

Схема 2

ские и хорошо известные, так и разработанные в последние годы [2]. Одним из важнейших методов синтеза индолов является открытая в 1912 году Вальтером Маделунгом внутримолекулярная циклизация *o*-алкиламидов под действием основания [3, 4].

В нашей работе мы исследовали возможность получения 1,2-дизамещенных индолов, содержащих акцепторные заместители в положении 3, по реакции Маделунга. Показано, что

наибольшего выхода в данной реакции удастся достичь при использовании 3 эквивалентов ДБН в качестве основания, ДМСО в качестве растворителя, при 100 °С. Использование KCN вместо *p*-TolSO₂Na приводит к получению 3-циано индолов. При этом, данная реакция протекает и без присутствия ДБН, однако, выходы в данном случае уменьшаются.

Работа выполнена в рамках Государственного задания ИХХС РАН.

Список литературы

1. Seigler D.S. *Plant secondary metabolism*. New York. Springer, 2001. – 759 pp.
2. Humphrey G.R., Kuethe J.T. *Practical Methodologies for the Synthesis of Indoles* // *Chem. Rev.* – 2006. – V. 106. – P. 2875–2911.
3. Mauthner J., Suida W. *Zur Gewinnung von Indol aus Derivaten des Orthotoluidins* // *Monatsh. Chem.* – 1886. – V. 7. – P. 230–240.
4. Madelung W. *Über eine neue Darstellungsweise für substituierte Indole. I* // *Ber. Dtsch. Chem. Ges.* – 1912. – V. 45. – P. 1128–1134.

СИНТЕЗ И ЦИКЛИЗАЦИЯ 2-((МОРФОЛИНОИМИНО)МЕТИЛ)БЕНЗОЙНОЙ КИСЛОТЫ

А. Қ. Сыздыков¹, С. К. Кабиева¹, А. И. Хлебников²
 Научный руководитель – д.х.н., профессор О. А. Нуркенов

¹Карагандинский индустриальный университет
 101400, Казахстан, г. Темиртау, просп. Республики, 30

²Национальный исследовательский Томский политехнический университет
 634050, Россия, Томск, пр. Ленина, 30
 ardak.syzdykov.96@inbox.ru

Данная работа специализированно использованию 2-формилбензолкарбоновая кислоты в синтезе новой конденсированной системы с фрагментом имид *o*-фталевой кислоты. Так, аналогично реагирует таутомерная 2-формилбензо-

лкарбоновая кислота (**1a**) – 4-аминоморфолин, образуя основания Шиффа с некоторыми аминами [1], диаминами [2] и гидразидами [3]. Показано, что полученное основание Шиффа **2** плавно трансформироваться во имид *o*-фталевой

кислоты **3** при кипячении этановый ангидрид. Следует отметить, что реакция утекает гладко только в том случае, если в составе ангидрида находится определенное количество уксусной кислоты.

Структура синтезированных соединений **2** и **3** была определена с помощью ЯМР-спектроскопии ^1H - и ^{13}C , а также данных двумерных спектров COSY (^1H - ^1H) и HMQC (^1H - ^{13}C).

Для определения пространственной структуры 2-морфолино-3-оксоизоиндолина-1-илацетата (**3**) было проведено его рентгеноструктурное исследование (рисунок).

2-((морфолиноимино)метил) бензойной кислоты (**2**) – было изучена на цитотоксическая активизацию против личинок морских ракообразных *Artemia salina* (Leach) в условиях культивирования *in vitro*. Исследование показало, что **2** – ((морфолиноимино)метил)бензойная кислота (**2**) выявляет умеренную цитотоксическую активизацию ($\text{LD}_{50} = 56,0$ мкг/мл) против личинок морских ракообразных *Artemia salina* (Leach).

Оценка исследования антимикробной активизации показали, что образец 2-((морфолиноимино)-метил)бензойной кислоты (**2**) проде-

монстрировал выраженную антибактериальную активизацию против грамотрицательного тестового штамма *Escherichia coli* ATCC 25922 с минимальной ингибирующей концентрацией (МИК) составила – 6,3 мкг/мл, и малую антимикробную активизацию в отношении грамположительного тест-штамма *Staphylococcus aureus* ATCC 6538.

Работа выполнена в рамках проекта № AP14869941 на грантовое финансирование Комитета науки МНВО РК.

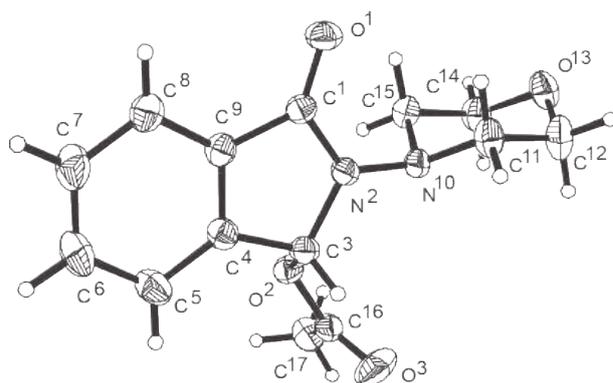


Рис. 1. Пространственное строение молекулы **3** (эллипсоиды тепловых колебаний показаны с вероятностью 30 %)

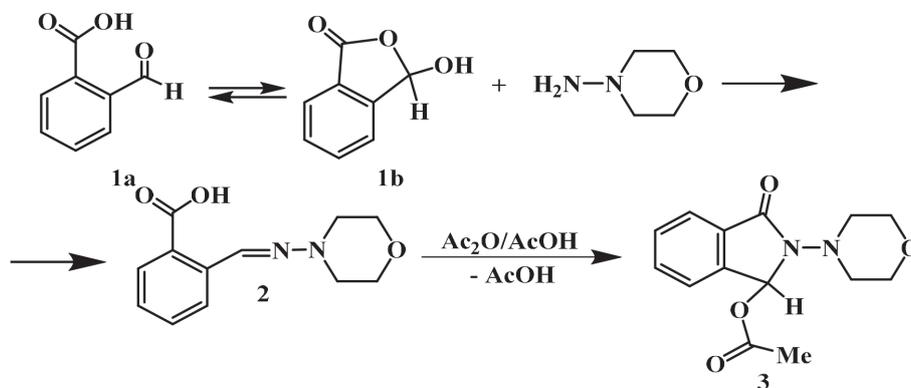


Схема 1

Список литературы

1. Ухин Л.Ю., Красников В.В., Зайченко С.Б., Бородкин Г.С., Грибанова Т.Н., Шепеленко Е.Н., Этметченко Л.Н. // Изв. АН. Сер. хим. – 2015. – № 2. – С. 410–414.
2. Patel D., Kumari P., Patel N. // Med. Chem. Res. – 2012. – Vol. 21. – P. 2926–2944.
3. Ухин Л.Ю., Кузьмина Л.Г., Грибанова Т.Н., Белоусова Л.В., Орлова Ж.И. // Изв. АН. Сер. хим. – 2008. – № 11. – С. 2294–2302.