

VIZSGÁLATOK AZ IZOKINOLIN SORBAN

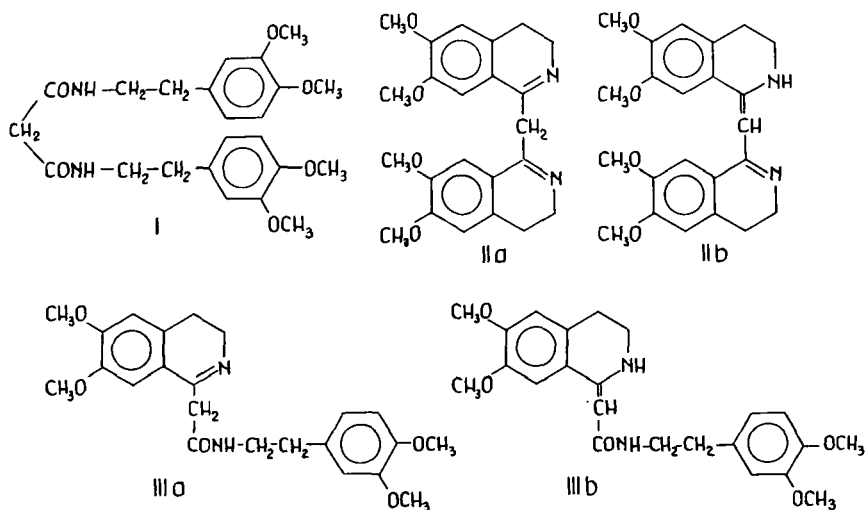
A bisz(6,7-dimetoxi-3,4-dihidro-1-izokinolil)-metán vizsgálata

Írta: KÓBOR JENŐ

Az 1-(etoxi-karbonil-metilén)-6,7-dimetoxi-1, 2, 3, 4,-tetrahydroizokinolin dietil-malonát és homoveratril-aminból kiinduló szintézise során, a kondenzációs folyamat nyers termékének foszfor(V)-triklorid-oxidos ciklizációjakor melléktermékként két kristályos anyagot izoláltunk. Közleményünkben ezen vegyületek vizsgálatáról adunk számot.

A szintézis során izolálható melléktermékek mennyisége részben a savamid képzéskor használt dietil-malonát és homoveratril-amin aránytól, részben a kapott nyers savamid *Bischler—Napieralski* ciklizáció körülményei szerint változott. BATTERSBY és munkatársai által közölt körülmények mellett [1] — nagy feleslegben alkalmazott dietil-malonát jelenlétében végzett savamid képzés esetén — a nyers savamid foszfor(V)-triklorid-oxidos ciklizációjánál a melléktermékek mennyisége elenyésző. A savamid képzéshez használt dietil-malonát mennyiségének csökkentésekor a ciklizált anyagban a melléktermék aránya megnövekedett.

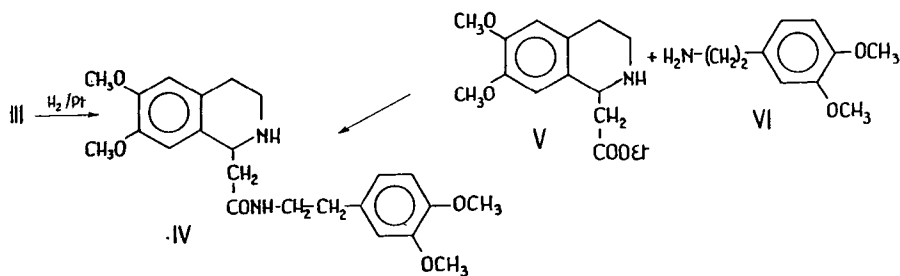
Feltételezésünk, hogy a két új vegyület közös előanyaga a dietil-malonát és homoveratril-amin kondenzációs reakciója során képződő malon-di(homoveratril-amid) (I) egyértelműen igazolható volt. A dietil-malonátra számított kétszeres mennyiségű homoveratril-amin termikus kondenzálása jó termeléssel eredményezte a kétszeres savamidot (I). Ennek foszfor(V)-triklorid-oxidos ciklizálása kloroformos ol-



1. ábra.

datban főtermékként a 156—158 °C-on olvadó vegyületet (II) eredményezte. A malon-di(homoveratril-amid)-ot rövidebb reakcióidővel ciklizálva a 135—136 °C-on olvadó termék (III) viszonylag jobb termelését tette lehetővé. A II és III feltételezett szerkezetét elemanalízis adataik és átalakításaik, valamint spektroszkópai adatok egyaránt alátámasztják.

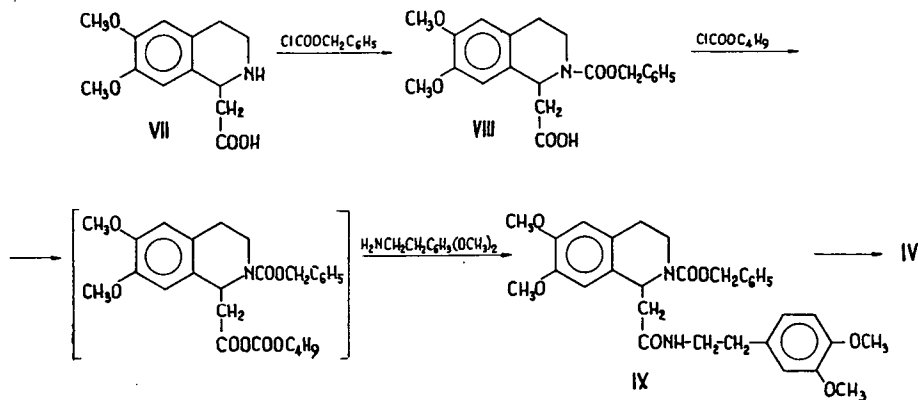
A III vegyület (IR és NMR) spektrumai a felírt tautomerek közül inkább a folyamatosan konjugált, exo kettőskötést tartalmazó forma (IIIb) jelenlétét mutatják. Ezt bizonyítja az NMR olefinjel 5,00 ppm-nél. A III katalitikus redukálással egy mól hidrogénfelvétellel a megfelelően szubsztituált tetrahydroizokinolin-származékká (IV)



2. ábra.

volt átalakítható. Utóbbi szerkezetét az 1-(etoxi-karbonil-metil)-6,7-dimetoxi-1,2,3,4-tetrahydroizokinolin (V) és homoveratrilamin (VI) közvetlen savamid képzésével, valamint a 6,7-dimetoxi-1,2,3,4-tetrahydro-l-izokinolin-ecetsavból (VII) kiindulva, a peptidszintézisben alkalmazott vegyes anhidrides eljárással [2—3] lefolytatott átalakítási sorozattal bizonyítottuk. A III vegyület II-vé történő átalakítása a malon-di(homoveratril-amid) ciklizálásánál alkalmazott körülmények között nem járt megfelelő eredménnyel.

A II vegyület feltűnő jellegzetessége az intenzív sárga szín. Az irodalomból ismert, szerkezetileg rokon vegyületek vizsgálati eredményei alapján feltételezhető, hogy a II vegyület intenzív sárga színe a két aromás gyűrű közötti konjugációnak tulajdonítható [5]. A két gyűrűrendszer között nem metilénhid (IIa), hanem sp^2 -es olefin



3. ábra.

A frakcionált kristályosítással kapott epimer sók XIa.HCl, XIb.HCl és a belőlük felszabadított bázisok kromatográfiai és spektroszkópiai vizsgálatok alapján egységesek. Mind a XIa-ból mind XIb-ből készített bázis palládium-szénnel dehidrogénezve a II-ből ugyanolyan körülmények mellett kapott bisz(6,7-dimetoxi-l-izokinolil)-metánt (X) eredményezte. Mindkét epimer bázis (XIa és XIb) aldehidekkel készíthető és jó eredménnyel pentaciklusos rendszerré (XII, XIII) alakítható. A bisz(6,7-dimetoxi-1,2,3,4-tetrahidro-l-izokinolil)-metán epimerék és a belőlük nyert pentaciklusos termékek sztereokémiai viszonyainak felderítése folyamatban van.

Kísérleti rész

N,N'-bisz(3,4-Dimetoxi-fenetil)-malonil-amid (I)

54,3 g (0,3 mól) frissen desztillált homoveratril-amin és 24 g (0,15 mól) dietil-malonát elegyét 6 órán át 140—150 °C-os olajfürdőn visszafolyatjuk, majd a reakcióelegyet vákuumban bepároljuk. A visszamaradó sűrű massa (64 g) dörzsölve átdermed. A nyers termék 86—88 °C-on olvad. Vízből kristályosítva fehér tük, szárítás után op.: 92—94 °C.

<i>Analízis</i>	$C_{23}H_{36}N_2O_6$	(430,49)
<i>Számított:</i>	C%: 64,16;	H%: 7,02;
<i>Talált:</i>	C%: 63,97;	H%: 7,22.

1-[(6,7-Dimetoxi-3,4-dihidro-l-izokinolil)-metilén-6,7-dimetoxi]-1,2,3,4-tetrahidrozokinolin (II)

60,2 g (0,14 mól) nyers malonsav-dihomoveratril-amid (I) 180 ml száraz kloroformos oldatát 48 ml foszfor(V)-triklorid-oxiddal elegyítjük. A reakcióelegyet gyakori összerázás közben két órán át vízfürdőn visszafolyatjuk. Erős sósavgáz fejlődése közben az oldat sötét vörösre színeződik. A kloroformot atmoszferikus nyomáson ledesztilláljuk, majd a reakcióelegyet vákuumban jól bepároljuk. A visszamaradó üvegszerűen szilárduló anyagot 200 ml vízben oldjuk, kétszer 100 ml éterrel mossuk. A vizes oldatot derítés után hűtés közben 40%-os kálium-hidroxid-oldattal lúgosítjuk. A kristályosan kivált terméket vízzel alaposan kimossuk, jól leszívátjuk és szárítjuk. A nyers termék súlya 51 g (92,7%). Benzolban oldjuk, a nem oldódó anyag kiszűrése után a benzolt vákuumban lepároljuk és a visszamaradó anyagot etanolból ismételt kristályosítjuk. Sárga kristályok, op.: 156—157 °C

<i>Analízis</i>	$C_{23}H_{26}N_2O_4$	(394,45)	
<i>Számított:</i>	C%: 70,02;	H%: 6,64;	N%: 7,10;
<i>Talált:</i>	C%: 69,61;	H%: 6,64;	N%: 7,01.

Sósavas sója ismételt kristályosítás utáni 232—234 °C-on olvad. Citromsárga kristályok. Analízis adatai a fenti anyag (II) monohidrokloridjára megfelelő.

<i>Analízis</i>	$C_{23}H_{26}N_2O_4 \cdot HCl$	(430,91)
<i>Számított:</i>	C%: 64,10;	H%: 6,31;
<i>Talált:</i>	C%: 64,31;	H%: 6,58.

Enyhébb körülmények mellett (kisebb foszfort(V)-triklorid-oxid felesleg, rövidebb reakcióidő) végzett malonsav-dihomoveratril-amid ciklizáció esetén a reakcióelegy feldolgozása során 134—135 °C-on olvadó melléktermék izolálható. Elemanalízis

adatai az 1-[(3,4-dimetoxi-fenetil-karbamoil)-metilén]-6,7-dimetoxi-1,2,3,4-tetrahidroizokinolinra (IIIb) megfelelő.

<i>Analízis</i>	$C_{23}H_{28}N_2O_5$	(412,47)	
<i>Számított:</i>	C%: 66,97;	H%: 6,84;	N%: 6,79;
<i>Talált:</i>	C%: 66,80;	H%: 6,90;	N%: 6,81.

Hidrokloridja (etanol-éterből) 176—178 °C-on olvad. Halványsárga kristályok.

1-[(3,4-Dimetoxi-fenetil-karbamoil)-metil]-6,7-dimetoxi-1,2,3,4-tetrahidroizokinolin (IV)

a. III bázisból nátrium-[tetrahydro-borát(III)]-mal

4,1 g 1-[(3,4-dimetoxi-fenetil-karbamoil)-metilén]-6,7-dimetoxi-1, 2, 3, 4-tetrahidroizokinolin (III) 40 ml metanolos szuszpenziójához 4 ml vizet elegyítünk, majd gyakori rázogatós közben, másfél óra alatt 3 g nátrium-[tetrahydro-borát(III)]-t adagolunk hozzá kis részletekben. A reakció során a kristályos anyag fokozatosan oldatba megy. A nátrium-[tetrahydro-borát(III)] beadagolása után a reakcióelegyet vízfürdőn 10 percig melegítjük, végül az oldatot vákuumban bepároljuk. A párlási maradékot 25 ml vízben oldjuk és az oldatot háromszor 30 ml benzollal extraháljuk. Szárítás után a benzolos oldatot vákuumban bepároljuk. A termék (3,4 g) benzol-éterből kristályosítva 131—132 °C-on olvad.

<i>Analízis</i>	$C_{23}H_{30}N_2O_5$	(414,48)	
<i>Számított:</i>	C%: 66,64;	H%: 7,29;	N%: 6,75.
<i>Talált:</i>	C%: 66,70;	H%: 7,56;	N%: 6,80.

b. III-hidrokloridból katalitikus redukcióval

A fenti 134—135 °C-on olvadó III bázisból készített sósavas só (op.: 176—178 °C) 4,5 g-ját 50 ml etanolban oldjuk majd 0,2 g előhidrogénezett platínakatalizátor jelenlétében hidrogénezük. A reakcióelegyet a számított mennyiségű (0,01 mól) hidrogén felvétele után (2 óra) még 30 percig rázatjuk. A katalizátor kiszűrése és az oldat bepárlása után visszamaradó anyagot etanol-éterből kristályosítjuk. 4 g fehér kristályok, op.: 193—195 °C. Ismételt kristályosítás után (op.: 194—195 °C) analízise az 1-[(3,4-dimetoxi-fenetil-karbamoil)-metil]-6,7-dimetoxi-1,2,3,4-tetrahidroizokinolin-hidrokloridra megfelelő.

<i>Analízis</i>	$C_{23}H_{31}N_2ClO_5$	(450,95)	
<i>Számított:</i>	C%: 61,20;	H%: 6,93;	N%: 6,21; Cl%: 7,86;
<i>Talált:</i>	C%: 61,10;	H%: 6,78;	N%: 6,39; Cl%: 7,90.

A sósavas sóból felszabadított és etanol-petroléterből kristályosított bázis (IV) olvadáspontja 131—132 °C, egyezően az a. módszerrel kapott termékkel; azzal keverve olvadáspont depressziót nem ad.

c. 1-(Etoxi-karbonetil-metil)-6,7-dimetoxi-1, 2,3,4-tetrahidroizokinolin (V) és homoveratril-amin (VI) kondenzálásával

Bisz(6,7-dimetoxi-1,2,3,4-tetrahydro-1-izokinolil)-metán (XIa, b)

a. 1-[(6,7-Dimetoxi-3,4-dihidro-1-izokinolil)-metilén]-6,7-dimetoxi-1,2,3,4-tetrahidroizokinolin (IIb) redukálásával (IIb → XIa, b)

α. Nátrium-[tetrahydro-borát(III)]-mal

13 g finoman elporított 1-[(6,7-dimetoxi-3,4-dihidro-1-izokinolil)-metilén]-6,7-dimetoxi-1,2,3,4-tetrahydroizokinolint (IIb) 156 ml 10% vizet tartalmazó metanolban szuszpendálunk, majd kis részletekben a lombik gyakori rázogatósa közben 11 g nátrium-[tetrahydro-borát(III)]-at adagolunk hozzá 5 óra alatt. A kristályos kiindulási anyag fokozatosan oldódik, miközben az oldat intenzív sárga színe halványsárgára változik. A nátrium-[tetrahydro-borát(III)] beadagolása után az oldatot vízfürdőn 10 percig melegítjük, majd vákuumban 40 ml-re betöményítjük. Az oldatot lehűlése után 150 ml hideg vízzel hígítjuk, majd a szerves bázist négyszer 60 ml benzollal extraháljuk. A benzolos oldatot kétszer 10 ml vízzel mossuk, nátrium-szulfáton szárítjuk és derítés után vákuumban bepároljuk. A maradék anyag 13 g, olaj. A reakció során képződött termék tisztítását sósavas sója formájában végezzük. Vízből, ill. etanolból végzett frakcionált kristályosítással két eltérő oldékonyságú termék (XIa és XIb) izolálható. A XIa anyag etanolban alig oldódik, vízből ismételt kristályítással tisztítva 254—266 °C-on olvad. Kofler-asztalon nézve 240 °C körül tús kristály formát vesz fel és ennek teljes megolvadása 264—266 °C-on történik. Szintelen kristályok. A XIb anyag vízben jól oldódik. Etanolból ismételt kristályosítás után 220—242 °C-on elhúzódva olvad. Kofler-asztalon nézve megolvadását megelőzően kristályformája nem változik. A XIa és XIb sókeverék teljes olvadása 252—254 °C. Négy párhuzamos kísérlet lapján a frakcionált kristályosítással kapott XIa anyag termelése 20—30%, a XIb anyagé 35—50%.

β. Katalikus hidrogénezéssel

11,82 g (0,03 mól) IIb bázis 120 ml jégecetes oldatát 0,5 g előhidrogénezett Adams-féle platinakatalizátor jelenlétében szobahőmérsékleten hidrogénezük. A számított kétszeres mennyiségű (0,06 mól, 1440 ml) hidrogén felvétele után (3,5 óra) a reakcióelegyet még félórán át rázatjuk, majd a katalizátort kiszűrjük és az ecetsavas oldatot derítés után vákuumban bepároljuk. A szárazra szívatást benzollal kétszer megismételjük. A párlási maradékot 50 ml vízben oldjuk és nátrium-hidroxiddal történő lúgosítás után az olajosan kiváló bázist négyszer 60 ml benzollal extraháljuk. A benzolos oldatot vízzel mossuk, nátrium-szulfáton szárítjuk és derítés után bepároljuk. A kapott termék tisztítása az *α. módszerrel* nyert anyaggal egyezően sósavas sójának frakcionált kristályosításával történt és az ott tapasztaltakkal egyezően két, oldékonyságban eltérő sósavas só nyerhető. A XIa és XIb termék tulajdonságai az *α. módszerrel* leírtakkal megegyező.

Négy párhuzamos kísérlet alapján a XIa anyag termelése 35—45%, a XIb anyagé 15—18%.

A XIa.HCl elemi analízise a bisz(6,7-dimetoxi-1, 2, 3, 4-tetrahydro-1-izokinolil)-metán-dihidrokloridra megfelelő.

<i>Analízis</i>	$C_{23}H_{32}N_2O_4Cl_2$	(471,40)
<i>Számított:</i>	C%: 58,59;	H%: 6,84;
<i>Talált:</i>	C%: 58,81;	H%: 6,92.

A XIb.HCl só analízise két molekula kristályvizet tartalmazó bisz(6,7-dimetoxi-1,2,3,4-tetrahydro-1-izokinolil)-metán-dihidrokloridra jó.

<i>Analízis</i>	$C_{23}H_{32}N_2O_4Cl_2 \cdot 2H_2O$	(507,43)
<i>Számított:</i>	C%: 54,43;	H%: 7,13;
<i>Talált:</i>	C%: 54,18;	H%: 7,28.

A XIa.HCl-ből felszabadított XIa bázis éterből ismételtlen kristályosítva op.: 111—113 °C, fehér tús kristályok; levegőn állva sárgára színeződik.

<i>Analízis</i>	$C_{23}H_{30}N_2O_4$	(398,49)	
<i>Számított:</i>	C%: 69,31;	H%: 7,58;	N%: 7,03;
<i>Talált:</i>	C%: 69,16;	H%: 7,37;	N%: 7,23.

A belőle visszaalakított sósavas só vízből kristályosítva 262—265 °C-on olvad. Hidrogén-bromiddal készített sója (vízből kristályosítva) 256—257 °C-on olvad.

A XIb.HCl-ből nyert XIb bázis éterből kristályosítva 101—103 °C-on olvad. Fehér por, levegőn állva sárgul. Elemi analízise a bisz(6,7-ditemoxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-izokinolil)-metán-monohidrátra felel meg.

<i>Analízis</i>	$C_{23}H_{30}N_2O_4 \cdot H_2O$	(416,50)	
<i>Számított:</i>	C%: 66,32;	H%: 7,74;	N%: 6,72;
<i>Talált:</i>	C%: 66,18;	H%: 7,73;	N%: 6,81.

A XIb bázisból visszaalakított sósavas só etanolból kristályosítva 216—240 °C-on elhúzódva oldódik. Hidrogén-bromiddal készített só 230—232 °C-on olvad.

b. 1-[(6,7-Ditemoxi-3,4-dihidro-1-izokinolil) -metilén]-6,7-dimetoxi-1,2,3,4-tetrahidroizokinolin sósavas sójának (II.HCl) katalitikus hidrogénezése

2,34 g 232—234 °C-on olvadó II-hidroklorid 60 ml 30% vizet tartalmazó metanolos oldatát (pH 7) 0,2 g előhidrogénezett Adams-féle platinakatalizátor jelenlétében hidrogénezük. A számított kétszeres mennyiségű (kb. 240 ml) hidrogén felvétele után (48 óra) az oldat kivilágosodik. A katalizátort kiszűjük, az oldatot derítés után bepároljuk és a maradékot 5 ml 70%-os etanolban oldjuk. A bázisos kémhatású (pH 9) oldatból állás után 0,4 g kristályos temék izolálható. Elhúzódva (220—242 °C) olvad. Vizes alkoholból ismételtén kristályosítva op.: 252—254 °C. Az egyesített lúgos kémhatású anyalúgból sósavval történő savanyítás után további (1 g) 252—254 °C olvadáspontú kistályok izolálhatók. Az *a. pontban* leírt módon nyert termékkel keverve depresszió nélkül olvad. Analízise egy mól kristályvizet tartalmazó bisz(6,7-dimetoxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-izokinolil)-metán-dihidrokloridra (XI.HCl) megfelelő.

<i>Analízis</i>	$C_{23}H_{32}N_2O_4Cl_2 \cdot H_2O$	(489,42)	
<i>Számított:</i>	C%: 56,44;	H%: 6,95;	
<i>Talált:</i>	C%: 56,36;	H%: 6,83.	

A XIa és XIb bázisok formaldehiddel nyert termékei

0,8 g bázis (XIa ill. XIb) 5 ml absz. dioxános oldatát 0,2 ml 37%-os formalin oldattal elegyítjük. Az oldat enyhén melegszik. A reakcióelegyet vízfürdőn 2 órán át melegítjük, majd vákuumban bepároljuk. A szárazra párolást kevés benzol hozzáadásával megismételjük. A kristályos terméket éterrel elkverve szűrjük, éterrel mosuk. A nyers terméket (termelés teoretikus) kristályosítva tisztítjuk.

A XIa bázisból nyert termék (XIIa) hófehér kristályok (benzol-petroéterből), op.: 136—137 °C.

A XIb bázisból kapott termék (XIIb) tús kristályok (benzoból), op.: 191—192 °C.

Mindkét anyag analízis adata a XII képletű termékre megfelelő.

<i>Analízis</i>	$C_{24}H_{30}N_2O_4$	(410,50)	
<i>Számított:</i>	C%: 70,21;	H%: 7,36;	N%: 6,82;
<i>Talált XIIa/XIIb:</i>	C%: 70,55/70,61;	H%: 7,30/7,42;	N%: 7,01/6,96.

A formaldehiddel kapott termékek (XIIa, b) vízben állandóak, híg sav hatására a kitudulási (XIa, b) anyagokká bomlanak.

XIa és XIb bázisok p-nitro-benzaldehiddel kapott termékei

Készítésük a formaldehiddel kivitelezett reakció analógja szerint történt. Termelés kvantitatív.

A XIa bázisból kapott termék (XIIIa) halványárga tük (benzol-éterből), op.: 208—209 °C.

A XIb bázisból kapott anyag (XIIIb) sárga por (benzolból), op.: 234—235 °C.

Mindkét anyag analízis adatai a XIII képletű termékre megfelelő.

<i>Analízis</i>	$C_{30}H_{33}N_3O_6$	(531,59)		
<i>Számított:</i>	C%: 67,77;	H%: 6,25;	N%: 7,90;	
<i>Talált XIIIa/XIIIb:</i>	C%: 67,56/67,64;	H%: 6,18/6,31;	N%: 7,69/7,89.	

A XIa, XIb és II bázisok dehidrogénezése

1 g XIa bázis 25 ml xilolos oldatához 0,3 g 10%-os palládiumszenet adunk, és nitrogén atmoszférában 20 órán át forraljuk. A palládiumos szén kiszűrése után a sárgás oldatot vákuumban bepároljuk és a visszamaradó 0,9 g bázisból készített sósavas söt ismételt kristályosítással (etanol-éterből) tisztítjuk, op.: 216—218 °C bomlással. Fehér kristályok. A XIb és II bázisból hasonló feltételek mellett egyező tulajdonságú termék kapható.

Az analízis adatok a bisz(6,7-dimetoxi-1-izokinolil)-metán-dihidroklorid (X.2HCl) monohidrátyjára megfelelők.

<i>Analízis</i>	$C_{22}H_{24}N_2Cl_2O_4 \cdot H_2O$	(481,36)		
<i>Számított:</i>	C%: 57,38;	H%: 5,44;	N%: 5,82;	Cl%: 14,73;
<i>Talált:</i>	C%: 57,15;	H%: 5,72;	N%: 5,77;	Cl%: 14,47.

Összefoglalás

Homoveratril-amin és dietil-malonát kondenzálásával kapott malon-di(homoveratril-amid)-ot (I) *Bischler—Napieralski ciklizációnak* alávetve a megfelelően szubsztituált izokinolinszármazékhoz (III) és bisz(izokinolil)-metán-származékhoz (II) jutotunk. Spektroszkópiai vizsgálatokkal és kémiai átalakításokkal bizonyítottuk a IIIb és IIb szerkezeteket. A II bázis hidrogénezésével bisz(6,7-dimetoxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-izokinolil)-metán epimereket kaptunk, melyek aldehidekkel pentaciklusos (XIIa,b és XIIIa,b) rendszereket eredményeztek.

Köszönetet mondok *dr. Lakosné Láng Kornéliának* és *dr. Bartókné Bozóki Gizellának* az analízisek elvégzéséért, valamint *Szűgyi-Lászlónak* a technikai segítségért.

IRODALOM

- [1] BATTERSBY, A. R., OPENSHAW, H. T., WOOD, H. C. S.: J. Chem. Soc. 1953. 2463.
- [2] BERGMANN, M., ZERVAS, L.: Ber. 65, 1192. (1932).
- [3] WIELAND, T., KERN, W., SEHRING, H.: App. 569, 117, (1950).
- [4] GHOSH, T. N., SUNIL KUMAR GANGULY, BHABATOSH BHATTACHARYA: J. Indian Chem Soc. 36, 699, (1959); 37, 287, (1960).

ИССЛЕДОВАНИЕ БИСА(6,7-ДИМЕТОКСИ-3,4,-ДИГИДРО-1-ИЗОКИНОЛИЛ)-МЕТАНА

Е. Кобор

Мы получили дериват биса(изокинолинила)-метана (II)-путем циклизации *Bischler—Napieralski* соответственно замещенному деривату изокинолина (III.) малон-ди(гомовератрил-амид) (I), полученный конденсацией гомовератрила-аминна и диэтиля-малоната. Мы

спектроскопическими исследованиями и химическими преобразованиями доказали наличие структуры III б и II б. Путем гидрирования базиса II. получили эпимеры биса(6, 7-диметокси-1, 2, 3, 4-тетрагидро-1-изокинолил)-метана, которые с альдегидами образовали пентациклические (XIIa, б и XIIIa, б) системы.

UNTERSUCHUNG DES BIS(6,7-DIMETHOXY-3,4-DIHYDRO-1-ISOCHINOLYL)-METHAN

J. Kóbor

Das mittels Kondensierung von Homoveratryl-amin und Diaethylmalonat erhaltene Malon-Di(homoveratryl-amid (I) wurde der *Bischler-Napieralski*'schen Zyklisation unterworfen und lieferte das entsprechend substituierte Isochinolinderivat (III) und Bis(isochinolyl)-methan-Derivat (II). Anhand spektroskopischer Untersuchungen und chemischer Umwandlung konnten die Strukturen IIIb und IIb erwiesen werden. Durch Hydrogenieren der Base II resultierten Bis(6,7-dimethoxy-1, 2, 3, 4-tetrahydro-1-isochinolyl)-methan-Epimere, die mit Aldehyden pentazyklische (XIIa, b und XIIIa, b) Systeme zeitigten.