	C ₂ H ₅	C ₁₂ H ₁₄ Cl ₃ NO (294,6)	208–210/3,5	69	Ber. Gef.	48,93 49,10	4,78 4,81	4,77 4,79	36,08 36,45
14	CH ₃	H	Cl	Cl	C ₆ H ₁₁	C ₁₆ H ₂₀ Cl ₃ NO (348,7)	170 (Äthanol)	86	Ber. Gef.	55,08 55,19	5,78 5,89	4,01 4,18	30,48 30,59
15	C ₂ H ₅	H	H	H	H	C ₁₁ H ₁₄ ClNO (211,7)	58 (Äthanol)	71	Ber. Gef.	62,40 62,38	6,66 6,69	6,61 6,79	16,75 16,79
16	C ₂ H ₅	H	H	H	CH ₃	C ₁₂ H ₁₆ ClNO (225,7)	158–160/2,5	84	Ber. Gef.	63,84 63,96	7,14 7,22	6,20 6,50	15,70 15,94
17	C ₂ H ₅	H	H	H	C ₂ H ₅	C ₁₃ H ₁₈ ClNO (239,7)	166–168/3,5	69	Ber. Gef.	65,12 65,18	7,56 7,59	5,84 5,58	14,79 15,01
18	C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₁₁	C ₁₇ H ₂₄ ClNO (293,8)	240 (Äthanol)	68	Ber. Gef.	69,45 69,56	8,23 8,30	4,76 4,90	12,06 12,50
19	C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	H	C ₁₂ H ₁₆ ClNO ₂ (241,7)	76 (Petroläth.)	66	Ber. Gef.	59,64 59,61	6,67 6,70	5,79 5,80	14,67 14,97
20	C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	CH ₃	C ₁₃ H ₁₈ ClNO ₂ (255,7)	192–194/4	69	Ber. Gef.	61,05 61,11	7,09 7,25	5,47 5,60	13,87 14,00
21	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	OCH ₃	H	C ₁₃ H ₁₈ ClNO ₃ (271,7)	98 (Äthanol)	74	Ber. Gef.	57,45 57,60	6,67 6,81	5,15 5,24	13,05 13,20
22	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	C ₁₄ H ₂₀ ClNO ₃ (285,8)	198–200/2,5	71	Ber. Gef.	58,84 58,89	7,06 7,11	4,90 5,10	12,41 12,51
23	C ₂ H ₅	H	3,4,5-Trimethoxy		H	C ₁₄ H ₂₀ ClNO ₄ (301,8)	120 (Äthanol)	83	Ber. Gef.	55,71 55,79	6,68 6,70	4,64 4,85	11,75 12,00
24	C ₂ H ₅	Cl	H	H	H	C ₁₁ H ₁₃ Cl ₂ NO (246,1)	105 (Petroläth.)	61	Ber. Gef.	53,68 53,72	5,32 5,50	5,69 5,81	28,81 28,86

Fortsetzung Tabelle 2:

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Summenformel (Mol.-Gew.)	Schmp.(aus) Sdp./Torr	Ausb. %	Analyse C	G	N	Cl
25	C ₂ H ₅	H	Cl	H	H	C ₁₁ H ₁₃ Cl ₂ NO (246,1)	164–166/3	61	Ber. 53,68 Gef. 53,80	5,32 5,45	5,69 5,70	28,81 29,20
26	C ₂ H ₅	H	H	Cl	H	C ₁₁ H ₁₃ Cl ₂ NO (246,1)	102	71	Ber. 53,68 Gef. 53,59	5,32 5,43	5,69 5,71	28,81 29,09
27	C ₂ H ₅	H	H	Cl	CH ₃	C ₁₂ H ₁₅ Cl ₂ NO (260,2)	194–196/1	68	Ber. 55,40 Gef. 55,39	5,81 5,84	5,58 5,60	27,26 27,41
28	C ₂ H ₅	H	H	Cl	C ₂ H ₅	C ₁₃ H ₁₇ Cl ₂ NO (274,2)	176–178/2,7	74	Ber. 56,93 Gef. 57,00	6,25 6,55	5,11 5,00	25,86 26,01
29	C ₂ H ₅	H	Cl	Cl	H	C ₁₁ H ₁₂ Cl ₃ NO (280,6)	85 (Äthanol)	72	Ber. 47,08 Gef. 47,30	4,31 4,36	4,99 5,10	37,92 38,10
30	C ₂ H ₅	H	Cl	Cl	CH ₃	C ₁₂ H ₁₄ Cl ₃ NO (294,6)	222–224/4	69	Ber. 48,94 Gef. 49,00	4,79 4,81	4,76 4,80	36,28 36,60
31	C ₂ H ₅	H	Cl	Cl	C ₂ H ₅	C ₁₃ H ₁₆ Cl ₃ NO (308,6)	200–202/0,9	73	Ber. 50,58 Gef. 50,60	5,22 5,39	4,53 4,61	34,47 34,49
32	C ₂ H ₅	H	Cl	Cl	C ₆ H ₁₁	C ₁₇ H ₂₂ Cl ₃ NO (362,7)	290 (Äthanol)	83	Ber. 56,27 Gef. 56,39	6,11 6,41	3,86 4,10	29,32 29,66
33	n-C ₃ H ₇	H	H	H	H	C ₁₂ H ₁₆ ClNO (225,7)	51 (Petroläth.)	67	Ber. 63,84 Gef. 63,91	7,14 7,21	6,20 6,41	15,72 15,80
34	n-C ₃ H ₇	H	H	H	CH ₃	C ₁₃ H ₁₈ ClNO (239,7)	164–166/2,5	70	Ber. 65,12 Gef. 65,14	7,56 7,59	5,84 5,99	14,79 15,00
35	n-C ₃ H ₇	H	H	H	C ₂ H ₅	C ₁₄ H ₂₀ ClNO (253,8)	170–172/2,7	71	Ber. 66,24 Gef. 66,40	7,94 8,11	5,52 5,61	13,97 14,02
36	n-C ₃ H ₇	H	H	H	C ₆ H ₁₁	C ₁₈ H ₂₆ ClNO (307,9)	245	81	Ber. 70,23 Gef. 70,41	8,51 8,80	4,55 4,59	11,52 11,91
37	n-C ₃ H ₇	H	H	OCH ₃	H	C ₁₃ H ₁₈ ClNO ₂ (255,7)	78 (Äthanol)	73	Ber. 61,05 Gef. 60,98	7,09 7,10	5,47 5,51	13,87 14,10

Tabelle 3: N-2-Chlorpropionyl-benzylamine und ihre Eigenschaften

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Summenformel (Mol.-Gew.)	Schmp.(aus) Sdp./Torr	Ausb. %	Analyse C	H	N	Cl
1	H	H	OCH ₃	H	C ₁₁ H ₁₄ ClNO ₂ (227,7)	90 (Äthanol)	53	Ber. 58,03 Gef. 58,20	6,19 6,41	6,15 6,22	15,57 15,79
2	H	-O-CH ₂ -O-	H	H	C ₁₁ H ₁₂ ClNO ₃ (241,7)	95–96 (Petroläther)	69	Ber. 54,69 Gef. 54,71	5,00 5,19	5,79 5,81	14,68 14,72
3	CH ₃	H	H	H	C ₁₁ H ₁₄ ClNO (211,7)	95 (Äthanol)	66	Ber. 62,40 Gef. 62,62	6,66 7,00	6,61 6,64	16,75 16,89
4	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₁₃ H ₁₈ ClNO (239,7)	113 (Äthanol)	58	Ber. 65,12 Gef. 65,31	7,56 7,61	5,84 6,00	14,79 14,90
5	CH ₃	OCH ₃	H	H	C ₁₂ H ₁₆ ClNO ₂ (241,7)	114 (Petroläther)	58	Ber. 59,64 Gef. 59,90	6,67 6,70	5,79 5,81	14,67 14,90
6	CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	C ₁₃ H ₁₈ ClNO ₂ (271,7)	117 (Äthanol)	63	Ber. 57,45 Gef. 57,60	6,67 6,66	5,15 5,15	13,06 13,40
7	CH ₃	Cl	H	H	C ₁₁ H ₁₃ Cl ₂ NO (246,1)	130 (Äthanol)	64	Ber. 53,68 Gef. 53,71	5,32 5,40	5,69 5,67	28,81 29,10
8	CH ₃	H	Cl	H	C ₁₁ H ₁₃ Cl ₂ NO (246,1)	128 (Äthanol)	64	Ber. 53,68 Gef. 53,70	5,32 5,19	5,69 5,68	28,81 29,11
9	C ₂ H ₅	H	H	H	C ₁₂ H ₁₆ ClNO (225,7)	148–150/1,5 (Äthanol)	60	Ber. 63,84 Gef. 64,10	7,14 7,20	6,20 6,41	15,70 15,91
10	C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	C ₁₃ H ₁₈ ClNO ₂ (255,7)	82 (Äthanol)	63	Ber. 61,05 Gef. 61,11	7,09 7,19	5,47 5,60	13,87 13,91

Fortsetzung Tabelle 3:

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Summenformel (Mol.-Gew.)	Schmp.(aus) Sdp./Torr	Ausb. %	Analyse C	H	N	Cl
11	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	OCH ₃	C ₁₄ H ₂₀ ClNO ₃ (285,8)	74 (Äthanol)	70	Ber. 59,03 Gef. 59,11	7,08 7,18	4,91 5,11	12,41 12,60
12	C ₂ H ₅	Cl	H	H	C ₁₂ H ₁₅ Cl ₂ NO (260,2)	98 (Äthanol)	76	Ber. 55,39 Gef. 55,50	5,81 5,91	5,38 5,46	27,26 27,31
13	C ₂ H ₅	H	Cl	H	C ₁₂ H ₁₅ Cl ₂ NO (260,2)	158–160/2	76	Ber. 55,39 Gef. 55,36	5,81 5,99	5,38 5,56	27,26 27,58
14	C ₂ H ₅	H	H	Cl	C ₁₂ H ₁₅ Cl ₂ NO (260,2)	102 (Äthanol)	62	Ber. 55,39 Gef. 55,42	5,81 5,69	5,38 4,99	27,26 27,58
15	C ₂ H ₅	H	Cl	Cl	C ₁₂ H ₁₄ Cl ₃ NO (294,6)	80 (Äthanol)	68	Ber. 48,93 Gef. 49,10	4,78 4,99	4,75 4,66	36,08 36,21
16	n-C ₃ H ₇	H	H	H	C ₁₃ H ₁₈ ClNO (239,7)	73 (Äthanol)	67	Ber. 65,12 Gef. 65,14	7,56 7,48	5,84 5,88	14,79 15,01
17	n-C ₃ H ₇	H	H	OCH ₃	C ₁₄ H ₂₀ ClNO ₂ (269,8)	94 (Äthanol)	71	Ber. 62,33 Gef. 62,29	7,47 7,51	5,19 5,30	13,14 13,70

Tabelle 4: N-3-Chlorpropionyl-benzylamine und ihre Eigenschaften

$$\begin{array}{c}
 \text{R}^2 \quad \text{R}^1 \\
 | \quad | \\
 \text{CH} - \text{NH} - \text{CO} - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{Cl} \\
 | \\
 \text{R}^3 \quad \text{R}^4
 \end{array}$$

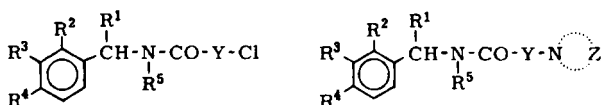
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Summenformel (Mol.-Gew.)	Schmp.(aus) Sdp/Torr	Ausb. %	Analysc C	H	N	Cl
1	H	H	OCH ₃	H	C ₁₁ H ₁₄ ClNO ₂ (227,7)	110–112/1,3	57	Ber. 58,03 Gef. 57,99	6,19 6,26	6,15 6,30	15,57 15,62
2	CH ₃	H	H	CH ₃	C ₁₂ H ₁₆ ClNO (225,7)	180–182/0,9	58	Ber. 63,84 Gef. 64,01	7,14 7,22	6,20 6,31	15,70 15,91
3	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₁₃ H ₁₈ ClNO (239,7)	208–210/4	59	Ber. 65,12 Gef. 65,20	7,56 7,70	5,84 5,76	14,79 15,00
4	CH ₃	OCH ₃	H	H	C ₁₂ H ₁₆ ClNO ₂ (241,7)	102 (Äthanol)	62	Ber. 59,64 Gef. 59,88	6,76 6,80	5,79 5,74	14,67 14,88
5	CH ₃	H	H	OCH ₃	C ₁₂ H ₁₆ ClNO ₂ (241,7)	70 (Äthanol)	62	Ber. 59,64 Gef. 59,72	6,76 6,78	5,79 5,81	14,67 14,80
6	CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	C ₁₃ H ₁₈ ClNO ₃ (271,7)	170–172/0,8	63	Ber. 57,45 Gef. 57,51	6,67 6,69	5,15 5,20	13,06 13,60
7	CH ₃	Cl	H	H	C ₁₁ H ₁₃ Cl ₂ NO (246,1)	180–182/0,9	64	Ber. 53,68 Gef. 53,69	5,32 5,50	5,69 5,67	28,81 29,20
8	CH ₃	H	Cl	H	C ₁₁ H ₁₃ Cl ₂ NO (246,1)	190–192/0,9	64	Ber. 53,68 Gef. 53,80	5,32 5,50	5,69 5,73	28,81 28,89
9	CH ₃	H	H	Cl	C ₁₁ H ₁₃ Cl ₂ NO (246,1)	94 (Äthanol)	64	Ber. 53,68 Gef. 53,71	5,32 5,44	5,69 5,72	28,81 28,86
10	CH ₃	H	Cl	Cl	C ₁₁ H ₁₂ Cl ₃ NO (280,6)	82 (Äthanol)	77	Ber. 47,08 Gef. 47,11	4,31 4,50	4,99 5,01	37,88 37,91



Fortsetzung Tabelle 4:

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Summenformel (Mol.-Gew.)	Schmp.(aus) Sdp./Torr	Ausb. %	Analysc C	H	N	Cl
11	C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	C ₁₃ H ₁₈ ClNO ₂ (255,7)	196–198/1	67	Ber. 61,05 Gef. 61,13	7,09 7,11	5,47 5,51	13,87 14,00
12	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	OCH ₃	C ₁₄ H ₂₀ ClNO ₃ (285,8)	150–152/0,9	75	Ber. 59,03 Gef. 59,12	7,08 6,99	4,91 5,00	12,41 12,67
13	C ₂ H ₅	H	3,4,5-Trimethoxy		C ₁₅ H ₂₂ ClNO ₄ (315,8)	102 (Äthanol)	72	Ber. 57,03 Gef. 57,11	7,08 7,14	4,43 4,51	11,23 11,55
14	C ₂ H ₅	Cl	H	H	C ₁₂ H ₁₅ Cl ₂ NO (260,2)	71 (Petroläth.)	76	Ber. 55,39 Gef. 55,40	5,81 5,79	5,38 5,36	27,26 27,48
15	C ₂ H ₅	H	Cl	H	C ₁₂ H ₁₅ Cl ₂ NO (260,2)	196–198/5	66	Ber. 55,39 Gef. 55,41	5,81 5,86	5,38 5,50	27,26 27,50
16	C ₂ H ₅	H	H	Cl	C ₁₂ H ₁₅ Cl ₂ NO (260,2)	98 (Petroläth.)	65	Ber. 55,39 Gef. 55,44	5,81 5,79	5,38 5,42	27,26 27,66
17	C ₂ H ₅	H	Cl	Cl	C ₁₂ H ₁₄ Cl ₃ NO (294,6)	86 (Äthanol)	68	Ber. 48,93 Gef. 48,99	4,78 4,82	4,75 4,77	36,09 36,10
18	n-C ₃ H ₇	H	H	OCH ₃	C ₁₄ H ₂₀ ClNO ₂ (269,8)	198–200/0,9	67	Ber. 62,33 Gef. 62,40	7,47 7,49	5,19 5,22	13,14 13,44

grund ihrer strukturellen Ähnlichkeit mit N-Benzyl-β-chlorpropionamid⁴⁾ eine anti-convulsive Wirkung gegen den Elektroschock bei Mäusen besitzen.



I

II

$R^1 = \text{H, CH}_3, \text{C}_2\text{H}_5, \text{ und } n\text{-C}_3\text{H}_7$

$R^2, R^3 \text{ u. } R^4 = \text{H, CH}_3, \text{OCH}_3, \text{-O-CH}_2\text{-O- und Cl}$

$R^5 = \text{H, CH}_3, \text{C}_2\text{H}_5, \text{ und } \text{C}_6\text{H}_{11}$

$Y = \text{-CH}_2\text{-}, \text{-}\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}\text{-}, \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-}$



$\text{-}\overset{\text{N}}{\text{Z}}\text{-} = \text{Sekundäre Amine}$

Beschreibung der Versuche

Allgemeine Vorschrift zur Darstellung von N-Chloracyl-benzylaminen (I) aus Chloracyl-chloriden und Benzylaminen

Unter Rühren wurde zu einer Suspension von Benzylamin (0,1 m) in wäsr. Natronlauge (8 %, 200 ml) tropfenweise frisch destilliertes Chloracyl-chlorid bei 0,5° hinzugegeben. Man ließ noch zwei Std. bei Raumtemp. weiterführen. Das Reaktionsgemisch muß alkalisch reagieren. Die festen Bestandteile wurden abgetrennt, mit verd. Salzsäure und anschließend mit Wasser gewaschen. Nach dem Trocknen wurde aus einem geeigneten Lösungsmittel umkristallisiert. Flüssige oder niedrig schmelzende Produkte wurden in Äther aufgenommen und nach dem Abdampfen des Äthers fraktioniert.

Pharmakologisches Screening

Die in Tab. 2,3 und 4 beschriebenen Verbindungen wurden zuerst in den Riker Laboratories, Northridge, California, USA, und ebenfalls am Pharmazeutischen Institut Seth. G.S. Medical College, Bombay (Indien), auf ihren Einfluß auf das Zentralnervensystem und ihre antikonvulsive Wirkung gegenüber Elektroschock bei Mäusen getestet. Keine von diesen schützte vor den Auswirkungen des Elektroschocks. Ihre Wirkung auf das ZNS war in den meisten Fällen dämpfend. Bei allen Versuchstieren konnte sowohl Hyper- als auch Hypoaktivität, Gänsehautbildung (Piloerection), Juckreiz (irritability) und Abnahme der motorischen Aktivität beobachtet werden.

N-(2-Chlorpropionyl)-α-methylbenzylamin und N-(2-Chlorpropionyl)-α-äthyl-3,4-dichlorbenzylamin (Nr. 3 und 15 in Tab. 3) zeigten milde schlafherzeugende, antipyretische und ptotische Wirkungen. Weitere Untersuchungen sind in Vorbereitung.

4 S. Kushner, R.I. Cassell, J. Morton and J.H. Williams, J. org. Chemistry 16, 1283 (1951).