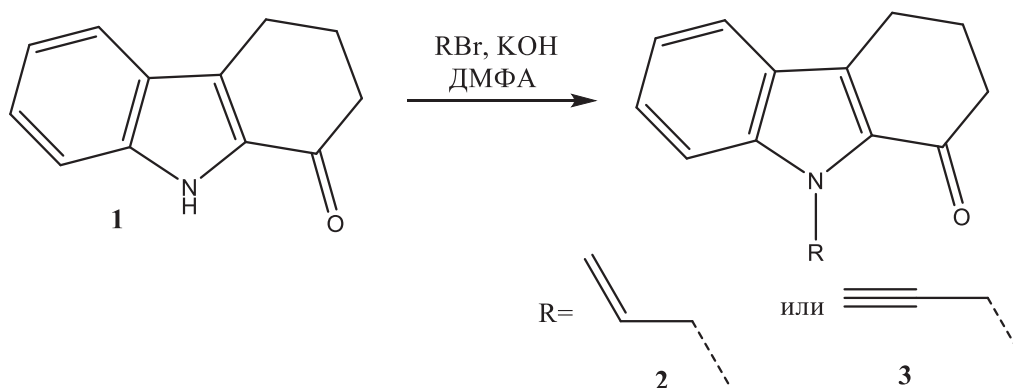


СИНТЕЗ АЛКЕНИЛ- И АЛКИНИЛЗАМЕЩЕННЫХ КАРБАЗОЛОНОВ

Структурные особенности и перспектива фармакологического применения природных соединений карбазола привели к значительному развитию химии данного класса соединений. Биологически активные алкалоиды карбазола выделены из различных природных источников. Способность продуцировать и накапливать фитокарбазолы встречается у четырёх родов растений *Murraya*, *Clausena*, *Glycosmis* и *Micromelum* семейства *Rutaceae*. Алкалоиды карбазола обладают крайне широким спектром биологической активности: противомикробной активностью, в том числе и в отношении плазмодиев, цитотоксичны в отношении различных линий раковых клеток, противовоспалительным, антиагрегантным, вазорелаксирующим, антиоксидантным, антигиперлипидемическим, антигипергликемическим, гепатопротекторным эффектами, также описано проявление активности фитокарбазолов к ВИЧ [1, 2].

Функционализация, описанная в работе, а именно введение алкенильных и алкинильных заместителей в сочетании с карбонильной группой 2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-1-она **1** обеспечивает их высокую реакционную способность и вариабельность. Это делает возможным получение на их основе широкого круга различных гетероциклических соединений, аналогов биологически активных веществ.

Введение заместителей в положение девять тетрагидрокарбазолона **1** проводили действием аллил(пропаргил)бромидов и гидроксида калия в диметилформамиде при комнатной температуре. Выходы 9-аллил- и 9-пропаргил-2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-1-онов **2** и **3** составили 77 и 45%, соответственно.



Пропаргилзамещенный аналог **3** был получен с меньшим выходом из-за большей лабильности исходного пропаргилбромидов, а также самого продукта реакции в щелочных условиях. Проведение реакции и осуществление стадий очистки (промывание и экстракция) в диапазоне температур от -13°C до 0°C позволило получить пропаргилкарбазолон **3** с выходом 80% в связи с уменьшением вклада побочных реакций.

Индивидуальность синтезированных соединений подтверждена методом ТСХ, а структура доказана данными ЯМР- и ИК-спектроскопии.

ЛИТЕРАТУРА

- Schmidt, A. W. Occurrence, biogenesis, and synthesis of biologically active carbazole alkaloids / A. W. Schmidt, K. R. Reddy, H.-J. Knölker // *Chemical Reviews*. – 2012. – Vol. 112. – P. 3193–3328.
- Greger, H. Phytocarbazoles: alkaloids with great structural diversity and pronounced biological activities / H. Greger // *Phytochem Reviews*. – 2017. – Vol. 16. – P. 1095–1153.