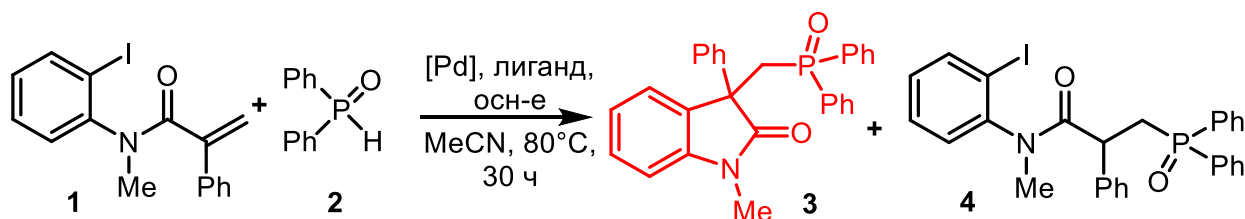


**ПАЛЛАДИЙ-КАТАЛИЗИРУЕМАЯ ЦИКЛИЗАЦИЯ АНИЛИДА
ФЕНИЛАКРИЛОВОЙ КИСЛОТЫ В СИНТЕЗЕ ОКСИНДОЛОВ
С ФОСФОРСОДЕРЖАЩИМИ ЗАМЕСТИТЕЛЯМИ**

С.Ю. Вострухина, А.Н. Резников, Ю.Н. Климочкин
Самарский государственный технический университет,
443100, Россия, г. Самара, ул. Молодогвардейская 244.
E-mail: vostruhina-box@mail.ru

В современной органической химии важную роль играет синтез замещенных оксиндолов. Структурный фрагмент оксиндола встречается во многих биологически активных соединениях и фармацевтических препаратах. Поэтому синтез таких полициклических гетероциклических соединений представляет большой интерес с точки зрения поиска новых лекарственных средств, особенно привлекают внимание энантиомерно обогащенные производные оксиндола. В настоящей работе представлен метод получения нерацемических оксиндолов путем домино-реакции Хека / фосфиноилирования.

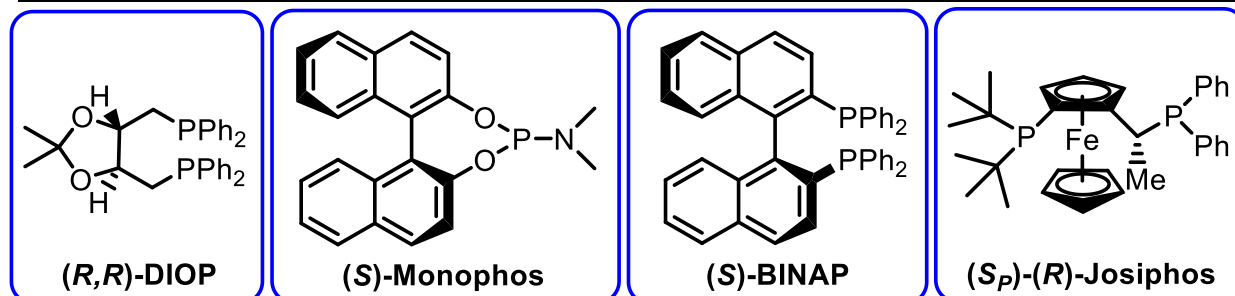
Катализируемая палладием реакция N-(2-йодфенил)-N-метилметакриламида (**1**) и дифенилфосфинооксида (**2**) приводит к фосфиноилметилоксиндолу (**3**). Синтез проводили в ацетонитриле при 80 °С использованием фосфорорганических лигандов и карбоната калия в качестве основания.



В присутствии каталитической системы PdCl₂/(*S,S*)-Monophos и PdCl₂/(*R,R*)-DIOP образуется продукт (**3**), причем в последнем случае образуется нерацемический продукт с энантиомерным избытком 13%. В случае лигандов (*S*)-BINAP и (*S_P*)-(*R*)-Josiphos образуется продукт (**4**).

Таблица 1. Оптимизация условий реакции

№	Катализатор	Лиганд	Основание	Продукт	Выход	ee
1	PdCl ₂	(<i>R,R</i>)-DIOP	K ₂ CO ₃	3	58%	13%
2	PdCl ₂	(<i>S</i>)-Monophos	K ₂ CO ₃	3	58%	0%
3	Pd(dba) ₂	(<i>R,R</i>)-DIOP	K ₂ CO ₃	3	13%	15%
4	PdCl ₂	(<i>S</i>)-BINAP	K ₂ CO ₃	4	62%	-
5	PdCl ₂	(<i>S_P</i>)-(<i>R</i>)-Josiphos	K ₂ CO ₃	4	28%	-



Работа выполнена при финансовой поддержке РНФ, проект № 21-73-20096.