

Ранее нами показано, что 2-хлор-3Н-индол-3-он (1) является удобным синтоном для получения различного типа гетероциклических соединений [1-4]. В развитие способа получения новых представителей гетероциклических соединений разработан препаративный метод синтеза нового представителя 2-пирролидона взаимодействием синтона (1) с 4-(карбомоиламино)бутановой кислотой (2). Кипячение эквимольных количеств соединений 1 и 2 в бензоле в присутствии пиридина в течение 2 часов приводит к образованию с высоким выходом (73 %) 4-[(3Н-индол-2-илкарбомоил)амино]бутановой кислоты (3): Дальнейшую циклизацию соединения 3 с формированием 2-оксо-N-(3-оксо-3Н-индол-2-ил)пирролидин-1-карбоксамид (4) проводят в уксусном ангидриде, что позволяет увеличить выход целевого соединения 4 до 77 % и способствует более простому извлечению его из реакционной массы (см. экспериментальную часть). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  соединения 4 в  $(\text{CD}_3)_2\text{C}=\text{O}$  содержит сигналы ароматических протонов ( $\delta$  7.1 - 7.85 м.д.), амидного протона (уширенный синглет при  $\delta$  9.2 м.д.) и протонов трёх метиленовых групп. Сигналы последних представляют два триплета с различающимися значениями химических сдвигов [ $\delta$  (NCH<sub>2</sub>) 3.35 м.д. и  $\delta$  CH<sub>2</sub>(C=O) 2.5 м.д.], а также триплет триплетов при  $\delta$  1.5 м.д. Триплетный характер расщепления сигналов CH<sub>2</sub> обусловлен магнитной эквивалентностью протонов в каждой из групп. Соотношение интегральных интенсивностей сигналов в спектре точно соответствует количеству протонов в соответствующих структурных элементах. Для доказательства строения замещённого 2-пирролидона (4) применён также метод ИК-спектроскопии. В ИК-спектре (KBr) отмечены полосы поглощения при 3250-3340 см<sup>-1</sup> (валентные колебания N-H - связи) и 1670 см<sup>-1</sup> (C=O) групп, участвующих в образовании межмолекулярных водородных связей, а также полосы поглощения при 3030 см<sup>-1</sup> (N-H) и 1710 см<sup>-1</sup> (C=O), характеризующие внутримолекулярную водородную связь. Интенсивная полоса при 1580 см<sup>-1</sup> свидетельствует о N-H деформационных колебаниях. В ИК-спектре соединения 4, снятом в хлороформе, сохраняются характерные для внутримолекулярной водородной связи полосы поглощения. В то же время полосы, отражающие наличие межмолекулярных водородных связей, исчезают и одновременно появляются полосы поглощения свободных групп (C=O) при 1720 см<sup>-1</sup> и (N-H) 3340 см<sup>-1</sup> и 3490 см<sup>-1</sup>. Гетероцикл 4 получен нами также встречным синтезом - взаимодействием соединения 1 и 2-оксо-пирролидин-1-карбоксамид (5) (соотношение 1:1, в присутствии эквивалентного количества NEt<sub>3</sub>, кипячение в толуоле в течение 2-х часов). Необходимый для этого синтеза карбоксамид 5 получают по методике [5] циклизацией кислоты 2 в присутствии POCl<sub>3</sub>. Физико-химические и спектральные характеристики соединения 4, полученного двумя разными путями, идентичны. Экспериментальная часть 4-[(3Н-индол-2-илкарбомоил)амино]бутановая кислота (3): кипятят в 20 мл бензола в присутствии 3 мл пиридина 3.31 г (0.02 моль) соединения 1 и 1.92 г (0.02 моль) кислоты 2 в течение 2 часов. Раствор

охлаждают и отгоняют растворитель при пониженном давлении. К остатку добавляют 30 мл смеси эфира и спирта (3:1). Выпавший осадок гидрохлорида пиридина отфильтровывают, фильтрат упаривают. Остаток перекристаллизовывают из бензола. Получают 4 г (73 %) целевого соединения 3. Т.пл. 155-156 °С. Спектр ЯМР <sup>1</sup>H (d6-ацетон, ГМДС), δ, м.д.: 1.45 (2H, м, CH<sub>2</sub>); 2.40 (2H, т, CH<sub>2</sub>COOH); 3.25 (2H, т, NCH<sub>2</sub>); 7.10 (1H, д, H-5); 7.35 (1H, д, H-6); 7.55 (1H, д, H-4); 7.70 (1H, д, H-7); 10.8 (2H, уш.с., 2NH); 12.5 (1H, уш.с., OH). Найдено, %: С 56.29; Н 4,47; N 15.52; C<sup>13</sup>H<sup>13</sup>N<sup>3</sup>O<sub>4</sub>. Вычислено, %: С 56.73; Н 4,73; N 15.27. 2-оксо-N-(3-оксо-3H-индол-2-ил)пирролидин-1-карбоксамид (4): 2.75 г (0.01 моль) кислоты 3 и 15 мл уксусного ангидрида нагревают на кипящей водяной бане 2 часа. Раствор охлаждают до комнатной температуры, добавляют 10 г ледяной воды и КОН до pH = 5.5 - 6.0. Выпавшие кристаллы отфильтровывают, промывают ледяной водой и перекристаллизовывают из смеси MeCN - EtOH (15 мл 1:1). Получают 1.98 г (77 %) целевого соединения 4. Т.пл. 112-114 °С. ИК-спектр, ν, см<sup>-1</sup>: 3250 - 3340 (NH); 3030 (NH, внутримолекулярная водородная связь); 1670 (C=O); 1580 (N-H деформационные колебания); 1520-1570 (Ind). Спектр ЯМР <sup>1</sup>H (d6-ацетон, ГМДС), δ, м.д.: 1.6 (2H, м, CH<sub>2</sub>); 2.5(2H, т, CH<sub>2</sub>COOH); 3.35 (2H, т, NCH<sub>2</sub>); 7.15 (1H, д, H-5); 7.30 (1H, д, H-6); 7.7 (2H, д.д., H-4 + H-7); 9.00 (1H, уш.с., NH). Найдено, %: С 60.94; Н 4,48; N 16.09; C<sup>13</sup>H<sup>11</sup>N<sup>3</sup>O<sub>3</sub>. Вычислено, %: С 60.70; Н 4,29; N 16.34. 2-оксо-N-(3-оксо-3H-индол-2-ил)пирролидин-1-карбоксамид (4) получали также кипячением соединения 1 и 2-оксо-пирролидин-1-карбоксамид (5) (1:1) в толуоле в присутствии NEt<sub>3</sub> в течение 2-х часов. Физико-химические данные и спектральные характеристики у обоих соединений идентичны. Таким образом разработан препаративный метод получения новой гетероциклической системы 2-оксо-N-(3-оксо-3H-индол-2-ил)пирролидин-1-карбоксамид