ОКИСЛИТЕЛЬНАЯ ЦИКЛИЗАЦИЯ 2-АРИЛ-4-(2-АМИНОФЕНИЛ)-4-ОКСО-БУТИРОНИТРИЛОВ – ПОДХОД К ПЕРСПЕКТИВНЫМ ПРОИЗВОДНЫМ 3-ОКСОИНДОЛА

И.В. Аксенова, Д.А. Аксенов, Н.А. Аксенов, Д.С. Аксенова, Л.А. Притыко

Химико-Фармацевтический факультет, Северо-Кавказский федеральный университет,
355017, Россия, г. Ставрополь, ул. Пушкина, д. 1.

DOI: 10.19163/MedChemRussia2021-2021-222

E-mail: naksenov@ncfu.ru

Индоксил является фрагментом, присутствующим в широком круге природных биологически активных малых молекул, таких как: индирубин, Racemozine A, Isastine A, Aristotelone, Brevinamide, Austamide, Duocarmycin.

Мы обнаружили, что 2-арил-4-(2-аминофенил)-4-оксо-бутиронитрилы под действием системы КОН/ДМСО претерпевают окислительную циклизацию, что приводит к малодоступным 2-(3-оксоиндолин-2-илиден)-2-арилацетонитрилам. Производные N-алкил-анилина ведут себя иначе: отсутствие кислого NH-протона приводит к быстрому гидролизу до соответствующих 2-ацил-3-гидроксииндолов, что значительно снижает выход целевого продукта. Высокая реакционная способность 2-(3-оксоиндолин-2-илиден)-2-арилацето-нитрилов не только делает их перспективными билдинг-блоками для сборки целого ряда производных индола, но и обуславливает их низкую доступность. В единственной работе, посвящённой данным соединениям, описано взаимодействие с гидразин-гидратом приводящее к продуктам с хорошей противотуберкулезной активностью [1].

Исследование выполнено за счет гранта Российского научного фонда
(проект № 21-73-10029).

Литература

- [1] V.S. Velezheva, P.J. Brennan, V.Yu. Marshakov, D.V. Gusev, I.N. Lisichkina, A.S. Peregudov, L. N. Tchernousova, T.G. Smirnova, S.N. Andreevskaya, A.E. Medvedev, J. Med. Chem., 2004, 47 (13), 3455-3461.