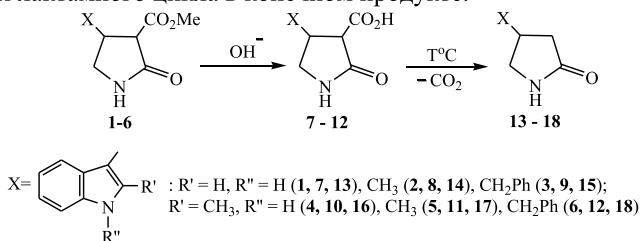


СИНТЕЗ ИНДОЛСОДЕРЖАЩИХ 2-ПИРРОЛИДОНОВ

Гаранина М.С., Городиичева Н.В., Пелипко В.В., Васильева О.С., Остроглядов Е.С.
 Санкт-Петербург, РГПУ им. А.И.Герцена
 kohrgpu@yandex.ru

Известно, что более десяти применяемых в настоящее время оригинальных ноотропных лекарственных средств (пиррацетам, фенотропил, ролипрам, фазорацетам) [1] являются производными 2-пирролидона, причём заместители в лактамном цикле оказывают значительное влияние на характер и степень биологической активности. Таким заместителем может быть индол, входящий в структуры молекул природных веществ (серотонин, стрихнин) и синтетических лекарственных средств (индопан, диазолин). Поэтому представляет интерес синтезировать ряд индолсодержащих 2-пирролидона - предшественников потенциально биологически активных производных пиррацетама.

Для получения целевых 4-(индол-3-ил)-2-пирролидонов в качестве исходных веществ нами выбраны индолилпирролидонкарбоксилаты (**1-6**) [2]. Их щелочной гидролиз в 10%-ном водно-спиртовом растворе [вода : спирт (1 : 10)] гидроксида натрия в течение 10 минут привёл к соответствующим 4-(индол-3-ил)-3-гидроксикарбонил-2-пирролидонам (**7-12**). Выбор условий гидролиза эфиров пирролидонкарбоновых кислот (**1-6**) обусловлен ацидофобными свойствами индольного кольца и необходимостью сохранения лактамного цикла в конечном продукте.



Полученный ряд пирролидонкарбоновых кислот (**7-12**) подвергался нагреванию выше температуры их плавления при пониженном давлении. Процесс сопровождался декарбосилированием и завершался выделением с хорошими выходами 4-(индол-3-ил)-2-пирролидонов (**13-18**). Индолсодержащие пирролидонкарбоксилаты (**7-12**) и 2-пирролидоны (**13-18**) получены впервые. Это бесцветные кристаллические вещества; они полностью охарактеризованы данными современных физико-химических методов.

Список литературы

- Malykh A., Sadaie M. Piracetam and piracetam-like drugs: from basic science to novel clinical applications to CNS disorders // *Drugs*. 2010. Vol. 70. № 3. P. 287-312.
- Васильева О.С., Остроглядов Е.С., Пелипко В.В., Александрова С.М., Берестовицкая В.М. // Сб. тез. междисциплинар. симп. по мед., орг. и биол. хим. – МедОргБиоХим-2014 (МОБИ-Хим2014). Крым, Новый Свет, 25-28 мая 2014 г. С. 34.