ПОЛУЧЕНИЕ 5,6-ДИГИДРОКСИИНДОЛ-2-КАРБОНОВОЙ КИСЛОТЫ – БИОСИНТЕТИЧЕСКОГО ПРЕДШЕСТВЕННИКА МЕЛАНИНОВ

М.А. Барабанов¹, Г.С. Мартянов^{1,2}, А.В. Пестов^{1,2}

¹Институт органического синтеза УрО РАН, 620137, Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22.

²Уральский федеральный университет, 620002, Екатеринбург, ул. Мира, 19.

DOI: 10.19163/MedChemRussia2021-2021-421

E-mail: flimsey@mail.ru

5,6-Дигидроксииндол-2-карбоновая кислота (DHICA) **1** [1] является предшественником в биосинтезе природных пигментов – меланинов, присутствующих в тканях живых объектов, и выполняющих противовирусную и радиопротекторную функции.

В продолжение наших работ по синтезу и изучению предшественников биополимеров меланинов, мы осуществили ряд превращений, ведущих к эндогенному интермедиату – кислоте **1**. В качестве исходных веществ были выбраны легкодоступные азлактоны **2**, поскольку вследствие их богатой химии, они могут быть легко превращены в другие классы соединений. Так, гидролиз **2** в соляной кислоте приводит к замещенной пировиноградной кислоте **4**, которая через оксим **6** может быть превращена в О,О-диметилированную DHICA **7**. При нитровании азлактона **2**, образуется 2-нитропроизводное **3**, ступенчатый гидролиз которого дает нитрокислоту **5**, далее при восстановлении избытком железа (II) в водном аммиаке образуется целевой интермедиат **7**, подвергаящийся реакции с BBr₃ для депротекции гидроксигрупп, что и приводит к целевому соединению – DHICA **1**. Приведенные синтетические цепочки пройдены впервые.

Литература

- [1] Corona, A.; Cosconati, S.; D'Amore, V. M.; Di Leva, F. S.; Esposito, F.; Grandi, N.; Koneru, P. C.; Tramontano, E.; di Santo, R. *Antiviral Res.* 2020, 174, 104671.