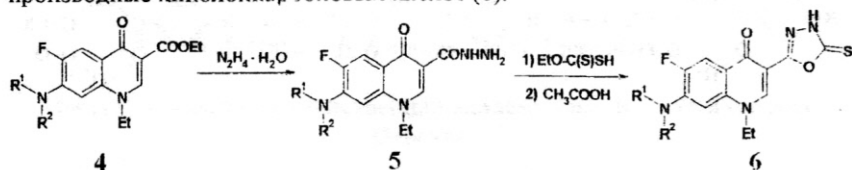


Синтезированные из эфиров (4) гидразиды фторхинолонов (5) при обработке этилксантогенатом калия образуют 3-гетерил(оксадиазолил)-производные хинолонкарбоновых кислот (6).



Найдено, что соединение (2a) проявляет высокую туберкулоостатическую активность *in vitro* (0,2 мкг/мл).

Литература

1. Wentland M.P., Pemi P.B., Dorlf P.H. // J. Med. Chem. 1993. Vol. 36. P. 1580-96.
2. Пат. 9907704 (1999). Европа // С.А. 1999. Vol. 130. 196577р.

МЕТОД СИНТЕЗА СОПРЯЖЕННЫХ НИТРОЕНКЕТОНОВ ИНДОЛЬНОГО РЯДА

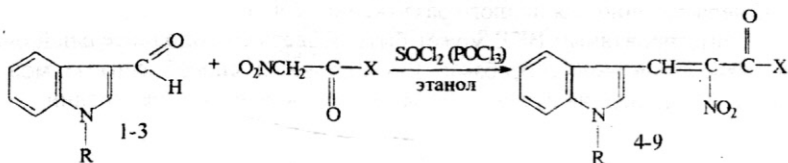
С.В. Бахарева, Н.И. Абоскалова, В.М. Берестовицкая

Российский государственный педагогический университет
им. А.И. Герцена
(Санкт-Петербург)

Азотсодержащие гетероциклические соединения чрезвычайно распространены в природе, они входят в молекулы алкалоидов, витаминов и пигментов. Многие соединения индольного ряда обладают высокой фармакологической активностью, в частности, к важным производным индола относятся триптофан, гетероауксин, триптамин и др.

Интерес к β-индолилнитроенкетонам, в молекулах которых при кратной связи находятся одновременно нитро- и карбонильная функции, связан с их высокой реакционной способностью по отношению к нуклеофильным реагентам и возможностью синтеза на их основе индолсодержащих α-аминокетонов, α- и γ-аминокислот и других потенциально биологически активных соединений.

Нами предложен метод синтеза серии сопряженных гем-ацетил(бензоил)нитроенкетон индольного ряда (4-9) прямым алкилированием нитроацетона и нитроацетофенона β-индольным альдегидом и его аналогами (1-3) в условиях кислотного катализа.



R=H (1), CH₃(2), CH₂C₆H₅ (3);

X = CH₃; R = H(4), CH₃(5), CH₂C₆H₅ (6); X = C₆H₅; R = H(7), CH₃(8), CH₂C₆H₅ (9)

Процесс протекает в абсолютном этаноле в присутствии SOCl₂ или POCl₃ и приводит к новым представителям нитроенкетонс - 2-(индол-3-ил)-1-ацетил(бензоил)-1-нитроэтенам (4-9); выходы аддуктов достигают 97%. Строение синтезированных соединений подтверждено спектральными методами.

СИНТЕЗ N-ВИНИЛКАПРОЛАКТАМА

Г.В. Шаталов, В.А. Кузнецов, С.Ю. Сорокатый, Е.В. Хавула

Воронежский государственный университет
(Воронеж)

Среди циклических N-виниламидов важное место занимает N-винилкапролактam (ВКЛ), полимеры которого приобрели практическую значимость не только как продукты различного назначения, но и как модели для изучения поведения высокомолекулярных соединений с амидными связями в водных растворах.

Разработан способ получения ВКЛ, основанный на взаимодействии капролактама (КЛ) с диалкилацеталем и последующим пиролизом образующегося N-(α-алкоксизетил)капролактама (АЭКЛ). Определены условия синтеза АЭКЛ реакцией с диэтил-, ди-n-пропил-, ди-n-бутил- и ди-n-бутилэтилацеталами. Найдено, что с высоким выходом целевого продукта реакция протекает в присутствии катализатора кислого характера. Определены факторы, влияющие на выход АЭКЛ, такие, как мольное соотношение реагентов, температура реакции и другие. Применение диацеталей, различающихся числом С-атомов в алкильном фрагменте молекулы, показало, что большему выходу АЭКЛ способствует использование диацеталей с меньшим алкильным заместителем.

При определении условий термического распада АЭКЛ изучалось влияние температуры и скорости подачи реагента в зону пиролитического разложения. Результаты изучения влияния температуры в интервале 400-520°C показали, что наибольший выход ВКЛ достигается при 450-475°C.