

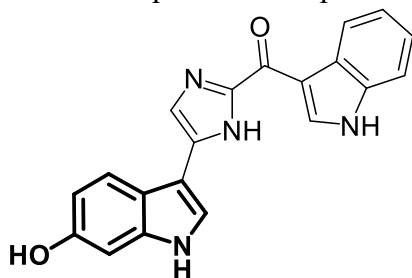
## PR-77

## СИНТЕЗ 4-ГИДРОКСИ И 6-ГИДРОКСИИНДОЛОВ: РЕНЕССАНС РЕАКЦИИ БИШЛЕРА

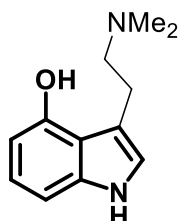
Шарапов А. Д., Фатыхов Р. Ф., Халымбаджа И. А., Чупахин О. Н.

Уральский федеральный университет им. первого Президента России Б. Н. Ельцина,  
620002, Россия, г. Екатеринбург, ул. Мира, 19E-mail: [a.d.sharapov@urfu.ru](mailto:a.d.sharapov@urfu.ru)

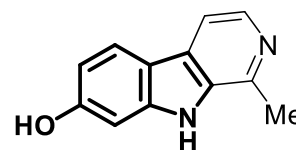
4- и 6-Гидроксииндолы являются перспективными органическими молекулами, обладающими широким спектром биологической активности.



Топсентин



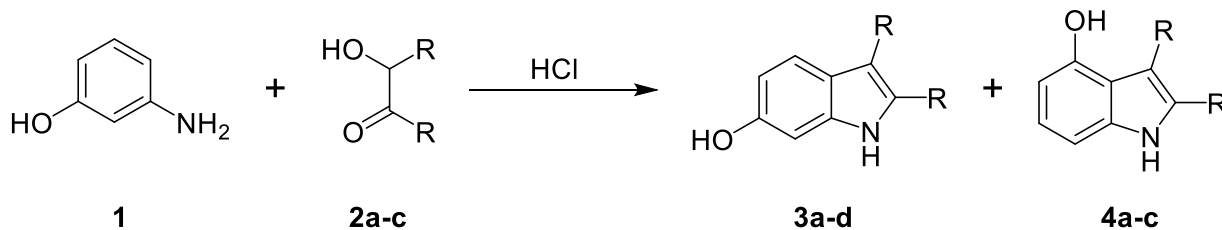
Псилоцин



Гармол

Модифицированная реакция Бишлера [1] – конденсация анилина и бензоина – позволяет получить индол и воду в качестве единственного побочного продукта. Эта особенность реакции Бишлера в сочетании с отсутствием растворителей делает эту реакцию особенно актуальной с точки зрения зеленой химии и атомной экономии. Гидроксииндолы особенно удобно получать по реакции Бишлера, поскольку в некоторых случаях нет необходимости использовать защитные группы для блокирования фенольного гидроксила.

Нами было обнаружено, что сплавление 3-аминофенола **1** (3 экв.) с бензоинами **2a-c** (1 экв.) по модифицированной процедуре при 135 °С при катализе соляной кислотой приводило к получению смеси изомерных 4- и 6-гидроксииндолов **3a-c** и **4a-b** соответственно. При этом основным продуктом является 6-гидроксииндол. Изомерные продукты были разделены колоночной хроматографией.



- a: R = Ph, 80% (общий выход)  
 b: R = 3,4-диметоксифенил, 72% (общий выход)  
 c: R = 3,4,5-триметоксифенил, 61% (общий выход)  
 d: R = 2-хлорфенил, 53%

Строение продуктов **3** и **4** подтверждается данными  $^1\text{H}$  и  $^{13}\text{C}$  ЯМР спектроскопии.

## Библиографический список

1. Gribble GW. Bischler Indole Synthesis. *Indole Ring Synthesis*. 2016, 23, 249–259. doi:10.1002/9781118695692.ch23.

Работа выполнена при поддержке фонда РФФ, проект № 21-13-00382