

## Синтез индолсодержащих оксимов гексагидробензофуранонов

Васильева О.С.,  
Степанова Т.Б.,  
Остроглядов Е.С.,  
Берестовицкая В.М.

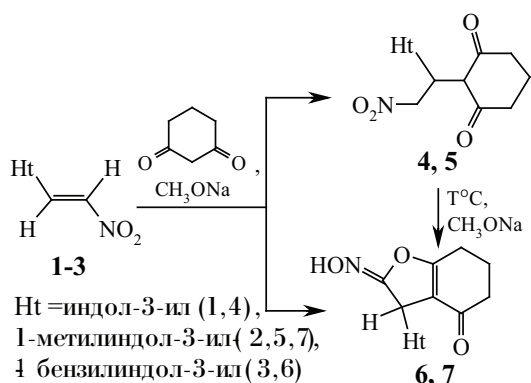
Российский государственный педагогический университет имени А.И. Герцена,  
наб. р. Мойки, д. 48, Санкт-Петербург, Россия;

e-mail: kohrgpu@yandex.ru

Природные и синтетические производные бензофурана и индола обладают высокой биологической активностью, в том числе нейрорепрессивным действием: антидепрессантным, анксиолитическим, антипсихотическим, противосудорожным [1]. Поэтому поиск новых биологически активных веществ в ряду индолзамещённых бензофуранов является перспективным направлением органической и фармацевтической химии.

Известно, что арилсодержащие оксимы гексагидробензофуранонов могут быть получены из соответствующих нитроэтанов в условиях основного [2-4] или кислотного [5] катализа.

Нами изучено взаимодействие 2-(индол-3-ил)-, 2-(1-метилиндол-3-ил)- и 2-(1-бензилиндол-3-ил)-1-нитроэтанов **1-3** с дигидрорезорцином. Реакции проводились в среде метанола в присутствии метилата натрия и соотношении нитроалкен: СН-кислота 1: 2 при температуре 18-20°C. Установлено, что нитроэтан **1,2** с дигидрорезорцином образуют в этих условиях аддукты линейного строения – нитроэтилциклогександионы **4,5** с выходами до 65%.



Взаимодействие нитроэтана **3** с дикетонном в аналогичных условиях приводит к

продукту циклического строения – оксиму гексагидробензофуранона **6**.

Отметим, что кипячение вещества **5** в среде метанола в присутствии метилата натрия в течение 12 часов сопровождается окислительной внутримолекулярной циклизацией и завершается образованием соответствующего оксима **7**.

Наблюдаемые различия в реакциях изучаемых нитроалкенов с 1,3-циклогександионом обусловлены, по-видимому, разной склонностью к гетероциклизации аддуктов Михаэлевской конденсации, зависящей в значительной степени от стерических особенностей гетерильных заместителей и их электронного влияния на реакционные центры, участвующие в последующих превращениях.

Строение полученных соединений **4-7** подтверждено методами ИК и ЯМР<sup>1</sup>H, <sup>13</sup>C спектроскопии.

Индолсодержащие гексагидробензофураноны **6-7** интересны как представители биядерных систем с двумя фармакофорными блоками; их первичные фармакологические исследования на животных показали, что они обладают нейротропной активностью.

### Литература

1. F. Boess, J. De Vry, C. Erb et al., *J. of Pharm. and Exper. Therap.*, 321(2), 716 (2007).
2. Hrnčiar P., Culak I., *Collect. Czech. Chem. Commun.* 49 (6), 1421 (1984).
3. Кобзарева В.Н. Васильева О.С., Зобачева М.М., Берестовицкая В.М., *ЖОрХ*, 33 (10), 1598 (1997).
4. Берестовицкая В.М., Остроглядов Е.С., Литвинов И.А., Васильева О.С., Криволапов Д.Б. *ЖОХ*, 74(9)б 1504 (2004).
5. Barange D., Raju B., Kavala V., Kuo C.-W., Tu Y.-C., Yao C.-F., *Tetrahedron*, 66, 3754 (2010).