

1-АЦЕТИЛ(БЕНЗОИЛ)-1-НИТРО-2-ФУРИЛ(ТИЕНИЛ)ЭТЕНЫ: СИНТЕЗ И РЕАКЦИИ С ИНДОЛОМ

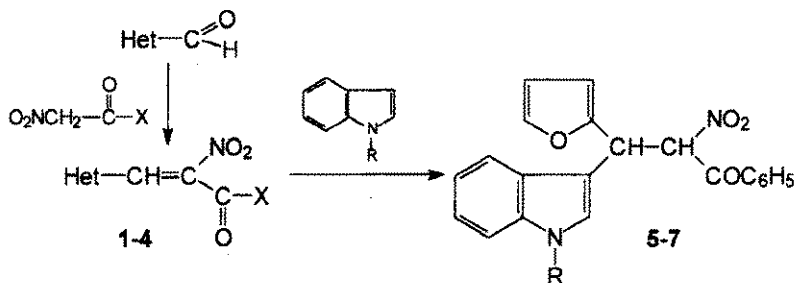
С.В.Бахарева, Н.И.Абоскалова, В.М.Берестовицкая

Российский государственный педагогический университет им.А.И.Герцена,
г.Санкт-Петербург

Известно, что фурановый и тиофеновый циклы являются важными структурными единицами многих биологически активных веществ; некоторые из них широко используются в качестве лекарственных препаратов (фурацилин, фуразолидон, фурадонин, кетотифен, пирантел и др.) [1].

Удобными синтонами для получения гетерилсодержащих α -аминокетонов, α - и γ -аминокислот и других веществ с практически полезными свойствами могут быть нитроэтенны, содержащие у одного атома углерода одновременно два электроноакцепторных заместителя - нитро- и карбонильную функции.

Нами разработан препаративно удобный одностадийный метод синтеза нитроенкетонов фуранового и тиофенового рядов прямым алкенилированием ацетил- и бензоилнитрометанов фурфуролом и тиофен-2-альдегидом в этаноле при 18-20°C в присутствии SOCl_2 (1,3) или при кипячении в бензоле в присутствии β -аланина и уксусной кислоты (2,4). Соединение (2) также получено реакцией бензоилнитрометана с дибутилацеталем фурфурола.



Het = 2-furyl: X = CH₃ (1), C₆H₅ (3); 2-thienyl: X = CH₃ (2), C₆H₅ (4);
R = H (5), CH₃ (6), C₂H₅ (7)

Высокая реакционная способность полученных нитроенкетонов подтверждена легкостью присоединения индола и его аналогов к 1-бензоил-1-нитро-2-(фурил-2)этену (2); полученные продукты (5-7) можно рассматривать как удобные исходные для синтеза фурил- и бензоилсодержащих триптаминов.

Литература

1. *Машковский М.Д.* Лекарственные средства. Изд.13-е, Харьков, Торсинг. 1997. 543 с. (т.1), 590 с. (т.2).