

С. А. Ямашкин, Г. А. Романова^а, Е. А. Орешкина^а, Н. В. Жукова^а

**СИНТЕЗ
ПИРРОЛО[2,3-*g*]- И ПИРРОЛО[3,2-*f*]ХИНОЛИНОВ
ИЗ 5-АМИНО-2,3-ДИМЕТИЛ- И 1,2,3-ТРИМЕТИЛИНДОЛОВ
И 4,4,4-ТРИФТОРАЦЕТОУКСУСНОГО ЭФИРА**

Установлено, что при взаимодействии 5-амино-2,3-диметил- и 1,2,3-триметилиндолов с 4,4,4-трифторацетоуксусным эфиром в зависимости от условий проведения реакции конденсация реализуется либо за счет трифторметилкарбонильной группы, либо сложноэфирной. Образующиеся при этом енаминокротонаты в термических условиях (кипячение в дифениле) легко превращаются в пирроло[3,2-*f*]хинолины, а амиды в трифторуксусной кислоте (78 °С) циклизуются с образованием пирроло[2,3-*g*]хинолинов.

Ключевые слова: 5-амино-2,3-диметилиндол, 5-амино-1,2,3-триметилиндол, пирроло-[2,3-*g*]хинолин, пирроло[3,2-*f*]хинолин, этиловый эфир 4,4,4-трифторацетоуксусной кислоты.

Продолжая разработку методов синтеза трифторметилзамещенных пирролохинолинов [1–4] – потенциальных биологически активных соединений, мы исследовали реакции 5-амино-2,3-диметил- и -1,2,3-триметилиндолов с 4,4,4-трифторацетоуксусным эфиром.

При этом было обнаружено, что, в отличие от ацетоуксусного эфира [5], его аналог полностью фторированный по ацетильной группе в тех же условиях (кипячение в абсолютном бензоле со следами ледяной уксусной кислоты) с 5-амино-2,3-диметил- и -1,2,3-триметилиндолами **1**, **2** дает продукты реакции с участием не только карбонильной, но и этоксикарбонильной группы (преимущественно).

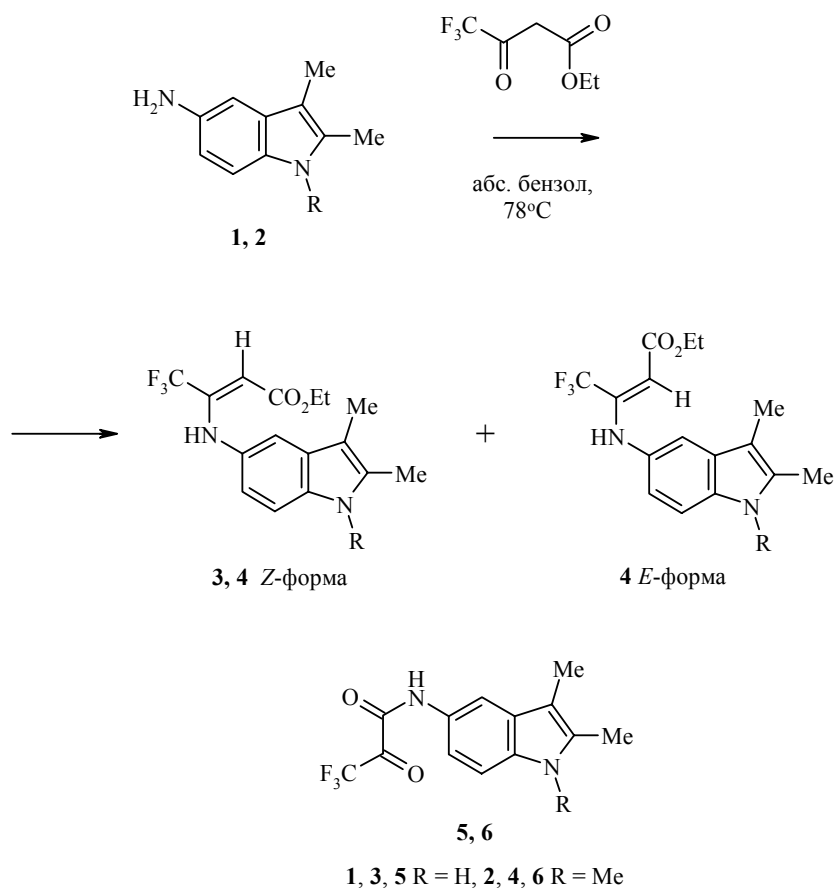
Нами также было найдено, что при проведении этой же реакции в бензоле при температуре 10–15 °С в присутствии водоотнимающего средства (прокаленного сульфата кальция) как для амина **1**, так и **2** единственными образующимися продуктами являются енаминокротонаты **3** (40%) и **4** (50%). Следует отметить, что реакции образования как амидов, так и енаминокротонатов с участием аминоиндола **2** протекают за меньший промежуток времени и с более высокими выходами, что свидетельствует, по-видимому, о некотором повышении основности амина под влиянием N-метильной группы.

В спектре ЯМР ¹H соединения **3** проявляются триплетный и квадруплетный сигналы протонов этокси группы, синглеты протонов 2-, 3-CH₃, H вин., N–H амин, H-4, H-1, два дублета протонов H-6 и H-7 с $J = 7$ Гц (спектральные характеристики полученных соединений в табл. 1).

Т а б л и ц а 1

Спектральные параметры соединений 3, 4, 7–10, 14

Соединение	УФ спектр		Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (J , Гц)	Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %)
	λ_{max} , нм	$\lg \epsilon$		
Z-3	208 пл	4.31	1.24 (3H, т, $J = 7$, OCH_2CH_3); 2.12 (3H, с, 3- CH_3); 2.31 (3H, с, 2- CH_3); 4.14 (2H, к, $J = 7$, OCH_2CH_3); 5.25 (1H, с, Н вин.); 6.85 (1H, д, $J = 7$, Н-6); 7.18 (1H, с, Н-4); 7.19 (1H, д, $J = 7$, Н-7); 9.70 (1H, с, 5-NH); 10.71 (1H, с, Н-1)	326 $[\text{M}]^+$ (100), 280 (70), 279 (42), 265 (18), 257 (32), 253 (43), 252 (84), 251 (73), 238 (31), 237 (45), 231 (26), 211 (23), 183 (36), 169 (15), 144 (47), 143 (44), 128 (11), 115 (31), 91 (15), 77 (18), 69 (21)
	233	4.44		
	294	4.39		
E-4	208	4.29	1.08 (3H, т, $J = 7$, OCH_2CH_3); 2.16 (3H, с, 3- CH_3); 2.33 (3H, с, 2- CH_3); 3.67 (3H, с, 1- CH_3); 3.93 (2H, к, $J = 7$, OCH_2CH_3); 4.78 (1H, с, Н вин.); 6.90 (1H, д, $J = 7$, Н-6); 7.22 (1H, с, Н-4); 7.30 (1H, д, $J = 7$, Н-7); 8.75 (1H, с, 5-NH)	340 $[\text{M}]^+$ (100), 295 (26), 294 (67), 293 (35), 279 (18), 271 (31), 267 (18), 266 (28), 265 (40), 252 (22), 251 (29), 231 (11), 225 (10), 198 (13), 197 (21), 183 (11), 158 (47), 157 (19), 156 (12), 143 (17), 115 (16), 113 (10), 91 (8), 69 (10)
	235	4.41		
	294	4.35		
Z-4			1.23 (3H, т, $J = 7$, OCH_2CH_3); 2.16 (3H, с, 3- CH_3); 2.33 (3H, с, 2- CH_3); 3.67 (3H, с, 1- CH_3); 4.15 (2H, к, $J = 7$, OCH_2CH_3); 5.25 (1H, с, Н вин.); 6.90 (1H, д, $J = 7$, Н-6); 7.22 (1H, с, Н-4); 7.30 (1H, д, $J = 7$, Н-7); 9.70 (1H, с, 5-NH)	
7	220	4.47	2.41 (3H, с, 2- CH_3); 2.56 (3H, с, 1- CH_3); 7.18 (1H, с, Н-8); 7.55 (1H, д, $J = 8$, Н-5); 7.75 (1H, д, $J = 8$, Н-4); 11.42 (1H, с, Н-6); 11.63 (1H, с, Н-3)	280 $[\text{M}]^+$ (100), 279 (85), 265 (20), 140 (11), 115 (10), 91 (8), 78 (11), 77 (15), 75 (10), 69 (30), 63 (13), 51 (11), 41 (14), 40 (12), 39 (16)
	241	4.43		
	286	4.27		
	345	3.98		
8	222	4.52	2.42 (3H, с, 2- CH_3); 2.59 (3H, с, 1- CH_3); 3.80 (3H, с, 3- CH_3); 7.19 (1H, с, Н-8); 7.62 (1H, д, $J = 8$, Н-5); 7.95 (1H, д, $J = 8$, Н-4); 11.62 (1H, с, Н-6)	294 $[\text{M}]^+$ (100), 293 (71), 280 (15), 279 (56), 207 (8), 140 (8), 135 (11), 69 (23), 56 (9)
	244	4.44		
	290	4.31		
	351	4.03		
9	235	4.63	2.18 (3H, с, 3- CH_3); 2.39 (3H, с, 2- CH_3); 6.70 (1H, с, Н-7); 7.30 (1H, с, Н-9); 7.52 (1H, с, Н-4); 10.83 (1H, с, Н-1); 11.85 (1H, с, Н-5)	280 $[\text{M}]^+$ (100), 279 (73), 265 (40), 251 (9), 69 (12)
	273	4.05		
	357	4.30		
10	238	4.45	2.22 (3H, с, 3- CH_3); 2.40 (3H, с, 2- CH_3); 3.70 (3H, с, 1- CH_3); 6.73 (1H, с, Н-7); 7.93 (1H, с, Н-9); 7.51 (1H, с, Н-4); 11.77 (1H, с, Н-5)	294 $[\text{M}]^+$ (100), 293 (76), 279 (38), 265 (9), 250 (5), 69 (5)
	273	3.89		
	357	4.06		
14	238	4.70	2.29 (3H, с, 3- CH_3); 2.43 (3H, с, 2- CH_3); 3.73 (3H, с, 1- CH_3); 3.74 (3H, с, 5- CH_3); 6.86 (1H, с, Н-7); 7.51 (1H, с, Н-9); 7.58 (1H, с, Н-4)	308 $[\text{M}]^+$ (100), 293 (27), 265 (8), 69 (6)
	273	4.15		
	357	4.41		



Характер химических сдвигов винильного и аминного протонов (5.25; 9.70 м. д.) подтверждает *Z*-строение енамина. Спектр енаминокротоната **4** аналогичен, кроме отсутствия сигнала протона Н-1 и наличия синглета протонов 1-СН₃. Также выявлено существование соединения **4** как в *Z*-, так и в *E*-форме (10%) согласно химическим сдвигам протонов N–H (8.75) и Н винильной группы (4.78 м. д.).

В масс-спектрах соединений **3, 4** помимо пика молекулярного иона имеется интенсивный пик иона [M–46]⁺, который соответствует потере С₂Н₅ОН, характерной для всех индолиламинокротонатов, что приводит к молекулярному иону соответствующих пирролохинолонов **7, 8** (расшифровку структур см. с. 89), так как масс-спектральный распад последних и дальнейшая картина распада енаминов **3, 4** одинаковы.

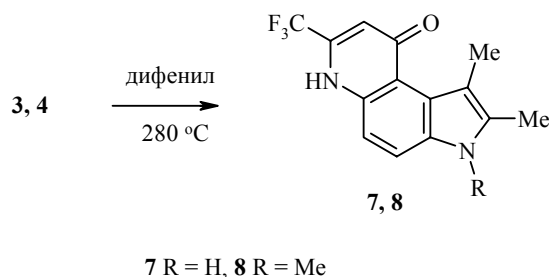
УФ спектры фторированных енаминокротонатов содержат две полосы поглощения, что согласуется с картиной спектров нефторированных аналогов, описанных в литературе [5].

Преимущественное образование амидов **5, 6** при нагревании, подтверждающее факт их образования в условиях термодинамического контроля, по-видимому, связано с акцепторным влиянием трифторметильной группы, которая увеличивает активность сложноэфирной группировки. Подтверждением образования амидов **5, 6**, как и полученных ранее из других аминоиндолов [3, 4], является отсутствие в их спектрах ЯМР ¹H

сигналов протонов этоксикарбонильной группы. Суммарная интегральная интенсивность протонов в спектрах полученных амидов соответствует количеству атомов водорода в их молекулах. Четкое отнесение имеющихся сигналов затруднено существованием в растворе (ДМСО- d_6) амидов как минимум в трех формах: карбонильной, енольной и циклической. Это подтверждается и хроматографически. В связи с этим амиды, как индивидуальные соединения не охарактеризованы, хотя их молекулярные массы, измеренные масс-спектрометрически, соответствуют расчетным.

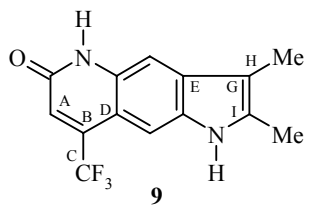
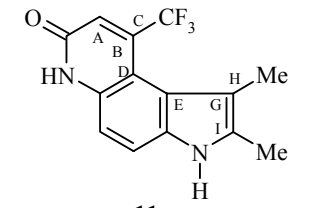
Полученные аминокротонаты **3**, **4** и амиды **5**, **6** далее нами вводились в реакции циклизации с целью изучения направления образования пиридинового цикла при двух альтернативно свободных *орто*-положениях в бензольном кольце, а также влияния на этот процесс N-метильной группы.

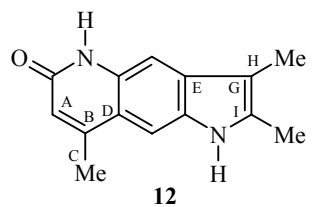
Енамины **3**, **4** при кипячении в дифениле, как и в случае трифторметилзамещенных индолиламинокротонатов со свободным β -положением пиррольного кольца, исследованных ранее [1, 3], превращаются в соответствующие пирролохинолоны **7**, **8**. При этом соединение **8** образуется с бóльшим выходом (85%) и требуется меньшее время кипячения, чем для образования пирролохинолона **7** (73%).



Наличие в спектрах ЯМР 1H соединений **7**, **8** двух дублетов ароматических протонов H-4 и H-5 с $J = 8$ Гц подтверждает ангулярное строение пирролохинолонов. Об этом свидетельствует и слабopольный сдвиг (~ 0.5 м. д.) сигнала протонов группы 1- CH_3 , попадающих под *перивлияние* карбонильного атома кислорода. В спектрах также имеются синглеты протонов групп 2-, 3- CH_3 (для соединения **8**), 2- CH_3 и H-3 (для соединения **7**), H-6 для обеих структур. Пирролохинолоны **7**, **8** устойчивы к электронному удару. В их масс-спектрах самыми интенсивными являются пики молекулярных ионов, $[M-1]^+$, $[M-15]^+$. Пик фрагментного иона с m/z 69 свидетельствует о наличии в молекулах трифторметильной группы. Картина УФ спектров соединений **7**, **8** хорошо согласуется с литературными данными для нефторированных аналогов [5].

Длины связей и значения углов в соединениях 9, 11–13

Соединение *	ΔH_f , ккал/моль	Расстояние В–G, Å	Углы, град					
			ABC	CBD	ABD	EGH	HGI	EGI
 <p style="text-align: center;">9</p>	-157.62		118.81	119.53	121.66	125.10	127.19	107.71
 <p style="text-align: center;">11</p>	-141.06	3.45	112.32	125.55	122.12	131.58	119.32	109.12



-12.49

119.71

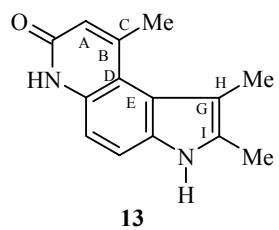
119.62

120.67

125.04

127.19

107.77



-4.90

3.39

114.73

123.69

121.57

131.30

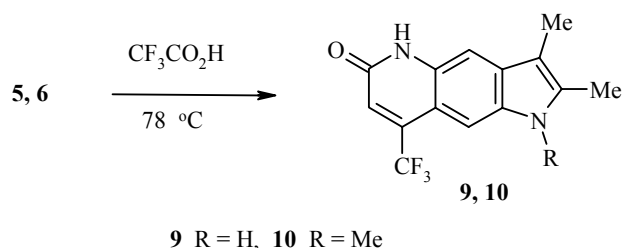
119.93

108.77

* Соединения **12** и **13** описаны в работе [7], соединение **11** – гипотетическая структура.

Таким образом, в енаминах **3**, **4** в условиях термической циклизации замыкание пиридинового цикла независимо от наличия свободного положения 6 и стерических требований группы β -CH₃ пиррольного фрагмента происходит за счет положения 4, как наиболее реакционноспособного. Таким образом, реализуется целенаправленный синтез трифторметилсодержащих пирроло[3,2-*f*]хинолонов.

В отличие от енаминокротонатов, амиды **5**, **6** в трифторуксусной кислоте (78 °С) с хорошим выходом дают исключительно линейные пирролохинолоны **9**, **10**. И в этом случае N-метильная группа несколько активизирует процесс циклообразования. Выходы пирролохинолонов **9** и **10** составляют соответственно 61 и 83%.



О линейном сочленении колец в пирролохинолонах **9**, **10** свидетельствуют спектры ЯМР ¹H, в которых проявляются два одиночных сигнала протонов бензольного кольца Н-4 и Н-9. Спектры также содержат синглетные сигналы протонов групп 2-, 3-CH₃, протонов Н-5, Н-7 и Н-1 (для соединения **9**), 1-CH₃ (для **10**). Самым интенсивным сигналом в масс-спектрах как соединения **9**, так и **10** является пик молекулярного иона, что подтверждает их устойчивость к электронному удару. Довольно интенсивный пик иона [M-H]⁺ и последующее отщепление молекулы CO с образованием иона [M-H-CO]⁺ свидетельствует в пользу хинолоновой формы соединений **9**, **10** в газовой фазе. Ионы с *m/z* 69 говорят о наличии в молекулах трифторметильной группы.

Электронные спектры пирролохинолонов **9**, **10** содержат три полосы поглощения в области 235, 273, 357 нм. Согласно квантово-химическим расчетам [6], коротковолновую полосу следует отнести к электронным переходам в пиррольном кольце, поглощение в области 273 нм – в пиридиноной части молекулы, длинноволновый максимум – π - π^* -переходам в бензольном цикле.

Следует отметить, что в отличие от линейных пирролохинолинов, полученных из енаминокетонатов [6], в УФ спектрах пирролохинолонов с таким же сочленением колец интенсивность полосы поглощения при 273 нм ниже, чем коротковолнового максимума, что, по-видимому, связано с некоторым ослаблением сопряжения в хинолоновом кольце.

Итак, кислотная циклизация амидов **5**, **6** протекает по положению 6 индола с образованием исключительно пирроло[2,3-*g*]хинолонов, в отличие от нефторированных аналогов (полученных из дикетена и аминокетидолов), которые в аналогичных условиях дают смесь продуктов линейного

и углового строения [7]. В отличие от них, образование пирроло[3,2-*f*]хинолонов с метильным и трифторметильным заместителями в *перу*-положении затруднено, вероятно, из-за больших стерических требований трифторметильной группы по сравнению с метильной. Эти затруднения не преодолеваются и при проведении циклизации в кипящем дифениле. Единственным продуктом реакции наряду со смолой и в этом случае является пирролохинолон линейного строения.

Наши предположения косвенно подтверждают данные проведенного квантово-химического полуэмпирического расчета молекул модельных изомерных пирролохинолинов **9**, **11–13** методом PM3 с использованием пакета программ Nupreg Chem 5.0.

Полученные результаты показывают (см. табл. 2), что расчетные теплоты образования (ΔH_f) угловых пирролохинолинов **11**, **13** больше, чем соответствующих изомеров **9**, **12** с линейным сочленением колец, причем разница в ΔH_f для изомерных молекул **12**, **13** с *перу*-метильными заместителями в два раза меньше, чем для систем **9**, **10**, где одним из *перу*-заместителей является группа CF₃ (7.59 ккал/моль по сравнению с 16.56 ккал/моль).

Т а б л и ц а 3

Физико-химические характеристики полученных соединений

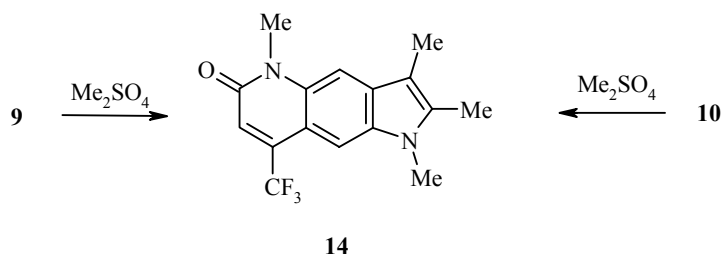
Со- еди- нение	Брутто- формула	Найдено, % Вычислено, %			Т. пл., °С	R _f *	Вы- ход, %
		С	Н	Н			
3	C ₁₆ H ₁₇ F ₃ N ₂ O ₂	<u>58.73</u>	<u>5.20</u>	<u>32.6</u>	76–77 (петро- лейный эфир)	0.16; 0.47 (А)	40
		58.89	5.25	32.6			
4	C ₁₇ H ₁₉ F ₃ N ₂ O ₂	<u>59.91</u>	<u>5.58</u>	<u>34.0</u>	67–68 (петро- лейный эфир)	0.38; 0.75 (А)	50
		59.99	5.63	34.0			
7	C ₁₄ H ₁₁ F ₃ N ₂ O	<u>59.87</u>	<u>3.92</u>	<u>28.0</u>	>300 (толуол)	0.40 (Б)	73
		60.00	3.96	28.0			
8	C ₁₅ H ₁₃ F ₃ N ₂ O	<u>61.14</u>	<u>4.56</u>	<u>29.4</u>	125–126 (толуол)	0.58 (Б)	85
		61.22	4.45	29.4			
9	C ₁₄ H ₁₁ F ₃ N ₂ O	<u>59.81</u>	<u>3.92</u>	<u>28.0</u>	295–297 (этанол)	0.44 (В)	61
		60.00	3.96	28.0			
10	C ₁₅ H ₁₃ F ₃ N ₂ O	<u>61.09</u>	<u>4.41</u>	<u>29.4</u>	>300 (этанол + ДМФА)	0.46 (Г)	83
		61.22	4.45	29.4			
14	C ₁₆ H ₁₅ F ₃ N ₂ O	<u>62.23</u>	<u>4.86</u>	<u>30.8</u>	239–240 (водный этанол)	0.67 (В)	78
		62.33	4.90	30.8			

* Системы растворителей: бензол (А); бензол–этилацетат, 3:1 (Б); 3:2 (В); 1:1 (Г).

Кроме этого, в гипотетической угловой системе **11** с трифторме-

тильным радикалом наблюдаются изменения в валентных углах атомов углерода пиридинового и пиррольного колец, связанных с *перу*-заместителями. Полученные нами результаты хорошо укладываются в рамки ранее сформулированной концепции о направлении формирования пирролохинолиновой системы на основе замещенных 5-аминоиндолов [8] и дополняют некоторые ее положения.

При исследовании поведения пиррохинолинов **9**, **10** в реакции метилирования диметилсульфатом в водном ацетоне в присутствии КОН мы обнаружили, что в одних и тех же условиях подвергаются метилированию как пирролохинолон **10**, уже имеющий одну метильную группу у пиррольного атома азота, так и соединение **9** с незамещенными атомами азота, с образованием одного и того же дважды метилированного соединения **14**. Образование продуктов монOMETИЛИРОВАНИЯ исключается условиями реакции: использованием избытка диметилсульфата, а также, по-видимому, одинаковой кислотностью групп N-H хинолона и пиррола. Последнее предположение подтверждается довольно близкими химическими сдвигами этих протонов в спектрах ЯМР ^1H .



Спектр ЯМР ^1H соединения **14** содержит сигналы четырех метильных групп, два из которых (N–CH₃) с очень близкими химическими сдвигами. Протоны бензольного кольца и 7-Н также проявляются тремя синглетами. В масс-спектре пирролохинолона **14** пик молекулярного иона также, как и у исходных пирролохинолонов **9**, **10**, является максимальным. УФ спектр соединения **14** характеризуется тремя полосами поглощения и практически идентичен таковым исходных пирролохинолонов **9**, **10**, что говорит об их одинаковом строении.

ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

Спектры ЯМР ^1H записаны на приборе Bruker DRX 500 (500 МГц) в ДМСО-*d*₆, внутренний стандарт ТМС. Масс-спектры получены на масс-спектрометре Finnigan MAT INCOS-50 с прямым вводом образца в ионный источник при энергии ионизации 70 эВ. Электронные спектры зарегистрированы на спектрофотометре Spexord в этаноле. Очистку продуктов реакции проводили методом колоночной хроматографии на Al₂O₃ (нейтральная, I и II ст. акт. по Брокману). Контроль за ходом реакции и чистотой полученных соединений осуществляли ТСХ на пластинках Silufol UV-254.

Физико-химические характеристики полученных соединений приведены в табл. 3. Получение исходных аминоиндолов **1**, **2** описано в работах [9, 10].

Этиловый эфир (Z)-3-[(2,3-диметил-1H-индолил-5)амино]-4,4,4-трифтор-2-бутеновой кислоты (3) и N-(2,3-диметил-1H-индолил-5)амид 4,4,4-трифтор-3-оксобутановой кислоты (5). Смесь 1.2 г (0.01 моль) аминоиндола **1** и 1.4 г (0.01 моль) этилового эфира 4,4,4-трифторацетоуксусной кислоты в 300 мл абсолютного бензола кипятят в присутствии каталитического количества ледяной уксусной кислоты 30 ч с насадкой Дина–Старка. После того, как весь аминоиндол вступил в реакцию (хроматографический контроль), объем реакционной смеси доводят отгонкой бензола до 50 мл. От следов енамина **3** избавляются пропусканием нагретого до кипения раствора в смеси гексана с бензолом через слой (2.5–3 см) оксида алюминия. Выход соединения **5** 1.4 г. Полученное соединение согласно данным хроматографического анализа не индивидуально. Суммарная интегральная интенсивность протонов в спектре ЯМР ¹H соответствует амидной структуре. Масс-спектр, вычислено: M = 298; найдено: M = 298 (масс-спектрометрически).

Этиловый эфир (E,Z)-3-[(1,2,3-триметил-1H-индолил-5)амино]-4,4,4-трифтор-2-бутеновой кислоты (4) и N-(1,2,3-триметил-1H-индолил-5)амид 4,4,4-трифтор-3-оксобутановой кислоты (6) получают и выделяют аналогично из 1.14 г (6.55 ммоль) аминоиндола **2** и 1.2 г (6.55 ммоль) трифторацетоуксусного эфира (25 ч). От следов енамина **4** избавляются аналогично. Выход соединения **6** 1.6 г. Суммарная интегральная интенсивность протонов в спектре ЯМР ¹H соответствует амидной структуре. Масс-спектр, вычислено: M = 312; найдено: M = 312 (масс-спектрометрически).

Этиловый эфир (Z)-3-[(2,3-диметил-1H-индолил-5)амино]-4,4,4-трифтор-2-бутеновой кислоты (3). Смесь 0.211 г (1.32 ммоль) аминоиндола **1** и 0.328 г (1.72 ммоль) трифторацетоуксусного эфира в абсолютном бензоле в присутствии каталитических количеств уксусной кислоты и водоотнимающего средства (прокаленного CaSO₄) перемешивают 90 сут при ~20 °С (хроматографический контроль). По окончании реакции раствор отфильтровывают от сульфата кальция, бензол упаривают. Очищают пропусканием нагретого до кипения раствора в петролейном эфире через слой (1 см) оксида алюминия. Выход 0.42 г.

Этиловый эфир (E,Z)-3-[(1,2,3-триметил-1H-индолил-5)амино]-4,4,4-трифтор-2-бутеновой кислоты (4) получают и очищают аналогично из 0.515 г (2.96 ммоль) аминоиндола **2** и 0.7 г (3.8 ммоль) трифторацетоуксусного эфира (80 сут). Выход 0.508 г.

1,2-Диметил-7-трифторметил-6,9-дигидро-3H-пирроло[3,2-f]хинолин-9-он (7) получают из 0.296 г (0.91 ммоль) енамина **3**, нагревая в кипящем дифениле 25 мин. По окончании реакции (хроматографический контроль) еще теплую реакционную массу выливают в петролейный эфир. Выпавший осадок отфильтровывают и многократно промывают горячим петролейным эфиром от дифенила. Перекристаллизовывают из толуола. Выход 0.186 г.

1,2,3-Триметил-7-трифторметил-6,9-дигидро-3H-пирроло[3,2-f]хинолин-9-он (8) получают аналогично из 0.48 г (1.4 ммоль) енамина **4** (20 мин). Перекристаллизовывают из толуола. Выход 0.355 г.

2,3-Диметил-8-трифторметил-5,6-дигидро-1H-пирроло[2,3-g]хинолин-6-он (9) получают из 1.4 г (4.7 ммоль) амида **5** нагреванием в десятикратном избытке трифторуксусной кислоты 1 ч. По окончании реакции (хроматографический контроль) реакционную массу выливают в 12% водный аммиак со льдом. Выпавший осадок отфильтровывают, многократно промывают водой. Сушат на воздухе. Перекристаллизовывают из спирта с активированным углем. Выход 0.81 г.

1,2,3-Триметил-8-трифторметил-5,6-дигидро-1H-пирроло[2,3-g]хинолин-6-он (10) получают аналогично из 1.6 г (5.13 ммоль) амида **6** (1 ч). Перекристаллизовывают из спирта с ДМФА. Выход 0.97 г.

1,2,3,5-Тетраметил-8-трифторметил-5,6-дигидро-1H-пирроло[2,3-g]хинолин-6-он (14). Исходный пирролохинолон растворяют в водном бутаноне-2, добавляют десятикратный избыток диметилсульфата и КОН. Реакционную смесь кипятят до окончания реакции (хроматографический контроль) и выливают в воду. Выпавший осадок отфильтровывают, промывают многократно водой. Сушат на воздухе.

А. Из 0.46 г (6.3 ммоль) пирролохинолона **9** (1.5 ч). Выход 0.392 г.

Б. Из 0.5 г (1.7 ммоль) пирролохинолона **10** (3 ч). Выход 0.1 г.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. С. А. Ямашкин, Г. А. Романова, И. С. Романова, М. А. Юровская, *ХГС*, 1354 (2003).
2. С. А. Ямашкин, Г. А. Романова, И. С. Романова, М. А. Юровская, *ХГС*, 1202 (2003).
3. С. А. Ямашкин, Г. А. Романова, М. А. Юровская, *Вестн. МГУ, Сер. 2, Химия*, **45**, 6 (2004).
4. С. А. Ямашкин, Г. А. Романова, М. А. Юровская, *Вестн. МГУ, Сер. 2, Химия*, **45**, 12 (2004).
5. С. А. Ямашкин, Л. Г. Юдин, А. Н. Кост, *ХГС*, 1570 (1981).
6. С. А. Ямашкин, О. Б. Томилин, О. В. Бояркина, *ХГС*, 1525 (2003).
7. С. А. Ямашкин, Л. Г. Юдин, А. Н. Кост, *ХГС*, 493 (1983).
8. С. А. Ямашкин, И. В. Трушков, О. Б. Томилин, И. И. Терехин, М. А. Юровская, *ХГС*, 1223 (1998).
9. Z. J. Veidelek, *Collect. Chem. Commun.*, **22**, 1852 (1957).
10. В. Е. Shaw, D. W. Woolley, *J. Am. Chem. Soc.*, **75**, 1877 (1953).

Мордовский государственный университет
им Н. П. Огарева, Саранск 430000, Россия
e-mail: biotech@moris.ru

Поступило в редакцию 24.05.2004

^aМордовский государственный педагогический
институт им. М. Е. Евсевьева,
Саранск 430007, Россия
e-mail: mgpi@si.moris.ru