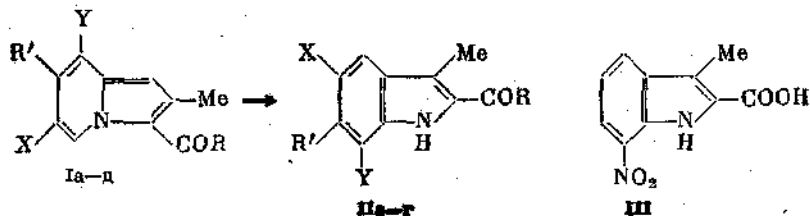


## РЕЦИКЛИЗАЦИЯ 3-АЦИЛ-6(8)-НИТРОИНДОЛИЗИНОВ С ОБРАЗОВАНИЕМ 2-АЦИЛ(КАРБОКСИ)-5(7)- НИТРОИНДОЛОВ

С. И. Бобровский, Е. В. Бабаев, Ю. Г. Бундель

Нами найдено, что 3-ацетил(бензоил)-6- и -8-нитроиндолизины (Ia—г) подвергаются реакции изомеризационной рециклизации [1] в более мягких условиях, чем 3-незамещенные 6(8)-нитроиндолизины, с образованием соответствующих 2-ацил-5(7)-нитроиндолов (IIa—г). Легко протекающая уже при комнатной температуре рециклизация трифторацетильного производного (Iд) сопровождается галоформной реакцией и приводит к нитроиндолкарбоновой кислоте (III).



I, II, X = NO<sub>2</sub> (а, б), Y = NO<sub>2</sub> (в, г, д); R = Me (а, в), Ph (б, г), CF<sub>3</sub> (д); R' = Me (а). Неизвестные X, Y, R' = H.

Предложенный новый метод синтеза 2-замещенных нитроиндолов типа (II), (III) представляет удобную синтетическую альтернативу многостадийным методикам [2-4] получения подобного подкласса соединений, которые, как известно [4], являются ключевыми полупродуктами в синтезе транквилизаторов ряда нитразепама. Ацилнитроиндолизины (Ia—д) получают реакцией 6(8)-нитроиндолизинов с As<sub>2</sub>O<sub>3</sub>, (CF<sub>3</sub>CO)<sub>2</sub>O или PhCOCl. Приведены соединение, выход, % (выход на вступивший нитроиндолизин, %), т. пл., °C: Ia, 70, 174—175; Ib, 27 (84), 216—218; Ic, 56, 172—173; Id, 52 (64), 148—149; IIa, 100, 162—164; IIb, 61, 232—233; IIc, 73, 234—236; IId, 90, 146—148; III, 30 (не оптимизирован), 158—160; III, 72, 272—275 (литературные данные: т. пл. 270 °C [3]). Строение описанных соединений подтверждено совокупностью данных элементного анализа, УФ, ИК, ПМР и масс-спектров. Механизм реакции «галоформной рециклизации» [например, (Id) → (III)] является предметом отдельной публикации.

### Литература

- [1] Кост А. Н., Савитуллин Р. С., Громов С. П. — Докл. АН СССР, 1978, т. 230, с. 1106—1109.  
[2] Mudry C. A., Frasca A. R. — Tetrahedron, 1973, vol. 29, p. 603—613.

- [3] *Hughes G. K., Lions F., Ritchie E.* — J. Proc. Roy. Soc. N. S. Wales, 1939, vol. 72, p. 209—220; C. A., 1939, vol. 33, 6837.
- [4] *Inaba S., Ishizumi K., Mori K., Yamamoto H.* — Chem. Pharm. Bull., 1971, vol. 19, p. 722—729; Кричевский Э. С., Романова О. Б., Гринев А. Н. — ХГС, 1983, № 12, с. 1648—1651; Гринев А. Н., Кричевский Э. С., Романова О. Б., Ермаков А. И., Соколов И. И., Машковский М. Д. — ХФЖ, 1983, т. 17, с. 1300—1304.

Московский государственный  
университет имени М. В. Ломоносова

Поступило 1 IV 1987