

НЕКАТАЛИЗИРУЕМЫЕ ПЕРЕХОДНЫМИ МЕТАЛЛАМИ РЕАКЦИИ С-Н/С-Н СОЧЕТАНИЯ 4*N*-ИМИДАЗОЛ-1-ОКСИДОВ С ИНДОЛАМИ В ДИЗАЙНЕ НОВЫХ АЗАГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИХ СИСТЕМ

Н.Ф. Васькина,¹ Е.А. Никифоров,¹ Т.Д. Мосеев,¹ М.В. Вараксин,^{1,2}
Д.Г. Мажукин,³ А.Я. Тихонов,³ В.Н. Чарушин,^{1,2} О.Н. Чупахин^{1,2}



¹ Уральский федеральный университет им. первого президента России Б.Н. Ельцина, 620002 Россия, Екатеринбург, ул. Мира, 19
E-mail: m.v.varaksin@urfu.ru



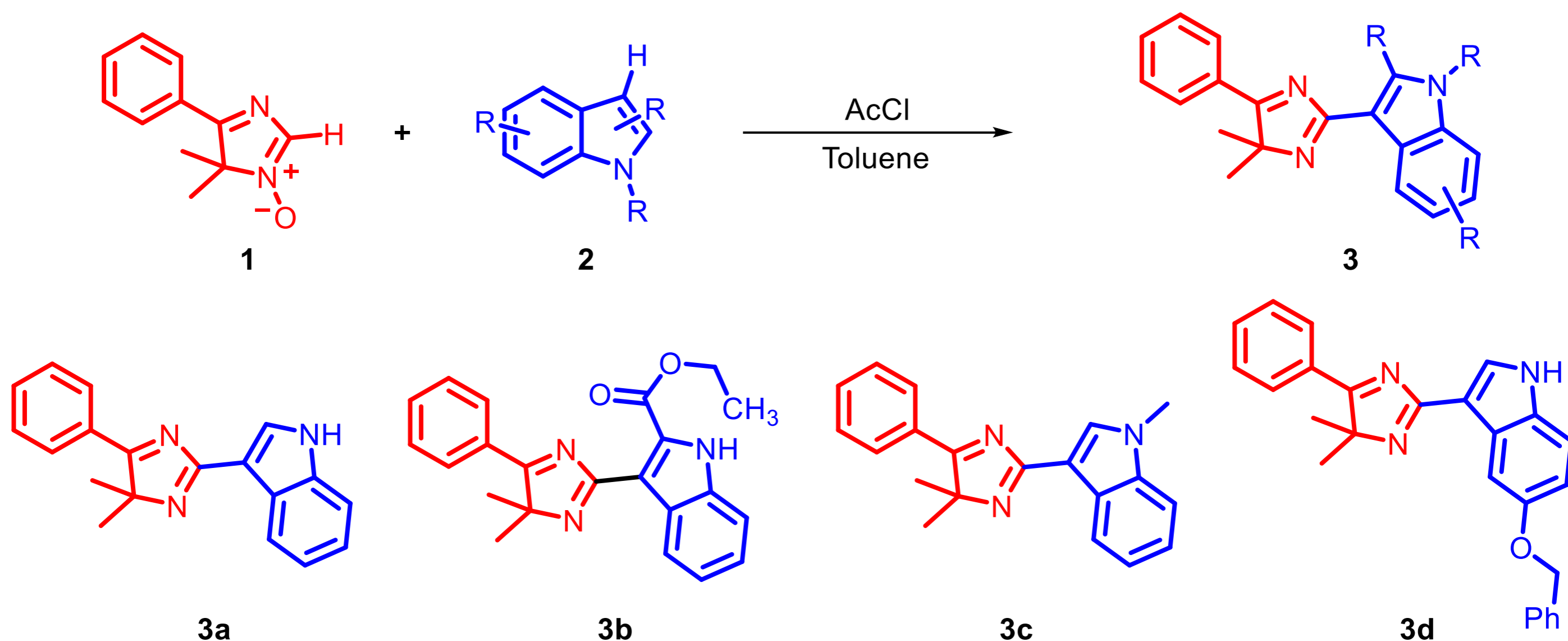
² Институт органического синтеза им. И.Я. Постовского, 620041 Россия, Екатеринбург, ул. Софьи Ковалевской, 22



³ Новосибирский институт органической химии им. Н.Н. Ворожцова СО РАН

В настоящее время одной из актуальных задач органического синтеза является разработка методологий для создания новых углерод-углеродных (С-С) связей между двумя органическими субстратами. Данные процессы должны соответствовать базовым принципам зеленой химии, таким как отказ от использования токсичных растворителей, а также катализаторов, имеющих в своем строении переходные металлы. Одним из таких процессов является прямая С-Н функционализация различных субстратов, которая может протекать как в присутствии катализа переходными металлами, так и в «metal-free» варианте. Частным случаем данной методологии является реакция нуклеофильного замещения водорода (S_N^H), которая в настоящее время успешно применяется для прямой функционализации (аза)гетероциклических субстратов ароматической и неароматической природы.

Производные имидазола находят своё применение в медицине в качестве соединений, обладающих спазмолитическим, гипотензивным и противогрибковым действием. С другой стороны, соединения на основе индолов известны в качестве противовоспалительных, противовирусных, а также гемостатических препаратов. Таким образом, разработка высокоэффективных методов получения бигетероциклических структур на основе имидазолов и индолов представляет собой актуальную задачу органического синтеза.



Новые индолы, модифицированные фрагментом имидазола, были получены путем нуклеофильного замещения водорода в 4*N*-имидазол-1-оксидах. При действии ацетилхлорида на имидазол-*N*-оксид **2** образуется активированная форма имидазол-*N*-оксида [1], в последствии подвергаемая нуклеофильной атаке со стороны индола **1**. В дальнейшем при элиминировании уксусной и соляной кислот образуются имидазолильные производные индолов **3**. В результате было получено 4 новых индола, функционализированных фрагментом имидазола.