

## Notiz zur Umsetzung von $\alpha$ -Amino-pyridin mit Styroloxyd

(Synthese von N-( $\beta$ -Oxy- $\beta$ -phenyl-äthyl)-pyridonimin-(2) und -pyridon-(2))

Von JOSEF KLOSA

### Inhaltsübersicht

Styroloxyd kondensiert mit  $\alpha$ -Aminopyridin zu N-( $\beta$ -Oxy- $\beta$ -phenyläthyl)-pyridonimin-(2), welches sich durch Kochen mit Natronlauge in N-( $\beta$ -Oxy- $\beta$ -phenyl-äthyl)-pyridon-(2) überführen läßt.

---

Nach I. L. KNUNJANZ<sup>1)</sup> ist es bekannt, daß sich  $\alpha$ -Aminopyridin mit Äthylenoxyd zu N-( $\beta$ -Oxyäthyl)-pyridonimin umsetzt. Wir haben nun  $\alpha$ -Aminopyridin mit Styroloxyd zur Umsetzung gebracht. Bei dieser Umsetzung besteht die Möglichkeit der Bildung mehrerer Isomeren, so könnte Styroloxyd einmal mit der Aminogruppe des  $\alpha$ -Aminopyridins, ein andermal mit dem Pyridinringstickstoff in Reaktion treten. Schließlich vermag auch Styroloxyd sowohl in  $\alpha$ - wie  $\beta$ -Stellung des Phenylkerns Amine anzulagern, wie dies z. B. bei der Reaktion von Styroloxyd mit Benzylamin<sup>2)</sup> der Fall ist. Nach S. W. EMERSON<sup>3)</sup> bildet sich aus Styroloxyd und Ammoniak in 18proz. Ausbeute  $\beta$ -Hydroxy- $\beta$ -phenyl-äthylamin neben geringen Mengen 2,6-Diphenyl-morpholin. Auch hier wird berichtet, daß zahlreiche Nebenreaktionen vorherrschen. W. ZIEGENBEIN und W. FRANKE<sup>4)</sup> setzten Piperidin und eine Anzahl weiterer Basen unter dem katalytischen Einfluß von Natriumhydroxyd um und erhielten in glatter Reaktion praktisch nur die  $\beta$ -Hydroxy- $\beta$ -phenyl-äthylamine. Die Anlagerung der Amine an Styroloxyd erfolgt also überwiegend dergestalt, daß die Hydroxylgruppe in Nachbarschaft zu der Phenylgruppe tritt, es entstehen also Basen, welche den Konstitutionstyp der Sympathicomimetica (also Ephedrin-Adrenalin-Reihe) ergeben. In Analogie zu diesen Erfahrungen erhielten wir aus  $\alpha$ -Aminopyridin und Styroloxyd das N-( $\beta$ -Oxy- $\beta$ -phenyläthyl)-pyridonimin-(2) (I)

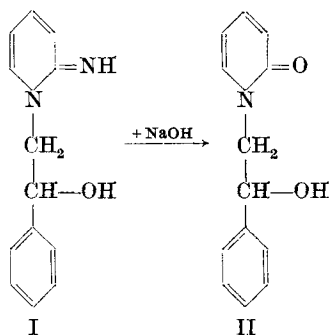
<sup>1)</sup> I. L. KNUNJANZ, Ber. dtsh. chem. Ges. **68**, 397 (1935).

<sup>2)</sup> C. L. BROWNE u. R. E. LUTZ, J. org. Chem. **17**, 1187 (1952).

<sup>3)</sup> S. W. EMERSON, J. Amer. chem. Soc. **67**, 516 (1945).

<sup>4)</sup> W. ZIEGENBEIN u. W. FRANKE, Chem. Ber. **90**, 2291 (1957).

Dessen Konstitution wurde in der Weise erbracht, daß I durch Kochen mit Natronlauge in ein Pyridon, nämlich N-( $\beta$ -Oxy- $\beta$ -phenyl-äthyl)-pyridon-(2) (II) überführt werden konnte:

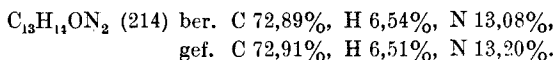


$\alpha$ -Aminopyridinderivate, ganz besonders das 4-Methyl-2-aminopyridin, zeichnen sich durch gute Kreislaufwirkung aus und sind der Wirkung der Sympathicomimetica ähnlich<sup>5) 6)</sup>. Die pharmakologische Überprüfung der eben von uns beschriebenen Substanzen hat keine Überlegenheit der Wirkung gegenüber dem 4-Methyl-2-aminopyridin oder dem einfachen  $\alpha$ -Aminopyridin ergeben. Damit scheint also für die Kreislaufwirkung mehr die unveränderliche Aminogruppe im Pyridinkern verantwortlich zu sein.

### Beschreibung der Versuche

( $\beta$ -Oxy- $\beta$ -phenyl-äthyl)-pyridonimin-(2) (I).

6 g  $\alpha$ -Aminopyridin wurden in 10 ml Methanol und 1 ml Wasser gelöst. Es wurden 12 g Styroloxyd hinzugesetzt und das Gefäß verschlossen stehen gelassen. Die anfangs gelbe Lösung wurde dunkler, und nach zwei Tagen begannen sich Kristalle abzuschneiden. Nach vier Tagen wurde filtriert, und die braunen Kristalle wurden aus Methanol umkristallisiert. Schmp.: 168° C.



( $\beta$ -Oxy- $\beta$ -phenyl-äthyl)-pyridon-(1) (II).

1 g I wurden mit 10 ml 10proz. Natronlauge unter Rückfluß mehrere Stunden (etwa 24–30 Stunden) gekocht. Es entwickelte sich Ammoniak. Die Kristalle verschwanden allmählich, und es setzte sich ein Öl ab. Nach Beendigung der Ammoniakentwicklung wurde abkühlen gelassen, wobei das Öl erstarrte, und gleichzeitig schieden sich in der darüberstehenden Flüssigkeit farblose Kristalle ab.

<sup>5)</sup> N. GOTTSSTEIN, H. HILLE, A. OBERSDORF u. ST. SCHAEFER, Arch. exper. Path. u. Pharmakol. **228**, 314 (1956).

<sup>6)</sup> E. v. HAXTHAUSEN, Arch. exper. Path. u. Pharmakol. **227**, 234 (1956).

Aus Alkohol, Schmp.: 118—120° C.

$C_{13}H_{13}O_2N$  (215) ber. C 72,55%, H 6,46%, N 6,51%,  
gef. C 72,62%, H 6,49%, N 6,58%.

*Berlin-Zehlendorf, Wissenschaftliches Privat-Labor.*

Bei der Redaktion eingegangen am 5. Dezember 1958.