

Н. М. Пржевальский, Н. С. Скворцова, И. В. Магедов

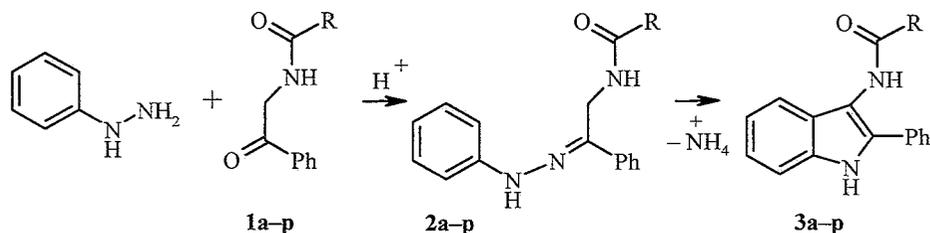
## СИНТЕЗ 3-(N-АЦИЛАМИНО)-2-ФЕНИЛИНДОЛОВ ПО ФИШЕРУ

Взаимодействием фенилгидразина с  $\omega$ -(N-ациламино)ацетофенонами получены фенилгидразоны, которые циклизацией по Фишеру превращены в 3-(N-ациламино)-2-фенилиндолы.

**Ключевые слова:** 3-(N-ациламино)индолы, фенилгидразин, фенилгидразоны.

Синтез производных индола, в том числе аминоиндолы, остается актуальной проблемой в связи с их разнообразной биологической активностью [1, 2]. 3-Аминоиндолы получают гидролизом изоцианатов [3] или восстановлением солей изонитрозоиндолы [4]. Известна лишь одна работа, в которой описан синтез 3-(N-ациламино)индола по Фишеру [5].

Ранее мы сообщили о синтезе новых производных индола, содержащих в положении 3 диэтилдитиокарбаматную [6] и ксантогенатную [7] группы. В данной работе мы предлагаем удобный одностадийный метод синтеза 3-(N-ациламино)-2-фенилиндолов циклизацией по Фишеру фенилгидразонов  $\omega$ -(N-ациламино)ацетофенонов (см. [8]).



1–3 а R = C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>Br-4, б R = C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>Cl-4, с R = Ph, д R = C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>Ph-4, е R = 5-метил-3-(2-хлорфенил)-4-изоксазолил, ф R = 2-оксо-2H-хромен-3-ил, г R = CH<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>Cl-4, б R = CH<sub>2</sub>OC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>Cl-4, и R = (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>OPh, j R = (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>11</sub>, k R = (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>OMe-4, l R = 1-адамантил, m R = CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>Ph, n R = CH<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>3</sub>(OMe)<sub>2</sub>-3,4, о R = CH=C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>Cl-4, р R = 5-метил-3-(2-хлор-6-фторфенил)-4-изоксазолил

N-Ациламиноацетофенолы (1) синтезированы из  $\omega$ -аминоацетофена и хлорангидридов соответствующих кислот в присутствии оснований. Характеристики соединений 1а–р приведены в табл. 1 и 2.

Кипячение смеси эквимолярных количеств кетонов **1** и фенилгидразина в этаноле в присутствии каталитических количеств АсОН приводит к фенилгидразонам **2**, которые в ряде случаев были выделены (см. экспериментальную часть) и далее превращены в индолы **3** нагреванием в этаноле с двукратным молярным количеством тионилхлорида. В остальных примерах гидразоны **2** без выделения в тех же условиях перегруппированы в аминокиндолы **3** (табл. 1).

При взаимодействии фенилгидразина с кетонами **1** и тионилхлоридом (кипячение в этаноле) также образуются индолы **3**, но с меньшим выходом (см. **3з,е,п,о**, табл. 1). Строение индолов **3а-р** доказано методом ЯМР  $^1\text{H}$  (см. табл. 3). Мы не встретили принципиальных затруднений при циклизации гидразонов **2** с такими заместителями R, как арил, гетарил, алкил, циклоалкил, алкокси, алкилтио, алкенил, поэтому предлагаемый метод синтеза 3-(N-ациламино)-2-фенилиндолов представляется достаточно общим. В настоящее время мы изучаем влияние заместителей в бензольном ядре и при атоме азота фенилгидразина на перегруппировку гидразонов **2**.

### ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

Спектры ЯМР  $^1\text{H}$  соединений **1-3** записаны на приборе Bruker WM-250 (250 МГц) в  $\text{CD}_3\text{CN}$ . Контроль за ходом реакций осуществляли методом ТСХ на пластинках Silufol в системе  $\text{CCl}_4\text{-EtOAc}$ , 4:1.

**Синтез  $\omega$ -(N-ациламино)ацетофенонов (**1**) (общая методика).** К раствору 1 моль гидрохлорида  $\omega$ -аминоацетофенона в соответствующем растворителе добавляют основание [методы: А.  $\text{H}_2\text{O}$ , ацетат натрия (1.1 моль); Б. хлористый метилен, триэтиламин (2.5 моль); В.  $\text{H}_2\text{O}$ ,  $\text{Na}_2\text{CO}_3$  (3 моль); Г.  $\text{CHCl}_3$ , пиридин (4 моль)], при температуре 0 °С и перемешивании добавляют по каплям 1.05 моль хлорангидрида кислоты. После окончания добавления основания перемешивают еще 4 ч. А. В. Выпавший осадок отфильтровывают, промывают водой и перекристаллизовывают. Б. Г. Органический растворитель промывают водой, разбавленной  $\text{HCl}$  (метод Г), упаривают, полученный продукт перекристаллизовывают.

**Общая методика получения гидразонов **2**.** К раствору 5.4 г (0.05 моль) фенилгидразина и 0.05 моль кетона **1** в минимальном объеме  $\text{EtOH}$  (5–10 мл) добавляют несколько капель ледяной АсОН и кипятят смесь с обратным холодильником 2 ч. Спирт упаривают, оставшееся масло кристаллизуют, либо без дальнейшей очистки перегруппировывают в аминокиндолы **3**.

**N-(2-Фенилгидразино-2-фенилэтил)бензамид (**2с**),** выход 62%. Т. пл. 174–175 °С ( $\text{EtOH}$ ). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м. д.,  $J$  (Гц): 10.22 (1H, с, NH–N=C); 7.96–6.87 (15H, м, CH аром.); 7.76 (1H, уш. с, NH); 4.68 (2H, д,  $J = 6.6$ ,  $\text{CH}_2$ ). Найдено, %: С 76.71; Н 5.84; N 12.75.  $\text{C}_{21}\text{H}_{19}\text{N}_3\text{O}$ . Вычислено, %: С 76.59; Н 5.77; N 12.76.

**N-(2-Фенилгидразино-2-фенилэтил)-5-метил-3-(2-хлорфенил)-4-изоксазолкарбоксамид (**2е**),** выход 49%. Т. пл. 194–195 °С ( $\text{EtOH}$ ). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м. д.,  $J$  (Гц): 9.80 (1H, с, NH–N=C); 7.73–6.88 (14H, м, CH аром.); 6.83 (1H, уш. с, NH); 4.46 (2H, д,  $J = 7.0$ ,  $\text{CH}_2$ ); 2.67 (3H, с,  $\text{CH}_3$ ). Найдено, %: С 67.37; Н 4.64; N 12.75.  $\text{C}_{25}\text{H}_{21}\text{ClN}_4\text{O}_2$ . Вычислено, %: С 67.49; Н 4.72; N 12.59.

**N-(2-Фенилгидразино-2-фенилэтил)-2-(3,4-диметоксифенил)ацетамид (**2п**),** выход 70%. Т. пл. 160–161 °С ( $\text{EtOH}$ ). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м. д.,  $J$  (Гц): 9.91 (1H, с, NH–N=C); 7.82–6.78 (13H, м, CH аром.); 7.25 (1H, уш. с, NH); 4.40 (2H, д,  $J = 9.0$ ,  $\text{CH}_2$ ); 3.72 (3H, с,  $\text{OCH}_3$ ); 3.65 (3H, с,  $\text{OCH}_3$ ); 3.45 (2H, с,  $\text{CH}_2$ ). Найдено, %: С 71.37; Н 6.18; N 10.35.  $\text{C}_{24}\text{H}_{25}\text{N}_3\text{O}_3$ . Вычислено, %: С 71.44; Н 6.25; N 10.41.

**N-(2-Фенилгидразино-2-фенилэтил)-3-(4-хлорфенил)-2-пропенамид (**2о**),** выход 70%. Т. пл. 184–185 °С ( $\text{EtOH}$ ). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м. д.,  $J$  (Гц): 10.20 (1H, с, NH–N=C); 7.87–6.84 (14H, м, CH аром.); 7.59 (1H, д,  $J = 10.6$ ,  $\text{CH}=\text{C}$ ); 6.54 (1H, д,  $J = 10.6$ ,  $\text{CH}=\text{C}$ ); 7.4 (1H, уш. с, NH); 4.52 (2H, д,  $J = 6.00$ ,  $\text{CH}_2$ ). Найдено, %: С 70.99; Н 5.26; N 10.65.  $\text{C}_{23}\text{H}_{20}\text{ClN}_3\text{O}$ . Вычислено, %: С 70.86; Н 5.17; N 10.78.

## Характеристики соединений 1 и 3

Соединение	Название	Брутто-формула	Найдено, % Вычислено, %			Т. пл., °С	Выход, % (метод)
			С	Н	N		
1a	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-4-бромбензамид	C <sub>15</sub> H <sub>12</sub> BrNO <sub>2</sub>	<u>56.47</u>	<u>3.72</u>	<u>4.12</u>	159–160 ( <i>i</i> -PrOH водн.)	48 (А)
			56.63	3.80	4.40		
1b	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-4-хлорбензамид	C <sub>15</sub> H <sub>12</sub> ClNO <sub>2</sub>	<u>65.72</u>	<u>4.29</u>	<u>5.42</u>	163–164 ( <i>i</i> -PrOH водн.)	42 (А)
			65.82	4.42	5.12		
1c	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)бензамид	C <sub>15</sub> H <sub>13</sub> NO <sub>2</sub>	<u>75.43</u>	<u>5.42</u>	<u>5.42</u>	130–131 ( <i>i</i> -PrOH водн.)	84 (В)
			75.30	5.48	5.85		
1d	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-4-фенилбензамид	C <sub>21</sub> H <sub>17</sub> NO <sub>2</sub>	<u>80.13</u>	<u>5.37</u>	<u>4.33</u>	100–101 ( <i>i</i> -PrOH водн.)	72 (Б)
			79.98	5.43	4.44		
1e	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-5-метил-3-(2-хлорфенил)-4-изоксазолкарбоксамид	C <sub>19</sub> H <sub>15</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	<u>64.60</u>	<u>4.33</u>	<u>7.89</u>	78–79 ( <i>i</i> -PrOH водн.)	60 (Б)
			64.32	4.26	7.90		
1f	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-2-оксо-2Н-3-хроменокарбоксамид	C <sub>18</sub> H <sub>13</sub> NO <sub>4</sub>	<u>70.14</u>	<u>4.14</u>	<u>4.44</u>	207–208 (CH <sub>3</sub> CN)	64 (Г)
			70.35	4.26	4.56		
1g	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-2-(4-хлорфенил)ацетамид	C <sub>16</sub> H <sub>14</sub> ClNO <sub>2</sub>	<u>66.60</u>	<u>5.07</u>	<u>4.81</u>	210–211 ( <i>i</i> -PrOH водн.)	33 (А)
			66.79	4.90	4.87		
1h	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-2-(4-хлорфенокси)ацетамид	C <sub>16</sub> H <sub>14</sub> ClNO <sub>3</sub>	<u>63.50</u>	<u>4.71</u>	<u>4.82</u>	155–156 ( <i>i</i> -PrOH)	34 (Г)
			63.27	4.65	4.61		
1i	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-4-феноксипропанамид	C <sub>18</sub> H <sub>19</sub> NO <sub>3</sub>	<u>72.84</u>	<u>6.49</u>	<u>4.67</u>	109–110 (толуол)	16 (Б)
			72.71	6.44	4.71		
1j	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-3-циклогексилпропанамид	C <sub>17</sub> H <sub>23</sub> NO <sub>2</sub>	<u>74.53</u>	<u>8.44</u>	<u>5.20</u>	115–116 ( <i>i</i> -PrOH)	75 (Г)
			74.69	8.48	5.12		
1k	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-3-(4-метоксифенил)пропанамид	C <sub>18</sub> H <sub>19</sub> NO <sub>3</sub>	<u>72.82</u>	<u>6.49</u>	<u>4.89</u>	118–119 ( <i>i</i> -PrOH)	62 (Г)
			72.71	6.44	4.71		
1l	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-1-адамантанкарбоксамид	C <sub>19</sub> H <sub>23</sub> NO <sub>2</sub>	<u>76.61</u>	<u>7.87</u>	<u>4.77</u>	158–159 ( <i>i</i> -PrOH)	51 (Г)
			76.74	7.80	4.71		
1m	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-2-(бензилтио)ацетамид	C <sub>17</sub> H <sub>17</sub> NO <sub>2</sub> S	<u>68.36</u>	<u>5.64</u>	<u>4.85</u>	90–91 ( <i>i</i> -PrOH)	38 (Г)
			68.20	5.72	4.68		
1n	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-2-(3,4-диметоксифенил)ацетамид	C <sub>18</sub> H <sub>19</sub> NO <sub>4</sub>	<u>69.14</u>	<u>6.02</u>	<u>4.39</u>	92–93 ( <i>i</i> -PrOH)	56 (Г)
			69.00	6.11	4.47		
1o	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-3-(4-хлорфенил)-2-пропанамид	C <sub>17</sub> H <sub>14</sub> ClNO <sub>2</sub>	<u>68.27</u>	<u>4.62</u>	<u>4.59</u>	205–206 ( <i>i</i> -PrOH водн.)	61 (Г)
			68.12	4.71	4.67		

1p	N-(2-Оксо-2-фенилэтил)-5-метил-3-(6-фтор-2-хлор-фенил)-4-изоксазолкарбоксамид	C <sub>19</sub> H <sub>14</sub> ClFN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	<u>61.39</u> 61.22	<u>3.74</u> 3.79	<u>7.47</u> 7.51	72–73 ( <i>i</i> -PrOH водн.)	56 (Г)
3a	3-(4-Бромбензоиламино)-2-фенил-1H-индол	C <sub>21</sub> H <sub>15</sub> BrN <sub>2</sub> O	<u>64.33</u> 64.47	<u>3.95</u> 3.86	<u>7.01</u> 7.16	194–195 ( <i>i</i> -PrOH)	42
3b	3-(4-Хлорбензоиламино)-2-фенил-1H-индол	C <sub>21</sub> H <sub>15</sub> ClN <sub>2</sub> O	<u>72.79</u> 72.73	<u>4.45</u> 4.36	<u>8.21</u> 8.08	210–211 ( <i>i</i> -PrOH)	33
3c	3-Бензоиламино-2-фенил-1H-индол	C <sub>21</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O	<u>80.64</u> 80.75	<u>5.21</u> 5.16	<u>8.88</u> 8.97	198–199 ( <i>i</i> -PrOH)	62 52*
3d	3-(4-Фенилбензоиламино)-2-фенил-1H-индол	C <sub>27</sub> H <sub>20</sub> N <sub>2</sub> O	<u>83.64</u> 83.48	<u>5.27</u> 5.19	<u>7.15</u> 7.21	132–133 ( <i>i</i> -PrOH)	11
3e	N-(2-Фенил-1H-3-индолил)-5-метил-3-(2-хлорфенил)-4-изоксазолкарбоксамид	C <sub>25</sub> H <sub>18</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	<u>70.00</u> 70.18	<u>4.15</u> 4.24	<u>9.96</u> 9.82	228–229 ( <i>i</i> -PrOH)	62 41*
3f	N-(2-Фенил-1H-3-индолил)-2-оксо-2H-3-хроменокарбоксамид	C <sub>24</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	<u>75.90</u> 75.78	<u>4.32</u> 4.24	<u>7.50</u> 7.36	258–259 (CH <sub>3</sub> CN)	83 65*
3g	3-(4-Хлорфенилацетиламино)-2-фенил-1H-индол	C <sub>22</sub> H <sub>17</sub> ClN <sub>2</sub> O	<u>73.14</u> 73.23	<u>4.80</u> 4.75	<u>7.84</u> 7.76	210–211 ( <i>i</i> -PrOH)	35
3h	3-(4-Хлорфеноксиацетиламино)-2-фенил-1H-индол	C <sub>22</sub> H <sub>17</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	<u>70.25</u> 70.12	<u>4.62</u> 4.55	<u>7.29</u> 7.43	240–241 ( <i>i</i> -PrOH)	11
3i	3-(Феноксипропилкарбониламино)-2-фенил-1H-индол	C <sub>24</sub> H <sub>22</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	<u>77.93</u> 77.81	<u>5.94</u> 5.99	<u>7.76</u> 7.56	66–67 ( <i>i</i> -PrOH)	20
3j	3-(Циклогексилэтилкарбониламино)-2-фенил-1H-индол	C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> N <sub>2</sub> O	<u>79.54</u> 79.73	<u>7.61</u> 7.56	<u>8.13</u> 8.09	120–121 ( <i>i</i> -PrOH)	28
3k	3-(4-Метоксифенилэтилкарбониламино)-2-фенил-1H-индол	C <sub>24</sub> H <sub>22</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	<u>77.93</u> 77.81	<u>5.90</u> 5.99	<u>7.37</u> 7.56	157–158 ( <i>i</i> -PrOH)	30
3l	3-(1-Адамантилкарбониламино)-2-фенил-1H-индол	C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> N <sub>2</sub> O	<u>81.17</u> 81.05	<u>7.00</u> 7.07	<u>7.60</u> 7.56	307–308 (AcOH)	31
3m	3-(Бензилтиоацетиламино)-2-фенил-1H-индол	C <sub>23</sub> H <sub>20</sub> N <sub>2</sub> OS	<u>74.09</u> 74.16	<u>5.37</u> 5.41	<u>4.34</u> 7.52	157–158 (AcOH)	44
3n	3-(3,4-Диметоксифенилацетиламино)-2-фенил-1H-индол	C <sub>24</sub> H <sub>22</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	<u>74.72</u> 74.59	<u>5.81</u> 5.74	<u>7.39</u> 7.25	93–94 ( <i>i</i> -PrOH)	49 32*
3o	3-(4-Хлорфенилэтилкарбониламино)-2-фенил-1H-индол	C <sub>23</sub> H <sub>17</sub> ClN <sub>2</sub> O	<u>74.18</u> 74.09	<u>4.62</u> 4.60	<u>7.47</u> 7.51	120–121 ( <i>i</i> -PrOH)	28 15*
3p	N-(2-Фенил-1H-3-индолил)-5-метил-3-(6-фтор-2-хлорфенил)-4-изоксазолкарбоксамид	C <sub>25</sub> H <sub>17</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	<u>67.26</u> 67.34	<u>3.75</u> 3.84	<u>9.56</u> 9.42	198–199 ( <i>i</i> -PrOH)	18

\* Выход, полученный, минуя стадию образования гидразона.

Спектры ЯМР  $^1\text{H}$  соединений 1

Соединение	Химические сдвиги, $\delta$ , м. д., (КССВ, $J$ , Гц)				
	Фенил- $o$ -H, м, $m$ -H, м, $p$ -H, м	$\text{CH}_2$ , д	NH, уп. с	R	
				$\text{CH}_3$ , $\text{CH}_2$ , $\text{CH}=\text{}$	Фенил или гетарил
1a	8.06; 7.68; 7.73	4.89 ( $J=4.6$ )	7.48	—	7.99 (2H, д, $J=12.0$ , H-2, H-6); 7.87 (2H, д, $J=12.0$ , H-3, H-5)
1b	8.06; 7.58; 7.70	4.86 ( $J=4.6$ )	7.43	—	7.87 (2H, д, $J=9.0$ , H-2, H-6); 7.54 (2H, д, $J=9.0$ , H-3, H-5)
1c	7.89; 7.52; 7.52	4.87 ( $J=5.5$ )	7.43	—	8.07 (2H, д, $J=8.5$ , H-2, H-6); 7.70 (1H, т, $J=14.5$ , H-4); 7.58 (2H, т, $J=14.5$ , H-3, H-5)
1d	8.06; 7.66; 7.79	4.82 ( $J=5.0$ )	7.76	—	7.76 (2H, т, $J=8.0$ , H-3, H-5); 7.60 (2H, т, $J=8.0$ , H-2, H-6); 7.33 (2H, т, $J=8.0$ , H-2', H-6'); 7.27 (2H, т, $J=8.0$ , H-3', H-5'); 7.20 (1H, т, $J=6.5$ , H-4')
1e	7.95; 7.67; 7.67	4.72 ( $J=6.5$ )	6.59	2.76 (3H, с, $\text{CH}_3$ )	7.60–7.50 (4H, м, CH аром.)
1f	8.03; 7.57; 7.69	4.95 ( $J=6.5$ )	9.30	—	8.05 (1H, с, H-4); 8.03 (1H, м, H-5); 7.78 (1H, т, $J=16.5$ , H-7); 7.53 (1H, м, H-8); 7.45 (1H, т, $J=16.5$ , H-6)
1g	7.99; 7.54; 7.67	4.66 ( $J=6.0$ )	6.82	3.62 (2H, с, $\text{CH}_2$ )	7.38 (2H, д, $J=6.0$ , H-2, H-6); 7.35 (2H, д, $J=6.0$ , H-3, H-5)
1h	8.00; 7.53; 7.67	4.74 ( $J=7.5$ )	7.44	4.56 (2H, с, $\text{CH}_2$ )	7.34 (2H, д, $J=12.0$ , H-3, H-5); 7.01 (2H, д, $J=12.0$ , H-2, H-6)
1i	8.02; 7.55; 7.67	4.69 ( $J=5.5$ )	6.86	4.05 (2H, т, $J=14.0$ , $\text{OCH}_2$ ); 2.46 (2H, т, $J=14.0$ , $\text{CH}_2$ ); 2.07 (2H, м, $\text{CH}_2$ )	7.31 (2H, т, $J=16.5$ , H-3, H-5); 6.95 (3H, м, H-2, H-4, H-6)
1j	7.98; 7.52; 7.64	4.62 ( $J=5.5$ )	6.74	2.22 (2H, м, $\text{CH}_2$ ); 1.71–0.92 (11H, м, циклогексил) 1.47 (2H, м, $\text{CH}_2$ )	—
1k	7.98; 7.52; 7.65	4.64 ( $J=4.5$ )	6.76	3.75 (3H, с, $\text{OCH}_3$ ); 2.85 (2H, т, $J=17.0$ , $\text{CH}_2$ ); 2.51 (2H, т, $J=17.0$ , $\text{CH}_2$ )	7.16 (2H, д, $J=8.5$ , H-2, H-6); 6.83 (2H, д, $J=8.5$ , H-3, H-5)
1l	7.98; 7.52; 7.65	4.60 ( $J=4.5$ )	6.65	2.02–1.75 (15H, м, адамантил)	—
1m	8.00; 7.54; 7.67	4.66 ( $J=5.5$ )	7.30	3.86 (2H, с, $\text{CH}_2$ ); 3.15 (2H, с, $\text{CH}_2$ )	7.30–7.20 (5H, м, CH аром.)
1n	7.96; 7.51; 7.64	4.63 ( $J=6.5$ )	6.74	3.81 (3H, с, $\text{OCH}_3$ ); 3.79 (3H, с, $\text{OCH}_3$ ); 3.51 (2H, с, $\text{CH}_2$ )	6.94 (1H, м, H-2); 6.90 (1H, м, H-5); 6.85 (1H, м, H-6)
1o	8.01; 7.53; 7.66	4.79 ( $J=5.0$ )	7.04	7.57 (1H, д, $J=14.0$ , $\text{CH}=\text{}$ ); 6.76 (1H, д, $J=14.0$ , $\text{CH}=\text{}$ )	7.59 (2H, д, $J=8.3$ , H-2, H-6); 7.41 (2H, д, $J=8.3$ , H-3, H-5)
1p	7.95; 7.67; 7.67	4.67 ( $J=6.5$ )	6.52	2.56 (3H, с, $\text{CH}_3$ )	7.30–7.20 (3H, м, CH аром.)

Спектры ЯМР  $^1\text{H}$  соединений 3

Соединение	Химические сдвиги, $\delta$ , м. д. (KCCB, J, Гц)					
	Индольный цикл, H-4, м, H-5, м, H-6, м, H-7, м	$N_{\text{инд}}\text{H}$ , уш. с	NH, уш. с	2-Фенил, o-H, м, m-H, м, p-H, м	-R	
					CH <sub>3</sub> , CH <sub>2</sub> , CH=	Фенил или гетарил
<b>3a</b>	7.40-7.50; 7.12; 7.24; 7.40-7.50	8.50	9.58	7.69; 7.35; 7.20	-	7.87 (2H, д, J=9.3, H-2, H-6); 7.72 (2H, д, J=9.3, H-3, H-5)
<b>3b</b>	7.40-7.50; 7.12; 7.24; 7.40-7.50	8.58	9.63	7.77; 7.47; 7.36	-	7.99 (2H, д, J=9.3, H-2, H-6); 7.57 (2H, д, J=9.3, H-3, H-5)
<b>3c</b>	7.40-7.50; 7.10; 7.21; 7.40-7.50	8.51	9.65	7.76; 7.45; 7.35	-	7.98 (2H, д, J=8.0, H-2, H-6); 7.40-7.50 (3H, м, H-3, H-4, H-5)
<b>3d</b>	7.40-7.50; 7.10; 7.22; 7.40-7.50	8.54	9.64	7.70-7.50; 7.70-7.50; 7.36	-	8.07 (2H, д, J=9.6, H-2, H-6); 7.81 (2H, д, J=9.6, H-3, H-5); 7.70-7.50 (5H, м, CH аром.)
<b>3e</b>	7.38; 7.11; 7.21; 7.43	7.71	9.63	7.60-7.40	2.75 (3H, с, CH <sub>3</sub> )	7.60-7.40 (4H, м, CH аром.)
<b>3f</b>	7.50-7.40; 7.11; 7.23; 7.50-7.40	9.62	10.28	7.78; 7.47; 7.36	-	8.96 (1H, с, H-4); 7.87 (1H, м, H-5); 7.75 (1H, м, H-7); 7.47 (2H, м, H-6, H-8)
<b>3g</b>	7.45-7.40; 7.10; 7.21; 7.45-7.40	8.00	9.61	7.62; 7.45-7.40; 7.45-7.40	3.74 (2H, с, CH <sub>2</sub> )	7.35 (4H, м, CH аром.)
<b>3h</b>	7.45-7.40; 7.09; 7.20; 7.45-7.40	8.42	9.59	7.67; 7.50-7.40; 7.50-7.40	4.74 (2H, с, CH <sub>2</sub> )	7.36 (2H, м, H-3, H-5); 7.06 (2H, м, H-2, H-6)
<b>3i</b>	7.40; 7.06; 7.18; 7.30	7.89	9.55	7.98; 7.70; 6.69	4.07 (2H, т, J=14.0, OCH <sub>2</sub> ); 2.61 (2H, т, J=14.0, CH <sub>2</sub> ); 2.05 (2H, м, CH <sub>2</sub> )	7.30 (2H, м, H-3, H-5); 6.97 (3H, м, H-2, H-4, H-6)
<b>3j</b>	7.40-7.30; 7.08; 7.18; 7.40-7.30	7.80	9.55	7.72; 7.43; 7.43	2.42 (2H, м, CH <sub>2</sub> ); 1.76-0.96 (11H, м, циклогексил); 1.61 (2H, м, CH <sub>2</sub> )	-
<b>3k</b>	7.50-7.40; 7.16; 7.05; 7.50-7.40	7.73	9.47	7.66; 7.50-7.40; 7.50-7.40	3.79 (3H, с, OCH <sub>3</sub> ); 2.98 (2H, т, J=17.7, CH <sub>2</sub> ); 2.86 (2H, т, J=17.7, CH <sub>2</sub> )	7.23 (2H, м, H-2, H-6); 6.89 (2H, м, H-3, H-5)
<b>3l</b>	7.33; 7.07; 7.18; 7.42	9.59	12.07	7.70; 7.48; 7.38	2.08-1.79 (15H, м, адамантил)	-
<b>3m</b>	7.36; 7.10; 7.20; 7.45	8.20	9.60	7.76; 7.48-7.30; 7.48-7.30	3.90 (2H, с, CH <sub>2</sub> ); 3.31 (2H, с, CH <sub>2</sub> )	7.45-7.35 (5H, м, CH аром.)
<b>3n</b>	7.40; 7.07; 7.18; 7.40	7.71	9.40	7.61; 7.40; 7.40	3.83 (3H, с, OCH <sub>3</sub> ); 3.81 (3H, с, OCH <sub>3</sub> ); 3.67 (2H, с, CH <sub>2</sub> )	7.02 (1H, м, H-2); 6.96 (2H, м, H-5, H-6)
<b>3o</b>	7.43; 7.09; 7.20; 7.35	8.05	9.65	7.70-7.40	7.64 (1H, д, J=7.6, CH=); 6.85 (1H, д, J=7.6, CH=)	7.70-7.40 (4H, м, CH аром.)
<b>3p</b>	7.38; 7.11; 7.21; 7.43	7.71	9.63	7.60-7.40	2.58 (3H, с, CH <sub>3</sub> )	7.20-7.10 (3H, м, CH аром.)

**Общая методика получения индолов 3 из гидразонов 2.** К раствору 0.02 моль гидразона 2 в 10–20 мл EtOH добавляют раствор 4.8 г (0.04 моль) тионилхлорида в 10 мл EtOH и смесь кипятят с обратным холодильником 3–4 ч. Спирт упаривают, остаток кристаллизуют, либо выделяют индол 3 колоночной хроматографией (силикагель L 100 × 250 мкм, элюент CCl<sub>4</sub>–EtOAc, 4:1).

**Общая методика получения индолов 3 из фенилгидразина и кетонов 1.** К раствору 1.4 г (0.013 моль) фенилгидразина и 0.01 моль кетона 1 в 10 мл EtOH добавляют раствор 2.4 г (0.02 моль) тионилхлорида в 10 мл EtOH и кипятят смесь с обратным холодильником в течение 4–5 ч. Спирт отгоняют, индол выделяют колоночной хроматографией (условия те же, что при получении индолов из гидразонов).

## СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. H. Dopp, D. Dopp, U. Langer, B. Gerding, in *Houben-Weyl. Methoden der Organischen Chemie*, Ed. R. P. Kreher, Thieme Verlag, Stuttgart, 1994, E6b<sub>1</sub>/E6b<sub>2</sub>, 546.
2. S. Radl, P. Hezky, J. Urbankova, P. Vachal, I. Krejčí, *Collect. Czech. Chem. Commun.*, **65**, 280 (2000).
3. Н. Н. Суворов, В. С. Вележева, А. В. Ярош, Ю. В. Ерофеев, Т. Н. Козик, *ХТС*, 1099 (1975).
4. А. В. Ярош, В. С. Вележева, Т. А. Козик, Н. Н. Суворов, *ХТС*, 481 (1977).
5. R. Robinson, S. Thornby, *J. Chem. Soc.*, 3144 (1926).
6. Н. М. Пржевальский, И. В. Магедов, В. Н. Дрозд, *ХТС*, 1700 (1997).
7. Н. М. Пржевальский, И. В. Магедов, в кн. *Азотсодержащие гетероциклы: синтез, свойства, применение*. Тез. Всероссийской конф., АГПУ, Астрахань, 2000, 137.
8. Н. М. Пржевальский, И. В. Магедов, *Тез. I Всероссийской конф. по химии гетероциклов*, Суздаль, 2000, 519.

Московская сельскохозяйственная академия  
им. К. А. Тимирязева, Москва 127550, Россия  
e-mail: [ibs@ibisc.msk.ru](mailto:ibs@ibisc.msk.ru)

Поступило в редакцию 19.07.2001