

КРАТКИЕ СООБЩЕНИЯ

УДК 547.754+547.756:

ПРОИЗВОДНЫЕ ИНДОЛА

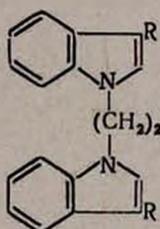
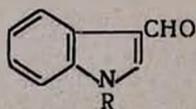
XXXIX. 1-ЗАМЕЩЕННЫЕ ИНДОЛЫ И ИНДОЛ-3-АЛЬДЕГИДЫ

Г. Л. ПАПАЯН и Л. С. ГАЛСТЯН

Институт тонкой органической химии им. А. Л. Мнджояна АН Армянской ССР

Поступило 8 XII 1971

В целях синтеза разных производных индола по способу [1] из индол-3-альдегида и хлорангидридов фенилуксусной и β -фенилпропионовой кислот получены альдегиды I и II, а из метилового эфира α -бромфенилуксусной кислоты—1-(карбметоксибензил)-индол-3-альдегид (III), превращенный омылением в 1-(карбоксибензил)-индол-3-альдегид (IV). С бромистым этиленом индол-3-альдегид образовал 1,2-этилен- N,N' -бис-индол-3-альдегид (V), охарактеризованный также в виде динитровинильного производного VI.



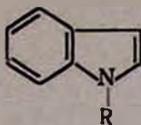
I, R = $\text{OCCH}_2\text{C}_6\text{H}_5$; II, R = $\text{OCCH}_2\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$;

III, R = $\text{C}_6\text{H}_5\text{CHCOOCH}_3$; IV, R = $\text{C}_6\text{H}_5\text{CHCOO.H}$.

V, R = CHO; VI, R = $\text{CH}=\text{CHNO}_2$; VII, R = $\text{CH}=\text{NNO}_2$



Полученный из V и тубазида гидразидогидразон (VII), представляющий собой бис-аналог имеющего высокую противотуберкулезную активность ранее синтезированного производного индол-3-альдегида [2], показал значительно более низкую активность. Алкилированием индольного азота получен 1-карбметоксибензилиндол (VIII), а омылением последнего—соответствующая кислота (IX)



VIII, $R = C_6H_5CHCOOCH_3$; IX, $R = C_6H_5CHCOOH$.

По сравнению с производными индол-3-альдегида выход IX был низким.

Экспериментальная часть

1-Фенацилиндол-3-альдегид (I). Смесь 3,7 г (0,025 моля) индол-3-альдегида, 4 г (0,025 моля) хлорангидрида фенилуксусной кислоты, 3,6 г сухого поташа и 10 мл ДМФА нагревают на колбонагревателе 6 часов. После обычной обработки получают 4,2 г (62,56%) I. Т. пл. 174—175°. Найдено %: С 77,60; Н 5,50; N 6,03. $C_{17}H_{13}NO_2$. Вычислено %: С 77,57; Н 4,94; N 5,33.

1-β-Фенилпропионилиндол-3-альдегид (II). Смесь 3,7 г (0,025 моля) индол-3-альдегида, 2,8 г (0,025 моля) хлорангидрида β-фенилпропионовой кислоты, 3,6 г сухого поташа, 7 мл ДМФА нагревают на колбонагревателе 6 часов. Выход 4,1 г (58,57%). Т. пл. 186—188°. Найдено %: С 77,71; Н 5,61; N 5,50. $C_{18}H_{15}O_2N$. Вычислено %: С 78,00; Н 5,41; N 5,05.

1,2-Этилен-N,N'-бис-индол-3-альдегид (V). Смесь 1,45 г (0,01 моля) индол-3-альдегида, 0,9 г (0,005 моля) бромистого этилена, 1,35 г сухого поташа и 10 мл ДМФА нагревают на колбонагревателе 6 часов. Выход 2,56 г (81,4%). Т. пл. 155—156°. Найдено %: С 75,42; Н 5,50; N 8,98. $C_{20}H_{16}N_2O_2$. Вычислено %: С 75,94; Н 5,06; N 8,86.

Динитровинильное производное альдегида V (VI). Смесь 5,7 г (0,018 моля) V, 25 мл нитрометана и 3,1 г уксуснокислого аммония нагревают на водяной бане 1 час. По охлаждению выделяются кристаллы нитровинила с т. пл. 235—237°. Выход 4,2 (58,0%). Найдено %: С 65,70; Н 4,74; N 13,16. $C_{22}H_{17}N_4O_4$. Вычислено %: С 65,67; Н 4,47; N 13,93.

Изоникотиноилгидразон 1,2-этилен-N,N'-бис-индол-3-альдегида (VII). Смесь 3,2 г (0,01 моля) V, 2,8 г (0,02 моля) гидразида изоникотиновой кислоты, 0,5 мл пиперидина, 0,5 мл ледяной уксусной кислоты в 30 мл бензола нагревают на колбонагревателе 10 часов с водоотделителем. Продукт растворяют в бензоле и осаждают петролейным эфиром. Т. пл. 226—228°. Выход 4,2 г (75,0%). Найдено %: N 20,22. $C_{32}H_{26}N_6O_2$. Вычислено %: N 20,02.

1-α-Карбметоксибензил-индол-3-альдегид (III). Смесь 2,9 г (0,02 моля) индол-3-альдегида, 4,6 г (0,02 моля) метилового эфира α-бромфенилуксусной кислоты, 2,8 г сухого поташа и 20 мл ДМФА нагревают на колбонагревателе 6 часов. После охлаждения добавляют измельченный лед. Продукт растворяют в бензоле и осаждают петролейным эфиром. Выход 3,2 г (54,66%). Т. пл. 108—109°. Найдено %: С 73,33; Н 5,06; N 4,80. $C_{18}H_{15}NO_3$. Вычислено %: С 73,71; Н 5,12; N 4,78.

1-α-Карбоксибензил-индол-3-альдегид (IV). Смесь 2,9 г (0,01 моля) III в спирте и 0,5 г спиртового раствора едкого натра нагревают 6 часов на водяной бане. Выход кислоты 1,7 г (64,88%). Т. пл. 117—118°. Найдено %: С 73,58; Н 5,20; N 4,57. $C_{17}H_{13}NO_3$. Вычислено %: С 73,12; Н 4,65; N 5,01.

Аналогично получен 1-карбметоксибензилиндол (VIII). Выход 45,0%; т. пл. 109—110°. Найдено %: С 76,74; Н 6,02; N 5,54. $C_{17}H_{15}NO_2$. Вычислено %: С 76,98; Н 5,66; N 5,28.

1-Карбоксибензилиндол (IX). Выход 53,8%; т. пл. 89—90°. Найдено %: С 75,98; Н 5,52; N 5,57. $C_{16}H_{13}NO_2$. Вычислено %: С 76,50; Н 5,18; N 5,57.

ЛИТЕРАТУРА

1. A. Kalir, S. Szara. J. Med. Chem., 9, 793 (1966).
2. А. Л. Мнджоян, Г. Л. Папоян, Синт. гет. соед., вып. IV, стр. 38, 1959.