

PR-81

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

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

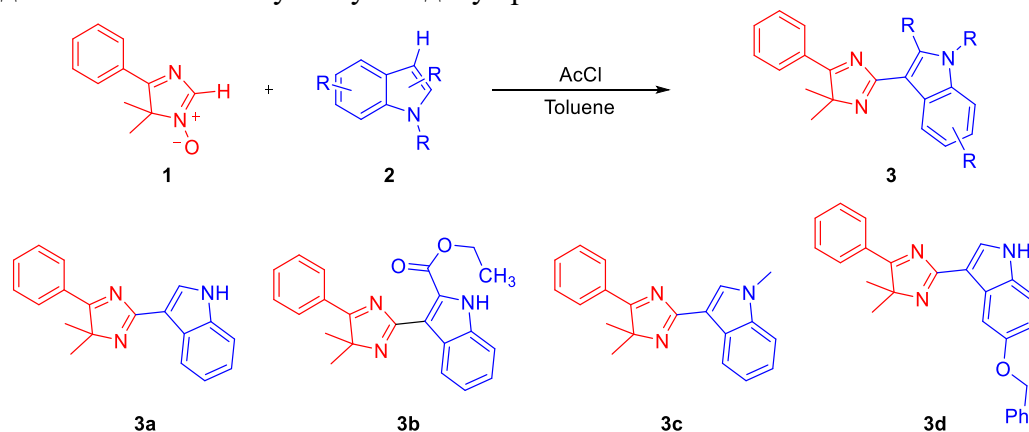
¹ Уральский федеральный университет им. первого президента России Б.Н. Ельцина, 620002
Россия, Екатеринбург, ул. Мира, 19

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
E-mail: m.v.varaksin@urfu.ru

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 4Н-имидазол-1-оксидах. При действии ацетилхлорида на имидазол-N-оксид 2 образуется активированная форма имидазол-N-оксида [1], впоследствии 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.

Исследование проводилось при финансовой поддержке Российского научного фонда в рамках проекта № 20-43-01004.