

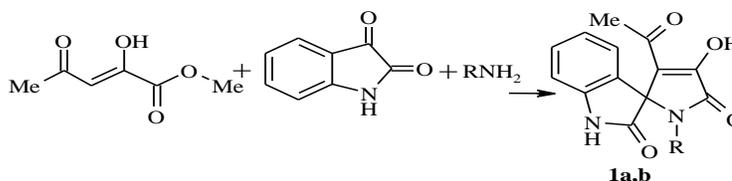
ТРЕХКОМПОНЕНТНЫЙ СИНТЕЗ 1-ЗАМЕЩЕННЫХ 4-АЦЕТИЛ-3-ГИДРОКСИСПИРО[2,5-ДИГИДРОПИРРОЛ- 5,3'-ИНДОЛ]-2,2'-ДИОНОВ

Ключевые слова: изатин, метиламин, метиловый эфир ацетилпировиноград-ной кислоты, триптамин.

Известно, что реакция эфиров ацилпировиноградных кислот со смесью ароматического альдегида и алкиламина приводит к 1-алкил-5-арил-4-ацил-3-гидрокси-3-пирролин-2-онам [1]. При замене ароматического альдегида на нингидрин образуются 4-ацетил-2,1',3'-триоксоспиро[2,5-дигидрофуран-5,2'-индан]олаты алкиламмония [2].

Нами обнаружено, что при кратковременном нагревании в диоксане эквивалентных количеств метилового эфира ацетилпировиноградной кислоты, изатина и метиламина (триптамина) образуются 1-замещенные 4-ацетил-3-гидрокси-спиро[2,5-дигидропиррол-5,3'-индол]-2,2'-дионы (**1a,b**).

Соединения **1a,b** представляют собой бесцветные вещества, растворимые в обычных органических растворителях.



1a R = Me, **b** R = 2-(индол-3-ил)этил

Спектры ЯМР ^1H получены на спектрометре Bruker DRX 500 (500 МГц) в DMSO-d_6 , внутренний стандарт ТМС. ИК спектры записаны на приборе UR-20 в вазелиновом масле, масс-спектры получены на приборе MX-1320, энергия ионизирующих электронов 70 эВ.

4-Ацетил-3-гидрокси-1-метилспиро[2,5-дигидропиррол-5,3'-индол]-2,2'-дион (1a). Смесь 1.44 г (0.01 моль) метилового эфира ацетилпировиноградной кислоты, 1.47 г (0.01 моль) изатина в 10 мл диоксана нагревают до растворения и к полученному раствору, охлажденному до комнатной температуры, добавляют 1.3 мл водного раствора метиламина. Реакционную смесь выдерживают 5–6 ч при комнатной температуре. Выпавший осадок отфильтровывают и перекристаллизовывают из этанола. Выход 1.12 г (47%). Т. пл. 302–304 °С (этанол). ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1664 (CH_3CO), 1726 ($\text{C}_2=\text{O}$), 1832 ($\text{C}_2=\text{O}$), 3144 (NH), 3456 (OH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д.: 2.26 (3H, с, CH_3); 2.45 (3H, с, CH_3N); 6.93 (2H, м, H-6' и H-4'); 7.00 (1H, д, H-7'); 7.28 (1H, д, H-5'); 10.86 (1H, с, NH); 13.05 (1H, с уш., OH). Масс-спектр, m/z (*I*, %): $[\text{M}]^+$ 272 (20). Найдено, %: С 61.62, 61.69; Н 4.39, 4.47; N 10.22, 10.31. $\text{C}_{14}\text{H}_{12}\text{N}_2\text{O}_4$. Вычислено, %: С 61.76; Н 4.44; N 10.29.

4-Ацетил-3-гидрокси-1-[2-(индол-3-ил)этил]спиро[2,5-дигидропиррол-5,3'-индол]-2,2'-дион (1b) получают аналогично. Выход 2.68 г (67%). Т. пл. 276–278 °С (этанол). ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1664 (CH_3CO), 1712 ($\text{C}_2=\text{O}$), 1840 ($\text{C}_2=\text{O}$), 3296 (NH), 3456 (OH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д.: 2.27 (3H, с, CH_3); 2.58 (1H, м, $\text{CH}_2\text{A}_\text{B}$); 2.81 (1H, м, $\text{CH}_2\text{B}_\text{A}$); 3.14 (2H, м, CH_2); 6.88–7.46 (9H, м, ArH); 10.80 (1H, с, NH); 10.99 (1H, с, NH); 13.04 (1H, с уш., OH). Найдено, %: С 61.86, 61.76; Н 4.80, 4.69; N 10.55, 10.38. $\text{C}_{23}\text{H}_{19}\text{N}_3\text{O}_4$. Вычислено, %: С 68.82; Н 4.77; N 10.47.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. В. Л. Гейн, Е. В. Шумиловских, Э. В. Воронина, Р. Ф. Сараева, Л. Ф. Гейн, Б. И. Уграк, Ю. С. Андрейчиков, *ЖОрХ*, **64**, 1203 (1994).
2. В. Л. Гейн, Л. Ф. Гейн, Е. Д. Кузнецова, З. Г. Алиев, *XГС*, 288 (2005). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **41**, 255 (2005)].

**В. Л. Гейн, Л. Ф. Гейн^a, Е. Д. Кузнецова, М. А. Шептуха,
Е. П. Цыплякова, К. Д. Потемкин**

^a*Пермская государственная медицинская академия,
Пермь 614000, Россия*

ХГС. – 2008. – № 5. – С. 786