

**ЦИКЛИЗАЦИЯ ЭТИЛТРИФТОРПИРУВАТА
С ЦИКЛОГЕКСАНОНОМ И АМИНАМИ
В СИНТЕЗЕ ГЕКСАГИДРОИНДОЛ-2-ОНОВ**

Майорова Д.А.^(1,2), Горяева М.В.⁽²⁾, Бургарт Я.В.⁽²⁾, Салютин В.И.⁽²⁾

⁽¹⁾ Уральский федеральный университет

620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

⁽²⁾ Институт органического синтеза УрО РАН

620066, г. Екатеринбург, ул. Софьи Ковалевской, д. 22

Разработка новой стратегии к синтезу индолов является актуальной задачей, так как этот гетероциклический каркас служит основой для разнообразных природных биоактивных соединений (триптофан, серотонин, мелатонин), растительных алкалоидов (гармин, стрихнин, резерпин) и синтетических лекарственных препаратов (ризатриптан, флувастанин, сунитиниб). В докладе обсуждается синтез гексагидроиндол-2-онов на основе трехкомпонентной реакции этилтрифторпирувата с циклогексаноном и моно- / диаминами в условиях двойного кислотного катализа (уксусная кислота и триэтиламин). Установлено, что циклизация с моноаминами и аминокислотами протекает схожим образом, давая *N*-замещенные 3-гидрокси-3-(трифторметил)-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2*H*-индол-2-оны в виде одного диастереомера. Взаимодействие 1,2- и 1,3-диамина с двукратным избытком пирувата и циклогексанона дает *бис*-индолы - 1,1'-((этан/пропан)-1,3-диил)бис(3-гидрокси-3-(трифторметил)-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2*H*-индол-2-оны) (см. схему). Отметим, что в реакции с 1,3-диаминопропаном образуется один (*S*^{*},*R*^{*})-диастереомер, тогда как с этилендиамином – два (*S*^{*},*R*^{*})- и (*R*^{*},*R*^{*})-диастереомера. Аналогичная циклизация с ацетатом аммония приводит к формированию смеси двух изомерных гексагидро-2*H*-индол-2-онов. Строение гетероциклов установлено на основании спектров ЯМР ¹H, ¹⁹F, ¹³C, элементного анализа и РСА.

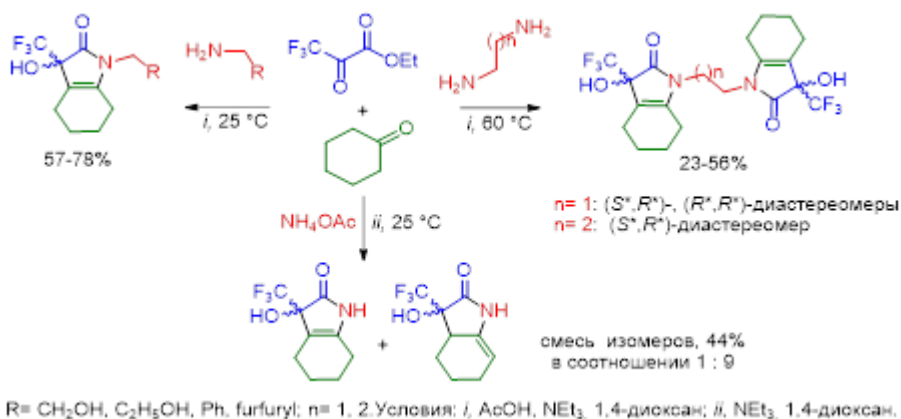


Схема синтеза гексагидроиндол-2-онов

Работа выполнена в рамках темы гос. задания № 124020200072-0.