

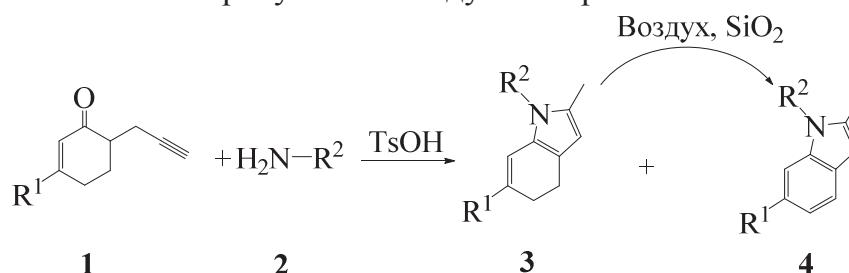
А.С. Орёл, асп.; В.С. Безбородов, проф., д-р хим. наук;
С.Г. Михалёнок, зав. кафедрой орг. химии, канд. хим. наук;
Н.М. Кузьменок, доц., канд. хим. наук (БГТУ, г. Минск)

ПОЛУЧЕНИЕ 2-МЕТИЛИНДОЛОВ НА ОСНОВЕ 6-ПРОПАРГИЛЦИКЛОГЕКС-2-ЕНОНОВ

Химия индолов является одним из наиболее популярных направлений в современной органической химии. Данное обстоятельство связано с тем, что огромное количество биологически активных производных индола было выделено из природных источников. Также на сегодняшний день разработано и внедрено в медицинскую практику множество лекарственных препаратов, эффективность которых обусловлена действием производных индола. В распоряжении органиков-синтетиков имеется большой арсенал методов получения индолов. Стоит отметить, что всё большую популярность набирают методы с применением металлокомплексного катализа.

Задача разработки простых и эффективных методов получения полизамещённых индолов на основе реакционноспособных соединений всегда остаётся актуальной. В этом отношении полиненасыщенные кетоны могут рассматриваться как удобные исходные соединения для решения данной задачи. Направленная модификация реакционноспособных циклогекс-2-енонов является перспективным направлением, которое в данный момент развивается на кафедре органической химии БГТУ.

В ходе серии экспериментов нами были изучены трансформации 6-пропаргилциклогекс-2-енонов **1** в присутствии избытка первичных аминов **2**, а также различных катализаторов. Показано, что наиболее эффективен кислотный катализ с применением *n*-толуолсульфокислоты. При этом взаимодействие енонов **1** с аминами **2** приводит к получению смеси 4,5-дигидроиндолов **3** и индолов **4**. Производные **3** подвергаются ароматизации на силикагеле в присутствии воздуха с образованием **4**.



$\text{R}^1 = 4\text{-CH}_3\text{OC}_6\text{H}_4; 4\text{-CH}_3\text{C}_6\text{H}_4;$

$\text{R}^2 = \text{C}_6\text{H}_5; 4\text{-CH}_3\text{C}_6\text{H}_4; 4\text{-BrC}_6\text{H}_4; 4\text{-NO}_2\text{C}_6\text{H}_4; \text{Bn}; \text{CH}_2\text{COOCH}_3; \text{аллил};$

$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}; \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}; n\text{-C}_{16}\text{H}_{33}.$

Разработанный метод позволяет получать индолы **4** с выходами 17–81%. Строение всех синтезированных соединений подтверждено данными ЯМР- и ИК-спектроскопии, а также элементного анализа.