

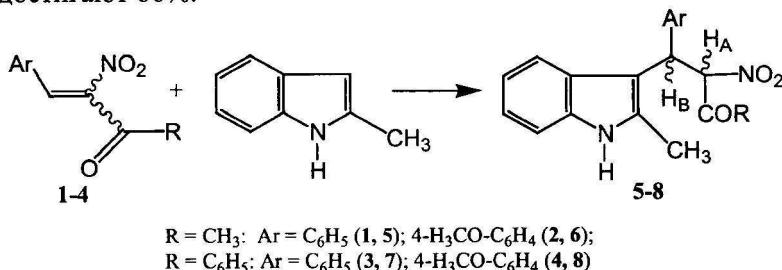
ГЕМ-АЦИЛНИТРОСТИРОЛЫ В РЕАКЦИИ С 2-МЕТИЛИНДОЛОМ

Фельгендер А.В., Савина А.С., Абоскалова Н.И., Берестовицкая В.М.

Российский государственный педагогический университет имени А.И. Герцена,
Россия, 191186, Санкт-Петербург, наб. р. Мойки, д. 48, e-mail: kohRGPU@yandex.ru.

Геминально активированные нитроэтины, содержащие в качестве второй электроноакцепторной функции карбонильную группу, являются вполне доступными веществами и проявляют высокую реакционную способность при взаимодействии с нуклеофильными реагентами. Повышенный интерес к химии этих высокоэлектронодефицитных соединений связан с возможностью легкого введения в их молекулы биологически активных блоков, а также с возможностью синтеза на их основе новых гетероциклических систем с потенциально полезными свойствами.

Нами найдены условия конденсации гем-ацетил- и гем-бензоил- \square -нитростиролов (1-4) с 2-метилиндолом. Реакции протекают при сплавлении эквимольных количеств исходных веществ в отсутствие растворителя, без участия посторонних каталитических агентов; выходы продуктов присоединения (5-8) достигают 86%.



Строение полученных соединений подтверждено данными ИК и ЯМР ^1H спектроскопии.

В ИК спектрах аддуктов (5-8) присутствуют интенсивные полосы поглощения валентных колебаний несопряженных нитро- ($1560, 1360 \text{ см}^{-1}$) и карбонильной ($1695-1735 \text{ см}^{-1}$) групп, а также полосы поглощения, принадлежащие колебаниям групп NH индольного кольца ($3465-3470 \text{ см}^{-1}$).

Спектры ЯМР ^1H продуктов заместительного присоединения 2-метилиндола к гем-ацилнитростиролам (5-8) содержат сигналы всех структурных фрагментов молекул. Полученные индолилнитрокетоны 5-8 представляют собой смеси диастереомеров, о чем свидетельствует удвоенный набор сигналов их протонов в спектрах ЯМР ^1H . Так, в спектре соединения (5) в CDCl_3 присутствуют удвоенные дублетные сигналы при 6.49, 6.46 и 5.29, 5.23 м.д., обусловленные резонансом метиновых протонов H_A и H_B , связанных друг с другом константами спин-спинового взаимодействия $^3J_{H_A H_B} 12 \text{ Гц}$ и $^3J_{H_A H_B} 11.8 \text{ Гц}$; а также сигналы протонов метильных групп при 1.88, 2.05 м.д. (COCH_3) и 2.45, 2.48 м.д. (CH_3) и группы NH-7.91, 7.85 м.д. Протонам фенильного и индольного циклов соответствуют мультиплеты в области 6.82-7.74 м.д.

Изученные реакции иллюстрируют возможность использования гем-ацилнитростиролов в качестве удобных нитрокетоалкилирующих агентов для соединений индольного ряда.

Синтезированные индолилнитрокетоны, содержащие в молекулах активную фармакофорную структуру индола, могут рассматриваться как предшественники новых арил- и карбонилсодержащих аналогов триптамина, а также \square -карболина, составляющего основу гарминовых алкалоидов.

GEM-ACYLNITROSTYRENES IN REACTION WITH 2-METHYLINDOLE

Felgendler A.V., Savina A.S., Aboskalova N.I., Berestovitskaya V.M.

Herzen State Pedagogical University of Russia,
191186, St.-Peterburg, Moika emb., 48, e-mail: kohRGPU@yandex.ru.

The interaction of gem-acylnitrostyrenes with 2-methylindole studied; new indolylnitroketones synthesized with high yields.