

Christiane Blanchard, Jean-Marc Fabre, Claude Montginoul, Brat Ali
Chaffia, Eliane Torreilles, et Louis Giral

Laboratoire de Chimie Structurale Organique, U.S.T.L. Place E. Bataillon, 34060 Montpellier,
Cédex, France

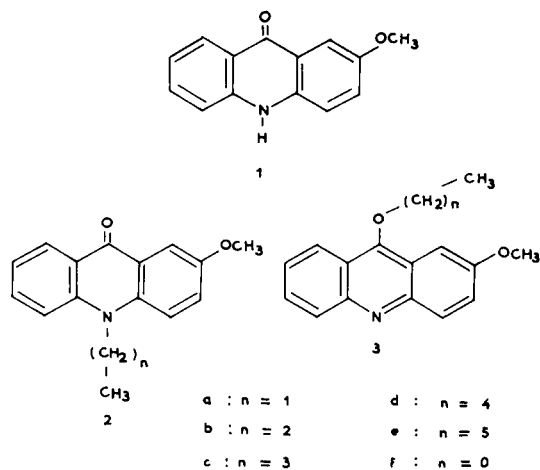
Reçu le 24 Mars 1977

Les résultats de différentes réactions de substitution de la méthoxy-2 acridanone-9 ont été interprétés sur la base d'une compétition entre les deux sites nucléophiles *N* et *O* de la molécule. Ils constituent les premiers exemples de *O*-alcoylation d'acridanone-9 substituée.

J. Heterocyclic Chem., 15, 149 (1978)

Dans la littérature (1) on rencontre de nombreux exemples de réactions permettant d'atteindre les dérivés *N*-alcoylés de l'acridanone-9, ou encore les dérivés *S*-alcoylés de l'acridanethione-9 substituée ou non (2) mais on ne relève aucun exemple de formation de mélanges de produits qui résulteraient d'une compétition entre la *O* et la *N* alcoylation d'acridanones substituées. Pourtant dans la littérature des études d'équilibres pyridone-2, hydroxy-2 pyridine en milieu non aqueux (3) et de stabilités de paires d'isomères méthoxy-4 pyridine et *N*-méthylpyridone-4 (4) ont été réalisées. Ceci, nous a incité à vérifier si lorsque l'acridanone-9 est convenablement substituée des compétitions entre la *O* et la *N*-alcoylation ne pourraient pas intervenir.

Pour cela, nous avons choisi la méthoxy-2 acridanone-9 (1) (5,6). Dans ce composé le groupement méthoxy en position 2 pouvait provoquer des modifications de la structure électronique (7,8) et partant accroître la réactivité de l'un ou l'autre des sites de l'ion ambident (9,10) vis-à-vis d'un même agent alcoylant.



Nous avons synthétisé le dérivé 1 à partir de l'acide *N*-(méthoxy-4' phényl) anthranilique (6). Les caractéristiques spectrales de ce produit sont précisées dans les tableaux I et II.

Dans le premier sont reportés les déplacements chimiques de chacun des protons du système aromatique. Cette analyse a pu être menée à bien en utilisant les techniques de double résonance. L'identification des

protons est basée sur le fait que le signal à 8,32 ppm a été attribué au proton en 8 péri à la fonction carbonyle, en accord avec des résultats notés à propos de l'acridanone non substituée (13). Par ailleurs la position du proton en 3, a été confirmée par l'analyse de dérivés nitro-2 et nitro-4 acridanone-9 que nous avons synthétisées pour une étude complémentaire et dont nous avons reporté les spectres dans le tableau I.

On remarquera de plus que le spectre infra-rouge (tableau II) de la méthoxy-2 acridanone-9 (1) en solution dans le chloroforme ne présente pas d'absorption dans la région des 3600 cm^{-1} attribuable à un groupement hydroxyle, mais seulement une bande intense à 1605 cm^{-1} due à la fonction carbonylée (10).

De même le spectre uv ne permet pas de déceler la présence des différents tautomères et par là, d'étudier un éventuel équilibre protomère. On observe seulement à 298 nm une bande d'absorption analogue à celle notée dans l'acridanone-9 et caractéristique de cette structure (11).

Nous avons ensuite réalisé sur l'acridanone 1 dans les mêmes conditions des réactions d'alcoylation. Dans chaque cas, le composé 1 a été métallé par l'hydruide de sodium en milieu diméthylformamide (14) puis après addition du bromure d'alcoyle correspondant $\text{Br}-(\text{CH}_2)_n-\text{CH}_3$ à 0° le mélange réactionnel a été porté à la température de 85° pendant 3 heures. On obtient ainsi à côté d'une faible quantité de produit de départ un mélange de deux produits isomères qui, après séparation sur colonne de silice ont été identifiés comme étant les composés 2 et 3 dérivés. Le premier est largement majoritaire comme indiqué dans le tableau II.

Les composés 2 n'étant pas décrits dans la littérature ont été identifiés (Cf. tableau II): Par infra-rouge: apparition de la bande d'absorption à 1600 cm^{-1} , caractéristique de la structure acridanone, (1) par uv: présence d'une absorption vers 300 nm, également caractéristique de ce type de structure; enfin en rmn on note l'absence du signal du proton en position 10 et la présence d'un doublet dédoublé aux alentours de 8 ppm correspondant au proton H_8 .

Quant aux composés isomère 3 qui étaient également inconnus, leurs caractéristiques spectroscopiques sont conformes à une telle structure. On note en infra-rouge à 1640 cm^{-1} la bande d'absorption d'intensité moyenne

compatible avec la structure acridine (15), l'absence en uv de la bande vers 300 nm et en rmn l'absence du doublet dédoublet aux environs de 8,0 ppm du proton H₈. Enfin, pour lever toute ambiguïté de détermination de structure nous avons réalisé la synthèse de ces composés en traitant la chloro-9 méthoxy-2 acridine (16) par l'alcoolate de sodium correspondant (17) et vérifier ainsi le bien fondé des attributions réalisées par spectroscopie.

Discussion.

Avant de tenter d'interpréter ces résultats nous avons vérifié que dans les conditions dans lesquelles on réalise les réactions d'alcoylation, un réarrangement des composés *N* et ou *O* alcoylés en leurs isomères respectifs ne se produisait pas. Nous avons noté que la réaction poursuivie durant 3 heures ou 24 heures ne conduisait à aucune modification de la composition du mélange réactionnel. Contrairement à ce qui est observé parfois avec certains carbanions azotés (3, 18 à 20), la composition en dérivés *N* et *O* alcoylés obtenus reflèterait donc la réactivité des espèces impliquées dans une telle réaction.

Bien que nous n'ayons pas mis en évidence la présence de l'espèce énolate, les résultats obtenus semblent confirmer le passage par cette forme intermédiaire, dans le milieu réactionnel utilisé.

Etant données la nature du solvant et celle de l'ion métallique impliqués dans cette réaction, on peut considérer (21) que les espèces nucléophiles réagissantes, sont sous forme libre en équilibre possible avec leurs formes ions associés au cation (22). Le fait que dans les mêmes conditions opératoires, précisées précédemment, les réactions d'alcoylation de l'acridanone **1** par le bromure d'éthyle ou par le bromure de pentyle conduisent à un même mélange de dérivés *N* et *O* alcoylés en présence ou

en l'absence de cryptand (2:2:1) (23,24) montrent que dans ces cas les entités réagissantes principales sont les anions libres.

Il est donc possible à partir de ce résultat d'envisager que les quantités de produits *N* et *O* alcoylés ne dépendront, dans le milieu choisi, que de la dureté ou de la mollesse de chacun des sites nucléophiles du dérivé **1** vis-à-vis d'un même électrophile (25). Un site énolate étant généralement plus dur que le site anion azoté (26, 27, 28) on doit s'attendre à obtenir préférentiellement des produits *N* alcoylés dans les cas considérés, où les sites électrophiles intervenant sont plutôt mous de part la nature du radical (alcoyle) et du nucléofuge (26,29).

Cette interprétation trouve une première confirmation dans les résultats que nous avons obtenus par action de l'iode de méthyle et du chlorure d'éthyle sur la méthoxy-2 acridanone-9 (Cf. tableau II), dans lesquels les sites électrophiles sont respectivement plus mous et plus durs que dans les cas précédents où les alcoylants sont des bromures d'alcoyle, les conditions opératoires demeurant les mêmes (26). En effet avec le premier réactif, seul, le dérivé *N*-méthylé **2f**, résulte de la réaction; par contre avec le second on obtient un mélange des composés **2a** et **3a** dans le rapport 2,5: 1 qui représente une nette augmentation en dérivé *O*-alcoylé lorsqu'on le compare au rapport 4: 1, noté pour ces mêmes produits lorsque l'alcoylant est le bromure d'éthyle.

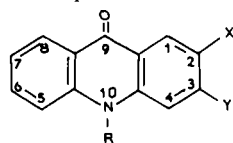
L'étude de l'alcoylation d'acridanones-9 est poursuivie en considérant différents réactifs électrophiles.

PARTIE EXPERIMENTALE

Les points de fusion non corrigés ont été déterminés à l'aide de l'appareil du Dr. Tottoli. Les chromatographies sur couche mince ont été effectuées sur plaque de silice F₂₅₄ Merck. Les chromato-

Tableau I

Déplacements chimiques (ppm) des protons des composés **1** et **2** en solution dans le DMSO-d₆ par rapport au TMS pris comme référence interne



1 ; R = H

2 ; R ≠ H

Dérivés	δH_1	δH_2	δH_3	δH_4	δH_5	δH_6	δH_7	δH_8	δ_{10}	Références
1 X = H, Y = H	8,40	7,39	7,89	7,67	7,67	7,89	7,39	8,40	11,8	(11)
	8,27	7,27	7,74	7,57	7,57	7,74	7,27	8,27	11,7	(12)
1 X = OCH ₃ , Y = H	7,71	3,88 (b)	7,51	7,61	7,66	7,74	7,25	8,31	11,80	(a)
1 X = NO ₂ , Y = H	9,03		8,54	7,72	7,67	7,96	7,48	8,35	12,41	(11)
	8,99		8,43	7,68	7,65	7,80	7,38	8,25	12,40	(a)
1 X = H, Y = NO ₂	8,80	7,53	8,80		8,16	7,91	7,47	8,37	11,46	(12)
2 R = C ₂ H ₅ , X = OCH ₃ , Y = H	7,77	3,88 (b)	7,40	7,64	7,70	7,76	7,22	8,40		(a)
2 R = C ₃ H ₇ , X = OCH ₃ , Y = H	7,78	3,88 (b)	7,39	7,70	7,72	7,75	7,25	8,40		(a)

(a) Ce travail. (b) δ OCH₃.

Tableau II

Caractéristiques des dérivés *N*-alcoylés et *O*-alcoylés résultant de l'action de différents bromures d'alcoyle

No.	Produit	F°	Rdt %	Ir ν cm ⁻¹	Uv
1	N-H	280	86	1605	298
2a	N-C ₂ H ₅	150	85 66 (a)	1600	305 (3,318)
2b	N-C ₃ H ₇	90	85	1600	302 (3,322)
2c	N-C ₄ H ₉	99	84	1600	300 (3,243)
2d	N-C ₅ H ₁₁	96	81	1600	300 (3,470)
2e	N-C ₆ H ₁₃	104	81	1600	300 (2,999)
2f	N-CH ₃	138	100 (b)	1600	300 (3,310)
3a	O-C ₂ H ₅		15 34 (a)	1640	
3b	O-C ₃ H ₇		15	1640	
3c	O-C ₄ H ₉		16	1640	
3d	O-C ₅ H ₁₁		19	1640	
3e	O-C ₆ H ₁₃		19	1640	

Rdt. Rendements relatifs en dérivés *N* et *O*-alcoylés. Ir (mesuré sur Perkin Elmer modèle 457), est exprimée en cm⁻¹ soit la position de la bande ν C=O des acridanones, soit la position de la bande caractéristique de la structure acridine, le solvant étant le chloroforme. Uv: (mesuré sur Beckmann DB), est exprimée en nm la position du maxima de la bande caractéristique des acridanones le solvant étant le méthanol et () est précisée la valeur de log ϵ . (a) Alcoylation par le chlorure d'éthyle. (b) Alcoylation par l'iode de méthyle.

graphies sur colonne ont été réalisées avec de la silice Merck (70-230 mesh). Les formules chimiques sont indiquées quand les analyses sont valables à $\pm 0,2\%$. Les spectres de rmn ont été enregistrés avec un appareil Varian A60, les déplacements chimiques, exprimés en ppm, sont mesurés par rapport au TMS pris comme référence interne dans le deutériochloroforme.

Ethyl-10 méthoxy-2 acridanone-9 (**2a**) et éthyloxy-9 méthoxy-2 acridine (**3a**).

A 2,48 g (0,011 mole) de méthoxy-2 acridanone-9 (**1**) dissoute dans 27 ml de diméthylformamide, est ajouté 0,72 g (0,03 mole) d'hydruure de sodium sous agitation à température ambiante et sous courant d'azote. Après agitation pendant 40 mn à 40°, on refroidit à 0° et on introduit 3,27 g (0,03 mole) de bromure d'éthyle. On maintient ensuite l'agitation pendant 3 heures à 85° puis on décompose à l'eau. Après avoir séparé par filtration un solide s, le filtrat est extrait au chloroforme. On lave la phase organique à l'eau. Après l'avoir séchée, on chasse le solvant. On récupère alors un résidu que l'on ajoute au solide s. On obtient ainsi un mélange de produits à partir duquel par chromatographie sur colonne de silice (éluant: éther-éther de pétrole 15/5) on isole à côté d'une faible quantité d'acridanone de départ **1** (0,1 g) Rf 0,14 (éther-éther de pétrole 15/5): l'éthyloxy-9 méthoxy-2 acridine (**3a**) et l'éthyl-10 méthoxy-2 acridanone-9 (**2a**). L'acridine

3a est ainsi obtenue avec un rendement de 0,4 g (14%); Rf 0,5 (éther-éther de pétrole 15/5); rmn (deutériochloroforme): δ ppm: 1,5 (triplet, CH₃-éthyle); 3,80 (singulet, CH₃-méthoxy); 4,25 (quartet, OCH₂-éthyle) 7,20-7,75 (multiplet, 4H-aromatiques); 7,90-8,25 (multiplet, 3H-aromatiques).

Anal. Calculé pour C₁₆H₁₅NO₂: C, 75,89; H, 5,93; N, 5,53. Trouvé: C, 75,88; H, 5,92; N, 5,51.

L'éthyl-10 méthoxy-2 acridanone-9 (**2a**).

Ce composé est obtenue avec un rendement de 12,2 g (78%), F 150° (benzène); Rf 0,35 (éther-éther de pétrole 15/5); rmn (deutériochloroforme): δ ppm: 1,42 (triplet, CH₃-éthyl); 3,85 (singulet, CH₃-méthoxy); 4,30 (quartet, NCH₂-éthyle); 7,20-7,98 (multiplet, 6H-aromatiques); 8,41 (doublet dédoublé, 1H-aromatique).

Anal. Calculé pour C₁₆H₁₅NO₂: C, 75,89; H, 5,93; N, 5,53. Trouvé: C, 75,88; H, 5,92; N, 5,52.

Si on opère de la même manière mais en utilisant comme dérivé halogéné 1,95 g (0,03 mole) de chlorure d'éthyle, on obtient un mélange dont la chromatographie sur colonne de silice permet d'obtenir (**3a**) avec un rendement de 0,89 g (32%) et **2a** avec un rendement de 1,66 g (60%).

Méthoxy-2 (*n*-propyl)-10 acridanone-9 (**2b**) et méthoxy-2 propoxy-9 acridine (**3b**).

Si on opère de la même manière que précédemment mais en utilisant comme dérivé halogéné 3,4 g (0,03 mole) de bromure de *n*-propyle, on recueille un mélange à partir duquel par chromatographie sur colonne de silice on obtient à côté d'une faible quantité (0,1 g) d'acridanone **1** les composés **3b** et **2b**.

La méthoxy-2 propoxy-9 acridine (**3b**).

Ce composé est isolée avec un rendement de 0,44 g (15%); Rf 0,31 (éther-éther de pétrole 10/10); rmn (deutériochloroforme): δ ppm: 1,23 (triplet, CH₃-propyle); 1,7-2,35 (multiplet, CH₂-propyle); 3,9 (singulet, CH₃-méthoxy); 4,17 (triplet, OCH₂-propyle); 7,2-7,8 (multiplet, 4H-aromatiques); 7,9-8,3 (multiplet, 3H-aromatiques).

Anal. Calculé pour C₁₇H₁₇NO₂: C, 76,40; H, 6,36; N, 5,24. Trouvé: C, 76,40; H, 6,36; N, 5,23.

Quant à la méthoxy-2 (*n*-propyl)-10 acridanone-9 (**2b**).

Ce composé est obtenu avec un rendement de 2,27 g (77,5%); F 90° (éther-éther de pétrole); Rf 0,16 (éther-éther de pétrole); 10/10; rmn (deutériochloroforme): δ ppm: 1,05 (triplet, CH₃-propyle); 1,5-2,1 (multiplet, CH₂-propyle); 3,86 (singulet, CH₃-méthoxy); 4,11 (triplet, NCH₂-propyle); 6,9-7,9 (multiplet, 6H-aromatiques); 8,49 (doublet dédoublé, 1H-aromatique).

Anal. Calculé pour C₁₇H₁₇NO₂: C, 76,40; H, 6,36; N, 5,24. Trouvé: C, 76,39; H, 6,34; N, 5,20.

(*n*-Butyl)-10 méthoxy-2 acridanone-9 (**2c**) et butoxy-9 méthoxy-2 acridine (**3c**).

Si on opère comme précédemment mais en utilisant comme dérivé halogéné 3,8 g (0,03 mole) de bromure de *n*-butyle, on recueille un mélange de produits à partir duquel par chromatographie sur colonne de silice on obtient les composés **3c** et **2c** ainsi qu'une faible quantité d'acridanone **1** (0,1 g).

La butoxy-9 méthoxy-2 acridine (**3c**) est recueillie avec un rendement de 0,43 g (14%); Rf 0,41 (éther-éther de pétrole 10/10); rmn (deutériochloroforme): δ ppm: 1,25 (triplet, CH₃-butyle); 1,5-2,3 (multiplet, CH₂CH₂-butyle); 3,88 (singulet, CH₃-méthoxy); 4,2 (triplet, OCH₂-butyle); 6,7-7,8 (multiplet, 4H-aromatiques); 7,95-8,3 (multiplet, 3H-aromatiques).

Anal. Calculé pour C₁₈H₁₉NO₂: C, 76,86; H, 6,76; N, 4,98.

Trouvé: C, 76,80; H, 6,72; N, 4,89.

La (*n*-butyl)-10 méthoxy-2 acridanone-9 (**2c**) est obtenue avec un rendement de 2,31 g (77%); F 99° (éther-éther de pétrole); Rf 0,29 (éther-éther de pétrole 10/10); rmn (deutériorchloroforme): δ ppm: 1,02 (triplet, CH₃-butyle); 1,2-2,1 (multiplet, CH₂CH₂-butyle); 3,88 (singulet, CH₃-méthoxy); 4,2 (triplet, NCH₂-butyle); 7,0-7,95 (multiplet, 6H-aromatiques); 8,55 (doublet dédoublé, 1H-aromatique).

Anal. Calculé pour C₁₈H₁₉NO₂: C, 76,86; H, 6,76; N, 4,98. Trouvé: C, 76,82; H, 6,72; N, 4,90.

Méthoxy-2(*n*-pentyl)-10 acridanone-9 (**2d**) et méthoxy-2 pentyloxy-9 acridine (**3d**).

Si on opère de la même manière que précédemment mais en utilisant comme dérivé halogéné 3,93 g (0,03 mole) de bromure de *n*-pentyle, on recueille un mélange de produits à partir duquel par chromatographie sur colonne de silice on obtient les composés **3d** et **2d** à côté d'une faible quantité d'acridanone **1** de départ (0,10 g).

La méthoxy-2 pentyloxy-9 acridine (**3d**) est isolée avec un rendement de 0,56 g (18%); Rf 0,4 (éther-éther de pétrole 10/10); rmn (deutériorchloroforme): δ ppm: 0,96 (triplet, CH₃-pentyle); 1,2-2,2 (multiplet, CH₂CH₂CH₂-pentyle); 3,88 (singulet, CH₃-méthoxy); 4,18 (triplet, OCH₂-pentyle); 7,2-7,8 (multiplet, 3H aromatiques).

Anal. Calculé pour C₁₉H₂₁NO₂: C, 77,28; H, 7,11; N, 4,74. Trouvé: C, 77,22; H, 7,09; N, 4,68.

La méthoxy-2(*n*-pentyl)-10 acridanone-9 (**2d**) est recueillie avec un rendement de 1,95 g (75%); F 96° (éther-éther de pétrole); Rf 0,25 (éther-éther de pétrole 10/10); rmn (deutériorchloroforme): δ ppm: 0,94 (triplet, CH₃-pentyle); 1,15-2,2 (multiplet, CH₂CH₂CH₂-pentyle); 3,90 (singulet, CH₃-méthoxy); 4,23 (triplet, N-CH₂-pentyle); 7,0-8,0 (multiplet, 6H-aromatiques); 8,55 (doublet dédoublé, 1H-aromatique).

Anal. Calculé pour C₁₉H₂₁NO₂: C, 77,28; H, 7,11; N, 4,74. Trouvé: C, 77,26; H, 7,09; N, 4,71;

(*n*-Hexyl)-10 méthoxy-2 acridanone-9 (**2e**) et hétéroxy-9 méthoxy-2 acridine (**3e**).

Si on opère comme précédemment mais en utilisant comme dérivé halogéné 4,35 g (0,03 mole) de bromure de *n*-hexyle, on recueille un mélange de produits à partir duquel par chromatographie sur colonne de silice on isole les composés **3e** et **2e** ainsi qu'une faible quantité d'acridanone **1** de départ (0,12 g).

L'hétéroxy-9 méthoxy-2 acridine (**3e**) est isolée avec un rendement de 0,52 g (15%); Rf 0,57 (éther-éther de pétrole 14/6); rmn (deutériorchloroforme): δ ppm: 0,9 (triplet, CH₃-hexyle); 1,0-2,3 (multiplet, CH₂CH₂CH₂-hexyle); 3,88 (singulet, CH₃-méthoxy); 4,2 (triplet, OCH₂-hexyle); 7,15-7,8 (multiplet, 4H-aromatiques); 7,9-8,27 (multiplet, 3H-aromatiques).

Anal. Calculé pour C₂₀H₂₃NO₂: C, 77,17; H, 7,39; N, 4,50. Trouvé: C, 77,13; H, 7,38; N, 4,47.

La (*n*-hexyl)-10 méthoxy-2 acridanone-9 (**2e**) est recueillie avec un rendement de 2,50 g (75%); F 104° (éther); Rf 0,48 (éther-éther de pétrole 14/6); rmn (deutériorchloroforme): δ ppm: 0,91 (triplet, CH₃-hexyle); 1,1-2,1 (multiplet, CH₂CH₂CH₂-hexyle); 3,89 (singulet, CH₃-méthoxy); 4,22 (triplet, NCH₂-hexyle); 7,0-8,0 (multiplet, 6H-aromatiques); 8,53 (doublet dédoublé, 1H-aromatique).

Anal. Calculé pour C₂₀H₂₃NO₂: C, 77,17; H, 7,39; N, 4,50. Trouvé: C, 77,17; H, 7,38; N, 4,48.

Méthoxy-2 méthyl-10 acridanone-9 (**2f**) (30).

Si on opère comme précédemment mais en utilisant comme dérivé halogéné 4,26 g (0,03 mole) d'iodure de méthyle, on recueille 2,38 g de composé **2f** (Rdt 90%) F 138° (éthanol) Rf:

0,45 (éther-éther de pétrole 16/4).

Synthèse d'alcoxy-9 acridine **3** à partir de la chloro-9 méthoxy-2 acridine.

On porte au reflux un mélange contenant 1 g de sodium, 0,05 mole d'alcool primaire correspondant et 13 ml de toluène. Après décomposition totale du sodium, on ajoute 1,5 g (0,006 mole) de chloro-9 méthoxy-2 acridine. On porte alors le mélange réactionnel au reflux pendant 24 heures. Après avoir refroidi, on ajoute au mélange 50 ml d'eau. On extrait au chloroforme. On lave la phase organique à l'eau. Après l'avoir séchée, on chasse le solvant. On recueille ainsi un résidu à partir duquel par chromatographie sur colonne de silice (éluant: éther-éther de pétrole 10/10) on sépare l'alcoxy-9 acridine correspondante **3** de la chloro-9 méthoxy-2 acridine qui n'a pas réagi.

Le tableau III rassemble les expériences qui ont été effectuées selon ce mode opératoire:

Tableau III

Alcool utilisé	produit obtenu 3	Rdt
éthanol	3a	87%
<i>n</i> -Propanol-1	3b	85%
<i>n</i> -butanol-1	3c	88%
<i>n</i> -pentanol-1	3d	86%
<i>n</i> -hexanol-1	3e	83%

BIBLIOGRAPHIE ET NOTES

- (1) R. M. Acheson, "The Chemistry of Heterocyclic Compounds", 2nd Ed., John Wiley and Sons, New York, N.Y.
- (2) E. F. Elslager, *J. Org. Chem.*, **27**, 4346 (1962).
- (3) M. J. Cook, A. R. Katritzky, L. G. Hepler et T. Matshi, *Tetrahedron Letters*, **31**, 2685 (1976).
- (4) P. Beak, J. Bonham et J. T. Lee, Jr., *J. Am. Chem. Soc.*, **90**, 1569 (1968).
- (5) J. H. Adams, P. Gupta, M. S. Khan, J. R. Lewis et R. A. Watt, *J. Chem. Soc., Perkin Trans. I*, 2089 (1976).
- (6) N. S. Drozdov et N. S. Leznora, *J. Gen. Chem. USSR*, **5**, 690 (1935).
- (7) J. F. Juby, T. W. Hudyma et M. Brown, *J. Med. Chem.*, **11**, 111 (1968).
- (8) A. I. Gurevich et Y. N. Sheinker, *Zh. Fiz. Khim.*, **33**, 883 (1953).
- (9) A. Weizmann, *Trans. Faraday Soc.*, **36**, 978 (1940).
- (10) V. P. Maksimets, *Khim. Geterotsikl. Soedin.*, 284 (1973); *Chem. Abstr.*, **78**, 123414f (1973).
- (11) R. M. Acheson, M. L. Burstall, C. W. Jefford et B. J. Samson, *J. Chem. Soc.*, 3742, (1954).
- (12) I. Panea et M. Ionescu, *Ser. Chem.*, **17**, 103 (1972).
- (13) D. Redmove, *J. Org. Chem.*, **34**, 1420 (1969).
- (14) R. R. Schumaker, *French Patent*, 1,527,778; *Chem. Abstr.*, **71**, 81175 (1969).
- (15) R. O. Clifton et C. M. Suter, *J. Am. Chem. Soc.*, **70**, 491 (1948).
- (16) A. Albert, B. Ritchie, *Org. Synth.*, **22**, 5 (1942).
- (17) A. Ledochowski et S. Skonieczny, *Rocz. Chem.*, **49**, 891 (1975).
- (18) O. Mumm et H. Moller, *Ber.*, **70**, 2214 (1937).
- (19) A. R. Katritzky et R. Jones, *J. Chem. Soc.*, 2947 (1960).
- (20) J. W. Schubenberg et S. Archer, *Org. React.*, **14**, 24 (1965).
- (21) A. J. Parker, *Quart. Rev.*, **16**, 163 (1962).
- (22) G. Nee et B. Tchoubar, *C. R. Acad. Sci.*, **283**, C, 223 (1976).

(23) C. J. Pedersen et H. K. Frensdorff, *Angew. Chem. Int. Ed. Engl.*, **11**, 16 (1972).

(24) Cryptand[221]ou Pentaoxa-4,7,13,16,21 diazabicyclo-1,10 tricasan-8,8,5.

(25) B. Saville, *Angew. Chem., Int. Ed. Engl.*, **11**, 928 (1967).

(26) J. Seyden-Penne, *Bull. Chem. Soc.*, 3871 (1968).

(27) H. O. House, "Modern Synthetic Reactions", Benjamin, New York, N.y., 1967, p. 7.

(28) G. Kolpman, *J. Am. Chem. Soc.*, **90**, 223 (1968).

(29) R. G. Pearson, *ibid.*, **85**, 3533 (1963).

(30) G. K. Hughes, N. K. Matheson, A. T. Norman et E. Ritchie, *Aust. J. Sci. Res.*, **A5**, 206 (1952).

English Summary.

The results of nucleophilic substitution of the 2-methoxy-9-acridone are discussed in terms of competition between both ionic sites N^+ and O^- , of the molecule. They are the first examples of *O*-alkylation of substituted 9-acridone.