

6-Оксоиндено[2,3-*g*]фуразано[3,4-*b*]пиразино[4,5-*b*]пирозин (VII). Выход 87%.  $T_{пл} > 300^\circ\text{C}$  (разл.). ИК спектр:  $1720\text{ см}^{-1}$  (C=O). Спектр ПМР (ДМСО): 8,25...7,30 м. д. (4H, м, Наром). Найдено, %: C 56,1; H 1,8; N 30,2.  $\text{C}_{13}\text{H}_4\text{N}_6\text{O}_2$ . Вычислено, %: C 56,5; H 1,5; N 30,4.

#### СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Еремеев А. В., Андрианов В. Г., Пискунова И. П. // ХГС. — 1978. — № 5. — С. 613.

С. В. Пирогов, С. Ф. Мельникова, И. В. Целинский

Санкт-Петербургский государственный  
технологический институт (технический  
университет), Санкт-Петербург 198013

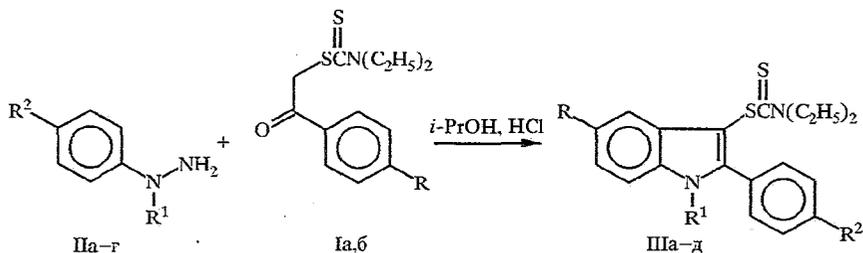
Поступило в редакцию 04.08.97  
После переработки 08.12.97

ХГС. — 1997. — № 12. — С. 1699.

### НОВЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ ИНДОЛА. СИНТЕЗ S-(ИНДОЛИЛ-3)ДИЭТИЛДИТИОКАРБАМАТОВ

Индольное ядро является основой разнообразных биологически активных соединений [1, 2]. Известно, что диалкилдитиокарбаматы успешно применяют в качестве фунгицидов, антибактериальных препаратов [3].

Мы предположили, что, используя реакцию Фишера [4], удастся получить соединения, сочетающие оба указанных структурных фрагмента. С этой целью взаимодействием диэтилдитиокарбамата натрия с фенацилбромидами по способу [5] синтезированы фенациловые эфиры диэтилдитиокарбаминовой кислоты Ia,б. Оказалось, что при нагревании соединений Ia,б с арилгидразинами IIa—г в изопропиловом спирте в присутствии кислоты (3...5 ч) образуются с выходом 50...70% не описанные ранее индолы IIIa—д.



Ia R = H, б R = Br; II a R<sup>1</sup> = R<sup>2</sup> = H; б R<sup>1</sup> = CH<sub>2</sub>Ph, R<sup>2</sup> = OMe; в R<sup>1</sup> = Ph, R<sup>2</sup> = H; г R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = Br;  
III a R = R<sup>1</sup> = R<sup>2</sup> = H; б R = H, R<sup>1</sup> = CH<sub>2</sub>Ph, R<sup>2</sup> = OMe; в R = R<sup>2</sup> = H, R<sup>1</sup> = Ph; г R = R<sup>1</sup> = H,  
R<sup>2</sup> = Br; д R = R<sup>2</sup> = Br, R<sup>1</sup> = H

Строение индолов IIIa—д доказано с помощью спектров ЯМР <sup>1</sup>H (250 МГц, CDCl<sub>3</sub>), данные элементного анализа совпадают с рассчитанными. Общая методика синтеза индолов III: 5 ммоль арилгидразина II, 5 ммоль кетона I и 10 ммоль конц. HCl кипятят с обратным холодильником в *i*-PrOH 3...5 ч. Охлаждают реакционную смесь до комнатной температуры. Выпавший осадок отфильтровывают, промывают водой; из маточного раствора отгоняют *i*-PrOH, остаток обрабатывают водой, экстрагируют бензолом, бензол упаривают. Осадок и бензольную вытяжку хроматографируют на колонке с силикагелем, элюент бензол. Индолы IIIa—д кристаллизуют из этанола.

S-(2-Фенилиндолил-3)диэтилдитиокарбамат (Ша). Выход 72%.  $T_{пл}$  95...96 °С. Спектр ПМР: 1,35 (3H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 1,43 (3H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 3,96 (2H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 4,10 (2H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 7,60 (1H, м,  $J_o = 8,0$ ,  $J_m = 2,5$  Гц, 4-Н); 7,15...7,70 (8H, м,  $N_{аром}$ ); 8,60 м. д. (1H, с, NH). Найдено, %: С 66,80; Н 6,11; N 7,91; S 18,56.  $\text{C}_{19}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{S}_2$ . Вычислено, %: С 67,02; Н 5,92; N 8,23; S 18,83.

S-(1-Бензил-5-метокси-2-фенилиндолил-3)диэтилдитиокарбамат (Шб). Выход 55%.  $T_{пл}$  143...144 °С. Спектр ПМР: 1,30 (3H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 4,03 (2H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 3,86 (3H, с,  $\text{OCH}_3$ ); 5,32 (2H, с,  $\text{CH}_2\text{Ph}$ ); 6,82 (1H, м,  $J_o = 8,1$  Гц, 6-Н); 7,08 (1H, д,  $J_o = 8,1$  Гц, 7-Н); 7,22 (1H, м, 4-Н); 7,30...7,48 м. д. (10H, м,  $N_{аром}$ ). Найдено, %: С 70,11; Н 5,90; N 5,95; S 13,64.  $\text{C}_{27}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{OS}_2$ . Вычислено, %: С 70,40; Н 6,13; N 6,08; S 13,92.

S-(1,2-Дифенилиндолил-3)диэтилдитиокарбамат (Шв). Выход 53%.  $T_{пл}$  138...139 °С. Спектр ПМР: 1,31 (3H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 1,34 (3H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 3,88 (2H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 4,07 (2H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 7,66 (1H, м,  $J_o = 8,0$ ,  $J_m = 2,5$  Гц, 4-Н); 7,20...7,40 м. д. (13H, м,  $N_{аром}$ ). Найдено, %: С 71,82; Н 5,51; N 6,48; S 15,12.  $\text{C}_{25}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{S}_2$ . Вычислено, %: С 72,07; Н 5,81; N 6,73; S 15,39.

S-(5-Бром-2-фенилиндолил-3)диэтилдитиокарбамат (Шг). Выход 60%.  $T_{пл}$  176...177 °С. Спектр ПМР: 1,34 (3H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 1,43 (3H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 3,93 (2H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 4,09 (2H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 7,68 (1H, м,  $J_m = 1,7$  Гц, 4-Н); 7,67 (1H, м,  $J_o = 8,0$  Гц, 6-Н); 7,20 (1H, м,  $J_o = 8,0$  Гц, 7-Н); 7,30...7,40 (5H,  $\text{C}_6\text{H}_5$ ); 8,81 м. д. (1H, с, NH). Найдено, %: С 53,95; Н 4,80; N 6,34; S 15,48.  $\text{C}_{19}\text{H}_{19}\text{BrN}_2\text{S}_2$ . Вычислено, %: С 54,40; Н 4,57; N 6,68; S 15,29.

S-[5-Бром-2-(*n*-бромфенил)индолил-3]диэтилдитиокарбамат (Шд). Выход 52%.  $T_{пл}$  200...201 °С. Спектр ПМР: 1,39 (3H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 1,45 (3H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 3,94 (2H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 4,14 (2H, м,  $\text{CH}_3\text{CH}_2$ ); 7,60 (1H, м,  $J_m = 1,7$  Гц, 4-Н); 7,10 (1H, м,  $J_o = 8,5$  Гц, 6-Н); 6,88 (1H, м,  $J_o = 8,5$  Гц, 7-Н); 7,36 (2H, м,  $J_o = 9,0$  Гц, 2'-Н); 7,42 (2H, м,  $J_o = 9,0$  Гц, 3'-Н); 9,22 м. д. (1H, с, NH). Найдено, %: С 46,13; Н 3,51; N 5,35; S 13,14.  $\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{Br}_2\text{N}_2\text{S}_2$ . Вычислено, %: С 45,79; Н 3,64; N 5,62; S 12,87.

S-(*n*-Бромфенацил)диэтилдитиокарбамат (Ше,  $\text{C}_{13}\text{H}_{16}\text{BrNOS}_2$ ) получен из *n*-бромфенацил-бромидом и N,N-диэтилдитиокарбамата натрия по методике [5]. Выход 68%.  $T_{пл}$  74...75 °С.

*Работа выполнена при финансовой поддержке Российского фонда фундаментальных исследований (грант 96-03-32095).*

#### СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. *Glennon R. A., Jacyno J. M., Young R., McKenney J. D., Nelson D.* // *J. Med. Chem.* — 1984. — Vol. 27. — P. 41.
2. *Kuene M. E.* // *Tetrahedron.* — 1983. — Vol. 39. — P. 3629.
3. *Бырько В. М.* Дитиокарбаматы. — М.: Наука, 1984.
4. *Robinson B.* *The Fischer Indole Synthesis.* — N. Y.: Wiley Intersci., 1982. — 923 p.
5. *Rieche A., Hilgetag G., Martin D., Kreyzi I.* // *Arch. Pharm. (Weinheim, Ger.).* — 1963. — Bd 296. — S. 310.

Н. М. Пржевальский, И. В. Магедов, В. Н. Дрозд

Московская сельскохозяйственная академия им. К. А. Тимирязева,  
Москва 127550

Поступило в редакцию 20.11.97