

1-АЦИЛ-2-ГЕТЕРИЛ-1-НИТРОЭТЕНЫ – УДОБНЫЕ СИНТОНЫ ДЛЯ ПОЛУЧЕНИЯ БИЯДЕРНЫХ СТРУКТУР

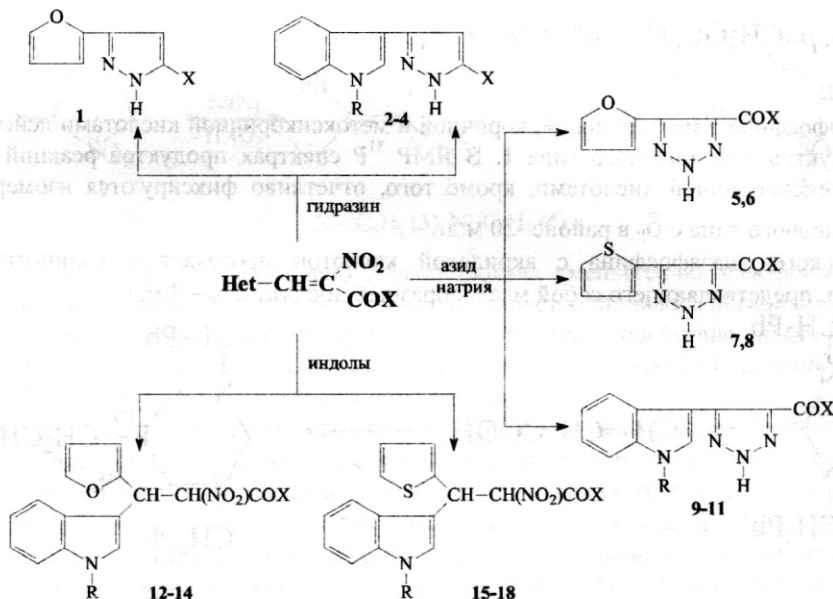
Бахарева С.В., Процкий Д.А., Абоскалова Н.И., Берестовицкая В.М.

Российский государственный педагогический университет им. А.И.Герцена
191186, Санкт-Петербург, наб. р. Мойки, д. 48, chemis@herzen.spb.ru

Среди замещенных фурана, тиофена и индола известно много веществ, обладающих высокой фармакологической активностью, например, фурацилин, фуразолидон, фуразонал, бензамон, кетотифен, пирантел, индопан, диазолин, индометацин и др. [1,2].

Изучаемые нами высокореакционноспособные электронодефицитные 1-ацил-2-гетерил(фурил-2, тиенил-2, индол-3-ил)-1-нитроэтенны [3] являются удобными исходными реагентами для конструирования новых гетероциклических структур и предложены в качестве синтонов для получения перспективных биядерных систем, содержащих в молекулах два разных гетероциклических фармакофора.

Так, на основе реакции 1-ацил-2-гетерил-1-нитроэтеннов с гидразином синтезированы ранее неизвестные фурил- и индолилсодержащие пиразолы (1-4). При взаимодействии *gem*-ацилнитроэтеннов с азидом натрия получена серия новых фурил-, тиенил- и индолилзамещенных 4-ацил-1,2,3-триазолов (5-11). Найдены эффективные условия присоединения индола и его *N*-алкильных аналогов по углерод-углеродной кратной связи нитроенкетоннов с образованием фуран- и тиофенсодержащих индолов (12-18).



X=CH₃ (5,7), C₆H₅ (1,6,8);

X=CH₃; R=H (15), CH₃ (2,9);

X=C₆H₅; R=H (12,16), CH₃ (3,10,13,17), C₂H₅ (14,18), COCH₃ (4,11)

Структура полученных соединений (1-18) подтверждена методами ИК, ЯМР ¹H спектроскопии и масс-спектрометрии.

Синтезированные бигетероциклические системы представляют интерес, как потенциально биологически активные вещества.

[1] М.Д. Машковский. Лекарственные средства. Изд. 13-е. Харьков: Торсинг. 1997. Т. I. Т. II.

[2] Справочник Видаль. Лекарственные препараты в России. М.: ОУПРЕ-АстраФармСервис, 2000. С. Б-401, Б-573.

[3] Берестовицкая В.М., Абоскалова Н.И., Ишмаева Э.А., Бахарева С.В. и др. // ЖОХ. 2001. Т. 71. Вып. 12. С. 2049-2056.

1-ACYL-2-HETERYL-1-NITRO-ETHENES AS CONVENIENT SYNTHONES FOR THE SYNTHESIS OF BINUCLEAR STRUCTURES

Bakhareva A.V., Protskiy D.A., Berestovitskaya V.M., Aboskalova N.I.

Herzen State Pedagogical University of Russia,
191186 Russia, St.Petersburg, Moika emb., 48

The reactions of 1-acyl-2-heteryl-1-nitro-ethenes with hydrazine, sodium azide and indole have been studied. A series of new perspective binuclear systems has been obtained. Every system comprises two different pharmacophores – furan or indole and 1,2,3-triazole; furan or thiophene and indole.