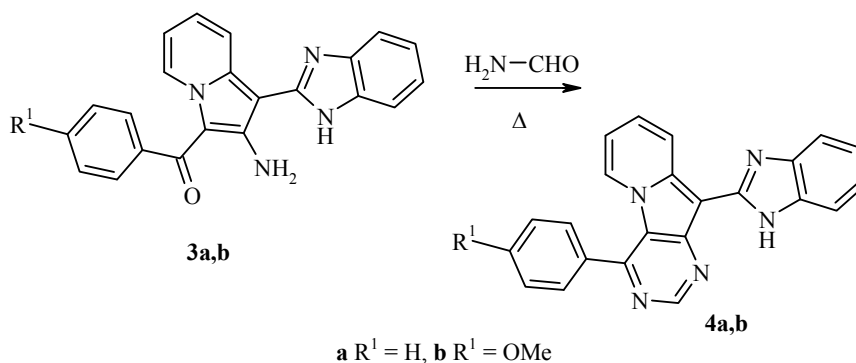
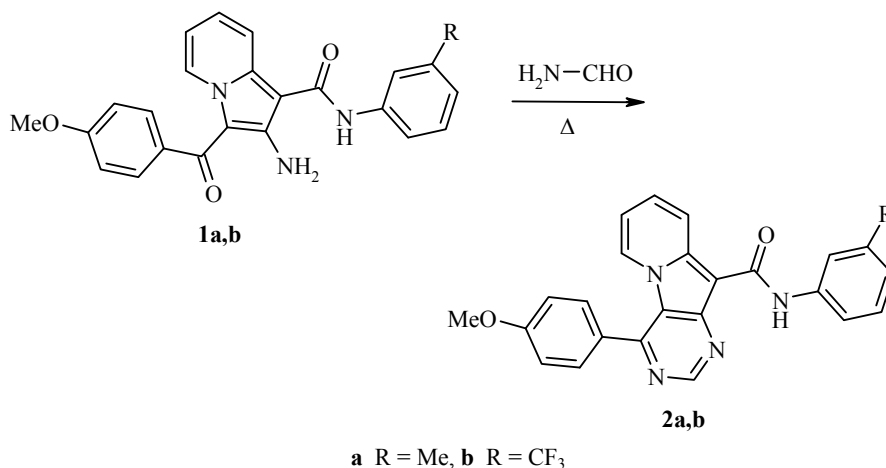


## СИНТЕЗ ПИРИМИДО[4,5-*b*]ИНДОЛИЗИНОВ ВЗАИМОДЕЙСТВИЕМ 2-АМИНО-3-АРОИЛ-1-*R*-ИНДОЛИЗИНОВ С ФОРМАМИДОМ

**Ключевые слова:** 2-амино-3-ароил-1-*R*-индолизины, пиримидо[4,5-*b*]индолизины, формамид, региоселективность.

Продолжая наши исследования в области изучения химических свойств 2-амино-3-ароил-1-*R*-индолизинов [1], мы осуществили взаимодействие индолизинов **1a,b** и **3a,b** с формамидом путём непродолжительного кипячения в формамиде. В результате были получены соответствующие пиримидо[4,5-*b*]индолизины **2a,b** и **4a,b**.



Из двух возможных направлений протекания реакции реализуется только одно – при участии amino- и карбонильной групп. Так в ИК спектрах соединений **2** и **4** исчезают сигналы amino- и карбонильной групп и проявляются сигналы, характерные для вторичной амидной группы и для группы NH имидазола [2]. В масс-спектре соединения **2a** присутствует сигнал с интенсивностью 3.1%, соответствующий его молярной массе. Сигнал с интенсивностью 100% ( $m/z$  302) соответствует

соединению **2a** с элиминированным *m*-толуидином, что характерно для подобных систем [2, 3]. На основании этих данных можно сделать вывод о том, что соединения **2a,b** образуются региоселективно.

ИК спектры снимали на спектрофотометре ИКС-40 в вазелиновом масле, спектры ЯМР  $^1\text{H}$  – на приборе Varian VRX-200 (200 МГц) в  $\text{DMSO-d}_6$ , внутренний стандарт ТМС. Масс-спектры ( $\text{ЭУ}$ , 70 эВ), получали на приборе Varian 1200L.

Индолизины **1a,b** и **3a,b** получены по известным методикам [4, 5].

**4-Фенил-10-R-пиримидо[4,5-*b*]индолизины **2a,b** и **4a,b**** (общая методика). Кипятят 2.5 ммоль соответствующего индолизина **1** или **3** в 15 мл формамида в течение 1 ч. Раствор становится гомогенным и зелено-коричневого цвета. Через 4 ч образовавшийся осадок отфильтровывают, промывают маточным раствором, затем 1 мл воды и 5 мл формамида. Перекристаллизовывают из этанола.

**4-(4-Метоксифенил)-N-(*m*-толил)пиримидо[4,5-*b*]индолизин-10-карбоксамид (**2a**)**. Выход 46%. Т. пл. 208–209 °С. ИК спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 3418, 1652, 1559. Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 11.04 (1H, с, NH); 9.21 (1H, с, H-2); 8.69 (1H, д,  $J = 9.1$ , H-9); 8.21 (1H, д,  $J = 7.1$ , H-6); 7.85–7.52 (5H, м, H аром.); 7.35–7.13 (3H, м, H аром.); 7.01 (1H, т,  $J = 6.9$ , H-7); 6.90 (1H, д,  $J = 7.1$ , H аром.); 3.89 (3H, с,  $\text{OCH}_3$ ); 2.33 (3H, с,  $\text{CH}_3$ ). Масс-спектр,  $m/z$  ( $I_{\text{отн}}$ , %): 408  $[\text{M}]^+$  (3.1), 304 (3.0), 303 (17.4), 302 (100), 287 (8.2), 259 (6.0), 258 (29.4), 257 (5.4), 233 (2.4), 232 (2.6), 231 (8.4), 230 (7.0), 205 (2.1), 204 (3.8), 203 (4.3), 202 (2.1), 107 (10.3), 106 (4.4), 104 (3.2), 91 (3.5), 80 (2.1). Найдено, %: С 73.58; Н 4.88; N 13.67.  $\text{C}_{25}\text{H}_{20}\text{N}_4\text{O}_2$ . Вычислено, %: С 73.51; Н 4.94; N 13.72.

**4-(4-Метоксифенил)-N-[3-(трифторметил)фенил]пиримидо[4,5-*b*]индолизин-10-карбоксамид (**2b**)**. Выход 59%. Т. пл. 206–207.5 °С. ИК спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 3436, 1653, 1559. Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 11.25 (1H, с, NH); 9.14 (1H, с, H-2); 8.78 (1H, д,  $J = 9.0$ , H-9); 8.44 (1H, д,  $J = 7.1$ , H-6); 8.29 (1H, с, H аром.); 7.91 (1H, д,  $J = 9.0$ , H аром.); 7.74–7.60 (3H, м, H аром.); 7.54 (1H, т,  $J = 7.6$ , H-8); 7.34 (1H, д,  $J = 8.1$ , H аром.); 7.17 (2H, д,  $J = 8.7$ , H аром.); 6.94 (1H, т,  $J = 6.4$ , H-7); 3.94 (3H, с,  $\text{OCH}_3$ ). Найдено, %: С 64.87; Н 3.76; N 12.17.  $\text{C}_{25}\text{H}_{17}\text{N}_4\text{F}_3\text{O}_2$ . Вычислено, %: С 64.93; Н 3.71; N 12.12.

**10-(1H-Бензоимдазол-2-ил)-4-фенилпиримидо[4,5-*b*]индолизин (**4a**)**. Выход 68%. Т. пл. 224 °С. ИК спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 3488. Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 12.30 (1H, с, NH); 9.23 (1H, с, H-2); 9.13 (1H, д,  $J = 9.2$ , H-9); 8.21 (1H, д,  $J = 6.9$ , H-6); 7.77–7.58 (8H, м, H аром.); 7.16–7.12 (2H, м, H аром.); 6.82 (1H, т,  $J = 6.9$ , H-7). Найдено, %: С 76.51; Н 4.09; N 19.43.  $\text{C}_{23}\text{H}_{15}\text{N}_5$ . Вычислено, %: С 76.44; Н 4.18; N 19.38.

**10-(1H-Бензоимдазол-2-ил)-4-(4-метоксифенил)пиримидо[4,5-*b*]индолизин (**4b**)**. Выход 83%. Т. пл. 258–260 °С. ИК спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 3446. Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 12.32 (1H, с, NH); 9.26 (1H, с, H-2); 9.04 (1H, д,  $J = 10.0$ , H-9); 8.36 (1H, д,  $J = 8.0$ , H-6); 7.97–7.52 (7H, м, H аром.); 7.20–7.14 (2H, м, H аром.); 7.03 (1H, т,  $J = 8.0$ , H-7); 3.90 (3H, с,  $\text{OCH}_3$ ). Найдено, %: С 73.70; Н 4.31; N 17.95.  $\text{C}_{24}\text{H}_{17}\text{N}_5\text{O}$ . Вычислено, %: С 73.64; Н 4.38; N 17.89.

## СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Г. Е. Хорошилов, И. В. Демчак, М. В. Емельянова, *XTC*, 133 (2007). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **43**, 116 (2007)].
2. H. Becker, W. Berger, G. Domschke, E. Fanghänel, W. D. Habicher, P. Metz, D. Pavel, K. Schwetlick, *Organikum*, Wiley-VCH, Weinheim, 2001.
3. R. M. Silverstein, F. X. Webster, D. J. Kiemle, *Spectrometric Identification of Organic Compounds*, John Wiley & Sons, Inc. (2005).

4. Г. Е. Хорошилов, И. В. Демчак, *Вісник ХНУ, Хімія*, **770**, вип. 15 (38), 210 (2007).
5. Г. Е. Хорошилов, Т. А. Сараева, К. Ю. Кузнецов, *ХГС*, 1109 (2008). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **44**, 895 (2008)].

**Г. Е. Хорошилов, И. В. Демчак\*, Т. А. Сараева**

*Луганский национальный университет  
им. Тараса Шевченко,  
ул. Оборонная, 2, Луганск 91011, Украина  
e-mail: demchak@mail.ru*

*Поступило 07.10.2010*