

Н. М. Пржевальский, Н. С. Скворцова, И. В. Магедов

СИНТЕЗ 1-, 5- И 7-ЗАМЕЩЕННЫХ
3-(N-АЦИЛАМИНО)-2-ФЕНИЛИНДОЛОВ ПО ФИШЕРУ

Взаимодействием арилгидразинов с ω -(N-ациламино)ацетофенонами получены арилгидразоны, которые циклизацией по Фишеру превращены в 3-(N-ациламино)-2-фенилиндолы с заместителями в положениях 1, 5, 6 и 7.

Ключевые слова: арилгидразины, арилгидразоны, 3-(N-ациламино)-индолы.

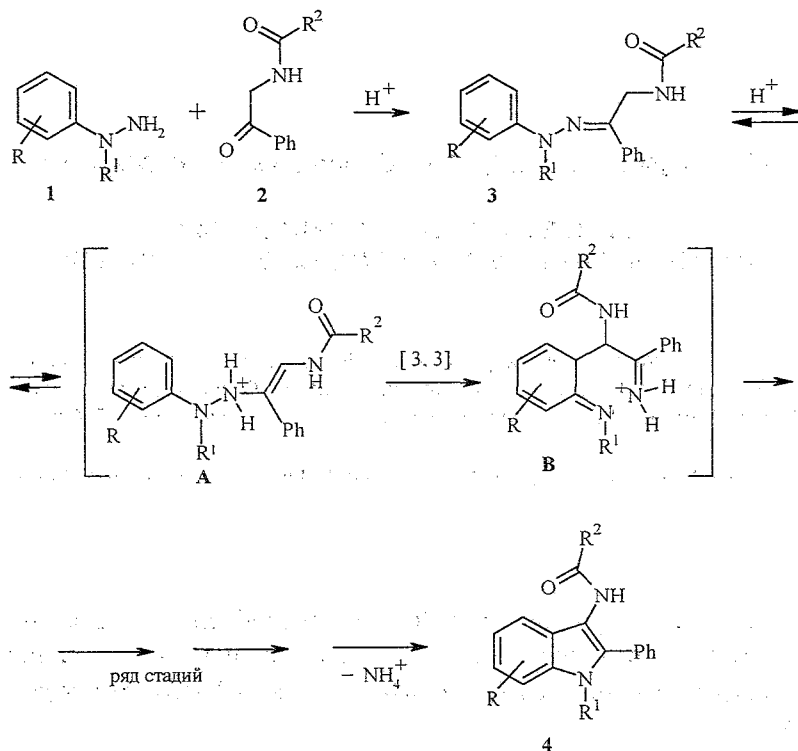
Ранее [1] описан разработанный нами способ синтеза 2-фенил-3-(N-ациламино)индолов циклизацией по Фишеру, получаемых из арилгидразинов **1** и ациламинокетонов **2** фенилгидразонов ω -(N-ациламино)ацетофенонов **3**.

Известно, что заместители различной электронной природы, находящиеся в бензольном ядре или у атома азота арилгидразонов, не оказывают решающего влияния на процесс [3,3]-сигматропной перегруппировки енгидразинов $A \rightarrow B$ (см. схему) в индолы [2–5]. Вместе с тем, как правило, электронодонорные группы ускоряют, а электроноакцепторные — замедляют процесс индолизации [2, 5].

Мы исследовали электронное и стерическое влияние заместителей в бензольном кольце ($R = MeO, Me, Cl, F, NO_2$) и при атоме азота ($R^1 = Me, CH_2Ph, Ph$) арилгидразонов ω -(N-ациламино)ацетофенонов **3** на выход 2-фенил-3-(N-ациламино)индолов **4**.

Как было показано ранее [1], N-ацильный заместитель R^2CO в фенилгидразонах **3** ($R, R^1 = H$) существенно влияет на выход индолов **4**, который изменяется в пределах от 16 до 83%. Поэтому, изучая воздействие заместителей R и R^1 в арилгидразонах **3** на протекание реакции индолизации, мы сравнивали выход N-ациламиноиндола **4** с выходом соответствующего незамещенного в положениях 1, 5 и 7 3-(N-ациламино)-2-фенилиндола **4**, $R = R^1 = H$ (табл. 1), причем все индолы были получены в одинаковых условиях.

В общем случае введение заместителей в бензольное кольцо арилгидразонов **3** уменьшает выходы N-ациламиноиндолов **4**. Снижение выхода незначительно для индолов с такими заместителями, как $R = 5-Me, 5-MeO, 5-F$. Гораздо заметнее снижение выхода (более чем в 2 раза) для 5-хлорзамещенного индола **4I**. Наличие сильного электроноакцепторного заместителя $R = 4-NO_2$ в арилгидразоне **3m** не позволило нам превратить его в 5-нитро-3-(N-ациламино)индол.



Образующиеся в процессе реакции индолизации *N*-ациламиноиндолы **4** содержат объемные заместители в положениях 2 и 3, поэтому можно было ожидать, что дополнительные стерические факторы будут существенно влиять на ход реакции. Действительно, использование *N*-замещенных арилгидразонов **3** ($\text{R} = \text{Me}, \text{CH}_2\text{Ph}, \text{Ph}$) резко уменьшает выход индолов **4**. Такое же влияние оказывает введение *орто*-заместителя в фенильное кольцо арилгидразона **3c** ($\text{R} = 2\text{-Me}$) на выход индола **4c**, что согласуется с данными [3, 5].

При индолизации арилгидразона **3d** ($\text{R} = 3,4\text{-Me}_2$) возможно образование изомерных 5,6-диметил- и 4,5-диметил-3-(*N*-ациламино)индолов (**4d** и **4d'** соответственно). Мы предполагали, что из-за стерических факторов будет образовываться преимущественно 5,6-дизамещенный **4d**, а не 4,5-дизамещенный 3-(*N*-ациламино)индол **4d'** (четыре заместителя подряд в бензольном кольце). Однако в результате реакции была получена смесь 1:1 (по данным ЯМР ^1H) индолов **4d** и **4d'** с более низким выходом по сравнению с незамещенным индолом.

В целом влияние заместителей на реакцию образования 3-(*N*-ациламино)индолов совпадает с наблюдавшимся для других вариантов индолизации [3–5].

Полученные в настоящей работе данные позволяют оценить предложенный метод как перспективный для синтеза производных 3-аминоиндолов.

Характеристики синтезированных соединений 4

Со- еди- не- ние	-1H-индол	R	R ¹	R ²	Брутто- формула	Найдено, %			Т. пл., °C	Выход, % *
						Вычислено, %				
						C	H	N		
4a	5-Метил-2-фенил-3-(4-хлорбензоиламино)-	5-Me	H	4-ClC ₆ H ₄	C ₂₂ H ₁₇ ClN ₂ O	<u>73.18</u> 73.23	<u>4.74</u> 4.75	<u>7.69</u> 7.76	167-168	26 (33)
4b	3-(2-Бромбензоиламино)-5-метил-2-фенил-	5-Me	H	2-BrC ₆ H ₄	C ₂₂ H ₁₇ BrN ₂ O	<u>65.42</u> 65.20	<u>4.15</u> 4.23	<u>6.62</u> 6.91	200-201	41
4c	7-Метил-3-[5-метил-(2-хлорфенил)- 4-изоксазолкарбониламино]-2-фенил-	7-Me	H	5-Метил-3-(2-хлорфе- нил)-4-изоксазол	C ₂₆ H ₂₀ ClN ₃ O ₂	<u>70.56</u> 70.67	<u>4.60</u> 4.56	<u>9.37</u> 9.51	242-243	30 (62)
4d	5,6-Диметил-3-[5-метил-(2-хлорфенил)- 4-изоксазолкарбониламино]-2-фенил-	5-Me 6-Me	H	5-Метил-3-(2-хлорфе- нил)-4-изоксазол	C ₂₇ H ₂₂ ClN ₃ O ₂	<u>71.24</u> 71.13	<u>4.80</u> 4.86	<u>9.17</u> 9.22	257-258	28 (62)
4d'	4,5-Диметил-3-[5-метил-(2-хлорфенил)- 4-изоксазолкарбониламино]-2-фенил-	4-Me 5-Me	H	5-Метил-3-(2-хлорфе- нил)-4-изоксазол						
4e	(5-Метокси-2-фенил-3-(4-хлорбензоил- амино)-	5-OMe	H	4-ClC ₆ H ₄	C ₂₂ H ₁₇ ClN ₂ O ₂	<u>70.24</u> 70.12	<u>4.61</u> 4.55	<u>7.43</u> 7.29	140-141	32 (33)
4f	3-Бензилтиоацетиламино-5-метокси-2- фенил-	5-OMe	H	PhCH ₂ SCH ₂	C ₂₄ H ₂₂ N ₂ O ₂ S	<u>71.28</u> 71.62	<u>5.36</u> 5.51	<u>7.09</u> 6.96	130-131	30 (44)
4g	1-Метил-2-фенил-3-(4-хлорбензоиламино)-	H	Me	4-ClC ₆ H ₄	C ₂₂ H ₁₇ ClN ₂ O	<u>73.04</u> 73.23	<u>4.80</u> 4.75	<u>7.72</u> 7.76	180-181	22 (33)
4h	[5-Метил-3-(2-хлорфенил)-4-изоксазо- лилкарбониламино]-1,2-дифенил-	H	Ph	5-Метил-3-(2-хлорфенил)- 4-изоксазол	C ₃₁ H ₂₂ ClN ₃ O ₂	<u>73.78</u> 73.88	<u>4.32</u> 4.40	<u>8.12</u> 8.34	125-126	27 (62)
4i	1-Бензил-3-[5-метил-3-(2-хлорфенил)- изоксазолкарбониламино]-2-фенил-	H	PhCH ₂	5-Метил-3-(2-хлорфе- нил)-4-изоксазол	C ₃₂ H ₂₄ ClN ₃ O ₂	<u>73.98</u> 74.20	<u>4.62</u> 4.67	<u>7.94</u> 8.11	78-79	26 (62)
4j	1-Бензил-2-фенил-3-(2-фуриламино)-	H	PhCH ₂	2-Фурил	C ₂₆ H ₂₀ N ₂ O ₂	<u>79.28</u> 79.57	<u>5.05</u> 5.14	<u>6.86</u> 7.14	134-135	34
4k	3-Бензоиламино-2-фенил-5-(фтор-)	5-F	H	Ph	C ₂₁ H ₁₅ FN ₂ O	<u>76.22</u> 76.35	<u>4.62</u> 4.58	<u>8.39</u> 8.48	100-101	44 (52)
4l	3-(2-Оксо-2H-3-хроменилкарбонил- амино)-2-фенил-5-хлор-	5-Cl	H	3-Кумаринил	C ₂₄ H ₁₅ ClN ₂ O ₃	<u>69.39</u> 69.49	<u>3.67</u> 3.64	<u>6.50</u> 6.75	220-221	38 (83)

* В скобках приведены выходы соответствующих не замещенных в положениях 1, 5, 7-3-ациламино-2-фенилиндолов 4, R = R¹ = H [1].

Спектры ЯМР ^1H соединений 4

Со- еди- не- ние	Химические сдвиги, δ , м. д. (КССВ, J , Гц)*					
	Индольный цикл	2-Фенил	R ²	R ¹	R	NH, уш. с.
4a	7.33 (1H, д, $J = 8.8$, H-7); 7.24 (1H, с, H-4); 7.04 (1H, д, $J = 8.8$, H-6)	7.72 (2H, д, $J = 8.0$, H-2, H-6); 7.44 (2H, м, H-3, H-5); 7.34 (1H, м, H-4)	7.95 (2H, д, $J = 7.9$, H-2, H-6); 7.54 (2H, д, $J = 7.9$, H-3, H-5)	8.49 (1H, с)	2.40 (3H, с, CH ₃)	10.55
4b	7.43 (1H, с, H-4); 7.35 (1H, м, H-7); 7.06 (1H, д, $J = 7.6$, H-6)	7.82 (2H, д, $J = 6.6$, H-2, H-6); 7.51 (2H, м, H-3, H-5); 7.40 (1H, м, H-4)	7.72 (1H, д, $J = 7.6$, H-5); 7.64 (1H, д, $J = 7.3$, H-3); 7.50–7.40 (2H, м, H-4, H-5)	8.22 (1H, с)	2.45 (3H, с, CH ₃)	9.55
4c	7.19 (1H, т, $J = 7.3$, H-5); 6.99 (2H, д, $J = 7.3$, H-4, H-6)	7.65–7.46 (9H, м, C ₆ H ₅ , H-3, H-4, H-5, H-6)		9.50 (1H, с)	2.70 (3H, с, CH ₃)	10.98
4d	7.14 (1H, с, H-4); 7.01 (1H, с, H-7)	2.51 (3H, с, CH ₃)				
4d'	7.08 (1H, д, $J = 8.4$, H-6); 6.90 (1H, д, $J = 8.4$, H-7)	7.71–7.33 (18H, м, H аром.)		9.56 (1H, с); 9.42 (1H, с)	2.73 (3H, с, CH ₃); 2.67 (3H, с, CH ₃); 2.31 (6H, с, CH ₃); 2.26 (3H, с, CH ₃); 2.24 (3H, с, CH ₃)	11.20; 11.07
4e	7.34 (1H, д, $J = 8.2$, H-7); 6.92 (1H, д, $J = 2.2$, H-4); 6.83 (1H, д, $J = 8.2$, $J = 2.2$, H-6)	7.71 (2H, д, $J = 8.2$, H-2, H-6); 7.42 (3H, м, H-3, H-4, H-5)	7.97 (2H, д, $J = 8.8$, H-2, H-6); 7.55 (2H, д, $J = 8.8$, H-3, H-5)	8.53 (1H, с)	3.77 (3H, с, OCH ₃)	9.57

4f	7.30 (1H, д, $J = 2.2$, H-4); 6.91 (1H, д, $J = 8.7$, H-7); 6.83 (1H, д, $J = 8.7$, H-6)	7.94 (2H, д, $J = 8.7$, H-2, H-2); 7.47 (2H, д, $J = 8.7$, H-3, H-5); 7.30 (1H, м, H-4)	8.00 (2H, д, $J = 8.2$, H-3, H-5); 7.67 (1H, м, H-4); 7.53 (2H, д, $J = 8.2$, H-2, H-6); 3.89 (2H, с, CH ₂ -CO); 3.30 (2H, с, CH ₂ -C ₆ H ₅)	8.22 (1H, с)	3.79 (3H, с, OCH ₃)	9.53
4g	7.28 (1H, д, д, $J = 7.1$, $J = 8.0$, H-5); 7.13 (1H, д, д, $J = 7.1$, $J = 7.7$, H-6)	7.53–7.45 (9H, м, Н инд., Н аром.)	7.83 (2H, д, $J = 7.6$, H-2, H-6)	3.71 (3H, с, CH ₃)	—	8.35
4h		7.52–7.17 (18H, м, Н инд., Н аром.)			—	7.70
4i	7.40 (1H, м, H-4); 7.17 (1H, д, д, $J = 7.1$, $J = 8.0$, H-6); 7.10 (1H, д, д, $J = 7.1$, $J = 7.3$, H-5)	7.40–7.30 (5H, м, C ₆ H ₅)	7.40–7.30 (4H, м, H-3, H-4, H-5, H-6); 2.57 (3H, с, CH ₃)	7.19–7.20 (3H, м, H-3, H-4, H-5); 6.85 (2H, д, $J = 7.5$, H-2, H-6); 5.32 (2H, с, CH ₂)	—	7.60
4j	7.50–7.35 (9H, м, Н инд., Н аром.)		7.09 (1H, д, $J = 3.4$, H-3); 7.06 (1H, д, $J = 1.7$, H-5); 6.58 (1H, д, $J = 3.4$, $J = 1.7$, H-4)	7.20 (3H, м, H-3, H-4, H-5); 6.90 (2H, д, $J = 7.8$, H-2, H-6); 5.38 (2H, с, CH ₂)	—	8.30
4k	7.45 (1H, м, H-7); 7.17 (1H, д, д, $J_{H-F} = 9.9$, $J = 2.5$, H-4); 6.98 (1H, д, д, д, $J_{H-F} = 10.2$, $J = 9.0$, $J = 2.5$, H-6)	7.74 (2H, д, $J = 7.8$, H-2, H-6); 7.60–7.50 (3H, м, H-3, H-4, H-5)	7.97 (2H, д, $J = 7.8$, H-2, H-6); 7.60 (2H, м, H-3, H-5); 7.50 (1H, м, H-4)	8.52 (1H, с)	—	9.75
4l	7.50 (1H, м, H-4); 7.43 (1H, д, $J = 9.2$, H-7); 7.18 (1H, д, $J = 9.2$, H-6)	7.76 (2H, д, $J = 7.8$, H-2, H-6); 7.48 (2H, м, H-3, H-5); 7.38 (1H, м, H-4)	8.98 (1H, с, H-4); 7.89 (1H, д, $J = 8.3$, H-8); 7.80–7.65 (3H, м, H-5, H-6, H-7)	9.84 (1H, с)	—	10.32

* Спектр соединения 4d' снят в ДМСО-d₆.

ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

Спектры ЯМР ^1H соединений **3** и **4** записаны на приборе Bruker WM-250 (250 МГц) в CD_3CN . Контроль за ходом реакций осуществлялся методом ТСХ на пластинах Silufol в системе $\text{CCl}_4\text{-EtOAc}$, 6:1.

Использованы коммерческие *N*-(4-метилфенил)-, *N*-(2-метилфенил)-, *N*-(3,4-диметилфенил)-, *N*-метил-*N*-фенил-, *N,N*-дифенил-, *N*-бензил-*N*-фенил-, *N*-(4-фторфенил)-, *N*-(4-хлорфенил)- и *N*-(4-нитрофенил)гидразины фирм Lancaster и Aldrich. Натриевая соль 2-(4-метоксифенил)гидразинсульфокислоты синтезирована по методике [6].

Константы и выходы синтезированных аминоиндолов **4** приведены в табл. 1, спектры ЯМР ^1H — в табл. 2.

Общая методика синтеза ω -(*N*-ациламино)ацетофенонов **2**, их константы и физико-химические характеристики приведены в работе [1].

Общая методика получения арилгидразонов 3. Смесь 0.05 моль гидрохлорида гидразина **1**, 0.05 моль ациламинокетона **2** и 0.05 моль AcONa в минимальном объеме EtOH (5–10 мл) кипятят с обратным холодильником 2 ч. Образовавшийся осадок NaCl отфильтровывают от горячего раствора. Фильтрат упаривают, оставшееся масло кристаллизуют (гидразоны **3a,c,d,k,m**), либо без дальнейшей очистки перегруппировывают в аминоиндолы **4** (гидразоны **3b,e,f,h,i,j,l**).

4-Метилфенилгидразон ω -(4-хлорбензоиламино)ацетофенона (3a, R = 4-Me, R¹ = H, R² = 4-ClC₆H₄). Выход 66%. Т. пл. 86–85 °С (EtOH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (*J*, Гц): 9.53 (1H, с, NH); 7.78 (2H, д, *J* = 8.4, C₆H₄-Cl-*p*, *o*- и *o'*-H); 7.58 (2H, д, *J* = 8.4, C₆H₄-Cl-*p*, *m*- и *m'*-H); 7.50 (2H, д, *J* = 6.6, N-C₆H₄-CH₃-*p*, *o*- и *o'*-H); 7.49–7.35 (5H, м, C₆H₅-C=N); 7.20 (1H, уш. с, NH-C=O); 7.01 (2H, д, *J* = 8.4, N-C₆H₄-CH₃-*p*, *m*- и *m'*-H); 4.46 (2H, д, *J* = 6.2, CH₂); 2.17 (3H, с, CH₃). Найдено, %: С 69.86; Н 5.37; N 11.26. C₂₂H₂₀ClN₂O. Вычислено, %: С 69.93; Н 5.33; N 11.12.

2-Метилфенилгидразон ω -[5-метил-3-(2-хлорфенил)изоксазол-4-карбониламино]-ацетофенона (3c, R = 2-Me, R¹ = H, R² = 5-метил-3-(2-хлорфенил)-4-изоксазол). Выход 60%. Т. пл. 90–91 °С (*i*-PrOH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (*J*, Гц): 9.51 (1H, с, NH); 7.68 (2H, д, *J* = 6.9, C₆H₅-C=N, *o*- и *o'*-H); 7.53 (1H, д, *J* = 8.3, C₆H₄-Cl-*o*, *m*-H); 7.40–7.35 (7H, м, СН аром.); 7.16 (1H, м, C₆H₄-Cl-*o*, *p*-H); 7.14 (2H, д, *J* = 8.3, C₆H₄-Cl-*o*, *o'*-H); 6.79 (1H, м, C₆H₄-Cl-*o*, *m'*-H); 6.73 (1H, уш. с, NH-C=O); 4.47 (2H, д, *J* = 6.1, CH₂); 2.63 (3H, с, CH₃-изоксазол.); 2.21 (3H, с, CH₃-Ph). Найдено, %: С 68.11; Н 5.02; N 12.38. C₂₆H₂₃ClN₄O₂. Вычислено, %: С 68.04; Н 5.05; N 12.21.

3,4-Диметилфенилгидразон ω -[5-метил-3-(2-хлорфенил)изоксазол-4-карбониламино]-ацетофенона (3d, R = 3,4-Me₂, R¹ = H, R² = 5-метил-3-(2-хлорфенил)-4-изоксазол). Выход 70%. Т. пл. 115–116 °С (EtOH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (*J*, Гц): 9.54 (1H, с, NH); 7.67 (2H, д, *J* = 8.1, C₆H₅-C=N, *o*- и *o'*-H); 7.46 (1H, м, C₆H₄-Cl-*o*, *o'*-H); 7.40–7.30 (5H, м, СН аром.); 7.20 (1H, д, *J* = 8.1, C₆H₄-Cl-*o*, *m*-H); 7.00 (1H, д, *J* = 8.5, N-C₆H₃-Me₂, *m'*-H); 6.86 (1H, с, N-C₆H₃-Me₂, *o*-H); 6.84 (1H, д, *J* = 8.5, N-C₆H₃-Me₂, *o'*-H-5); 6.76 (1H, уш. с, NH-C=O); 4.42 (2H, д, *J* = 6.4, CH₂); 2.64 (3H, с, CH₃-изоксазол.); 2.23 (3H, с, CH₃-Ph); 2.19 (3H, с, CH₃-Ph). Найдено, %: С 68.65; Н 5.30; N 12.01. C₂₇H₂₅ClN₄O₂. Вычислено, %: С 68.57; Н 5.33; N 11.85.

4-Фторфенилгидразон ω -(бензоиламино)ацетофенона (3k, R = 4-F, R¹ = H, R² = Ph). Выход 56%. Т. пл. 168–169 °С (EtOH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (*J*, Гц): 10.20 (1H, с, NH); 7.91 (2H, д, *J* = 7.5, CO-C₆H₅, *o*- и *o'*-H); 7.83 (2H, д, *J* = 7.5, C₆H₅-C=N, *o*- и *o*-H); 7.74 (1H, уш. с, NH-C=O); 7.55 (1H, м, CO-C₆H₅, *p*-H); 7.45–7.42 (4H, м, C₆H₅-C=N, *m*- и *m'*-H, CO-C₆H₅, *m*- и *m'*-H); 7.32 (1H, д, *J* = 6.9, C₆H₅-C=N, *p*-H); 7.21 (2H, д, *J* = 8.5, N-C₆H₄-F-*p*, *o*- и *o'*-H); 7.03 (2H, м, N-C₆H₄-F-*p*, *m*- и *m'*-H); 4.61 (2H, д, *J* = 6.3, CH₂). Найдено, %: С 72.28; Н 5.20; N 11.96. C₂₁H₁₈FN₂O. Вычислено, %: С 72.61; Н 5.22; N 12.10.

4-Нитрофенилгидразон ω -[3,4-диметоксифенил]ацетиламино]ацетофенона (3m, R = 4-NO₂, R¹ = H, R² = 3,4-(MeO)₂C₆H₃CH₂). Выход 70%. Т. пл. 168–169 °С (*i*-PrOH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (*J*, Гц): 10.79 (1H, с, NH); 8.12 (2H, д, *J* = 8.80, N-C₆H₄-NO₂-*p*, *m*- и *m'*-H); 7.87 (2H, д, *J* = 8.25, C₆H₅-C=N, *o*- и *o'*-H); 7.40 (4H, м, C₆H₅-C=N, *m*-, *m'*- и *p*-H, NH-C=O); 7.16 (2H, д, *J* = 8.80, N-C₆H₄-NO₂-*p*, *o*- и *o'*-H); 6.78 (3H, м, CH₂-C₆H₃-(OMe)₂); 4.42 (2H, д, *J* = 6.05, CH₂); 3.72 (3H, с, OCH₃); 3.65 (3H, с, OCH₃); 3.54 (2H, с, CO-CH₂). Найдено, %: С 64.72; Н 5.46; N 12.40. C₂₄H₂₄N₄O₅. Вычислено, %: С 64.28; Н 5.39; N 12.49.

Получение индолов 4. А. К раствору 0.03 моль гидразона **3** в 10 мл EtOH добавляют раствор 0.09 моль тионилхлорида в 10 мл EtOH и смесь кипятят с обратным холодильником 4 ч. Образовавшийся NH₄Cl отфильтровывают. Спирт упаривают, остаток кристаллизуют, либо выделяют индолы **4a–d, g–m** колоночной хроматографией (силикагель L 100×250 мкм, элюент CCl₄–EtOAc, 6:1).

Б. К раствору 0.04 моль натриевой соли 2-(4-метоксифенил)гидразинсульфокислоты и 0.03 моль ω-(4-хлорбензоиламино)ацетофенона или ω-(бензилгиоацетиламино)ацетофенона в 10 мл EtOH добавляют раствор 0.09 моль тионилхлорида в 10 мл EtOH и кипятят смесь с обратным холодильником в течение 8 ч. Образовавшийся осадок отфильтровывают. Спирт отгоняют, индолы **4e, f** выделяют колоночной хроматографией (условия те же, что при получении индолов из гидразонов). Затем перекристаллизовывают полученное масло из *i*-PrOH.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Н. М. Пржевальский, Н. С. Скворцова, И. В. Магедов, *XTC*, 1210 (2002).
2. Н. М. Пржевальский, Л. Ю. Костромина, И. И. Грандберг, *XTC*, 867 (1988).
3. D. L. Hughes, *Org. Prep. and Proced. Int.*, **25**, 607 (1993).
4. R. J. Sundberg, *Indoles*, Acad. Press, 1996.
5. В. Robinson, *The Fischer Indole Synthesis*, J. Wiley and Sons, New York, 1982.
6. J. Altschul, *Ber.*, **25**, 1842 (1892).

Московская сельскохозяйственная
академия им. К. А. Тимирязева,
Москва 127550, Россия
e-mail: ibs@ibisc.msk.ru.

Поступило в редакцию 28.12.2001
После доработки 25.07.2002