

**РАЗРАБОТКА МЕТОДА СИНТЕЗА ПРОИЗВОДНЫХ
5,6-ДИМЕТОКСИИНДОЛ-2-КАРБОНОВОЙ КИСЛОТЫ
ГИДРАЗИНОЛИЗОМ 4-(4,5-ДИМЕТОКСИ-2-НИТРОБЕНЗИЛИДЕН)-2-
ФЕНИЛОКСАЗОЛ-5(4Н)-ОНА**

Мартьянов Г.С.^(1,2), Барабанов М.А.⁽²⁾, Пестов А.В.^(1,2)

⁽¹⁾ Уральский федеральный университет

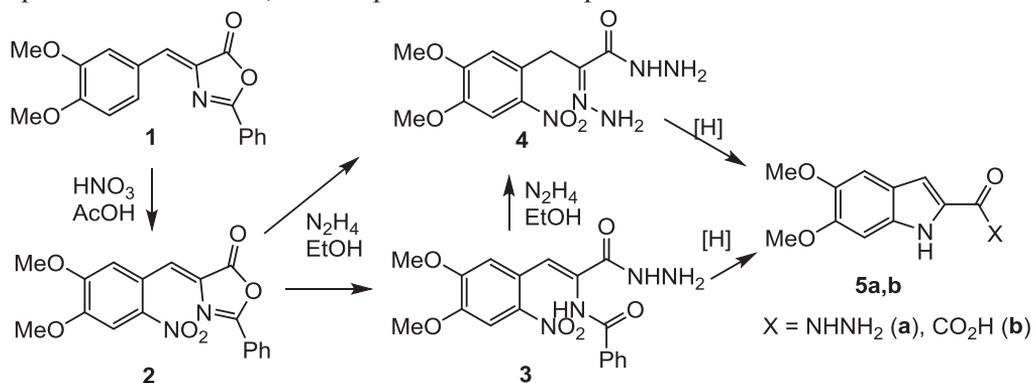
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

⁽²⁾ Институт органического синтеза УрО РАН

620137, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22

5,6-Дигидроксииндол-2-карбоновая кислота (DHICA) является перспективным сырьем для производства синтетического эумеланина. Также она обладает разнообразной полезной биологической активностью, например, ингибирует интегразу ВИЧ [1].

В продолжение работ по синтезу и изучению эндогенных метаболитов, в настоящей работе осуществлен ряд превращений, направленных на синтез предшественников 5,6-дигидроксииндол-2-карбоновой кислоты.



Азлактон **1** синтезирован классическим способом Эрленмейера. Установлено, что нитрование азлактона **1** азотной кислотой в уксусной кислоте приводит к нитроазлактону **2** с выходом 92%. Взаимодействие азлактона **2** с гидразином протекает поэтапно, при этом гидразиды **3** и **4** были выделены в чистом виде с выходами 60% и 74% соответственно. Образование гидразида **3** происходит уже при растворении исходного нитроазлактона **2** в кипящем спиртовом растворе гидразина. Дальнейшее кипячение полученного раствора с избыточным количеством гидразина приводит к замещению бензамидной группы и получению гидразида-гидразона **4**.

Производные **3** и **4** посредством восстановления нитрогруппы могут быть превращены в гидразид диметоксииндолкарбоновой кислоты **5a** и, при последующем гидролизе, в саму кислоту **5b**.

1. Dayam R., Deng J., Neamati N. HIV-1 integrase inhibitors: 2003–2004 update // Medicinal Research Reviews. 2006. Vol. 26, Nr 3. P. 271–309.