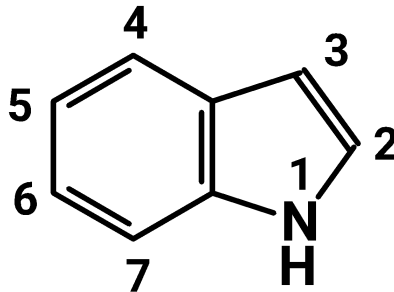


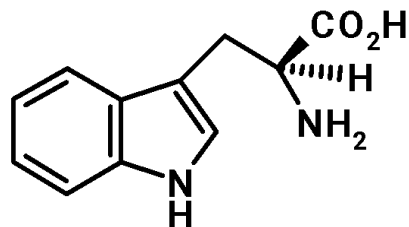
# Конденсированные пятичленные гетероциклы с одним гетероатомом

## Индол

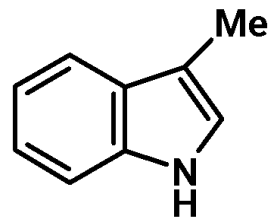


1. Аннелирование пиррольного цикла
2. Аннелирование бензольного цикла
3. Одновременное образование пиррольного и бензольного циклов

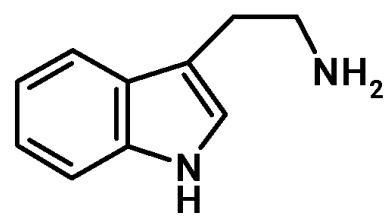
# Производные индола в природе



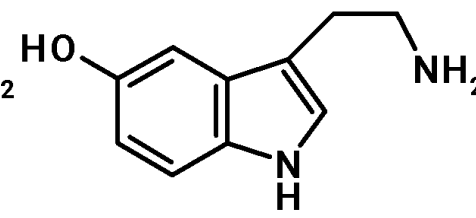
триптофан



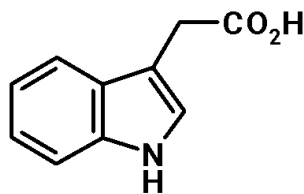
3-метилиндол (скатол)



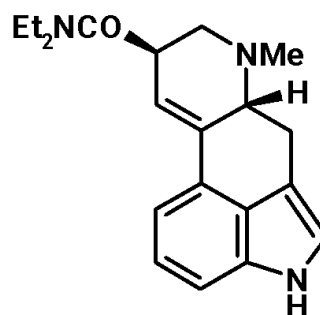
триптамин



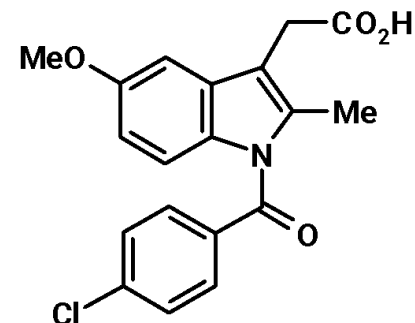
серотонин



$\beta$ -индолилуксусная кислота

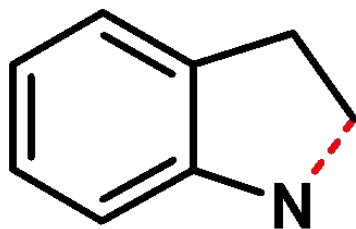


диэтиламид лизергиновой кислоты  
ЛСД

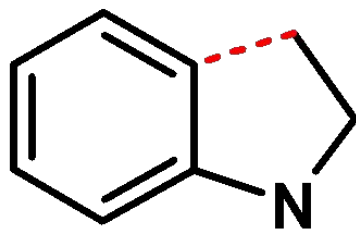


индометацин -  
противовоспалительный препарат

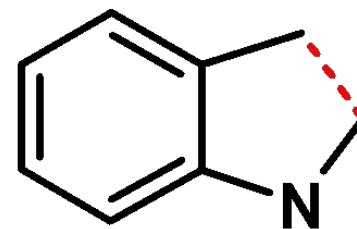
## Типы образующихся связей



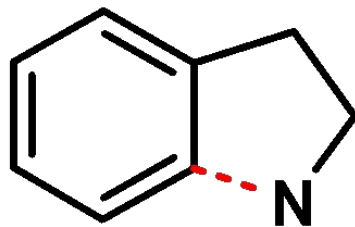
$C_{(2)}-N$



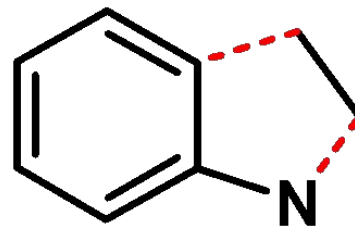
$C_{(3)}-C_{(3a)}$



$C_{(2)}-C_{(3)}$



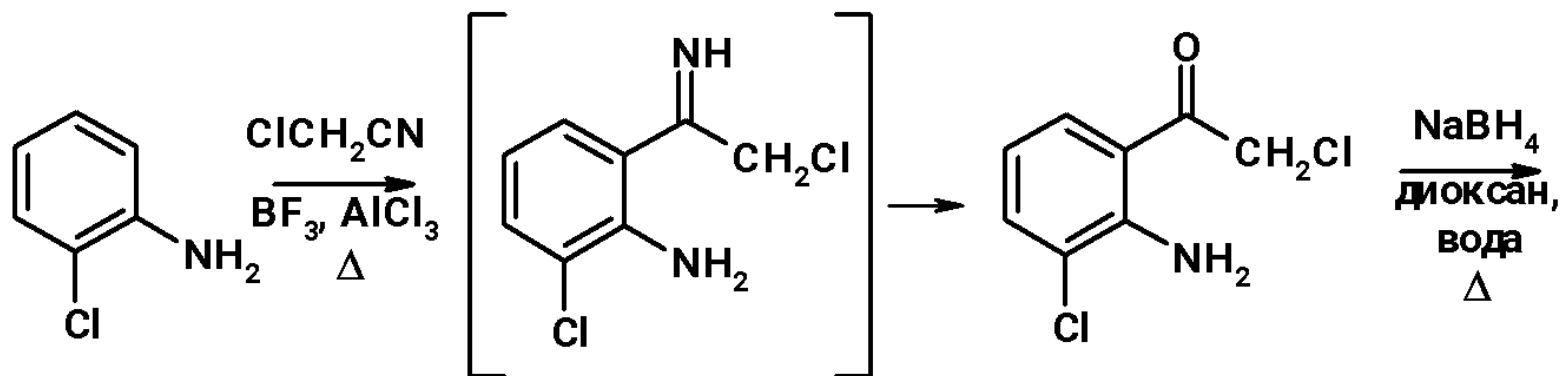
$C_{(7a)}-N$



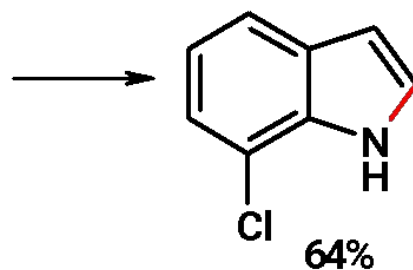
$C_{(3)}-C_{(3a)} + C_{(2)}-N$

# Образование связи C<sub>(2)</sub>-N

Циклизация о-(хлорацетил)ариламинов (синтез Сугасава)

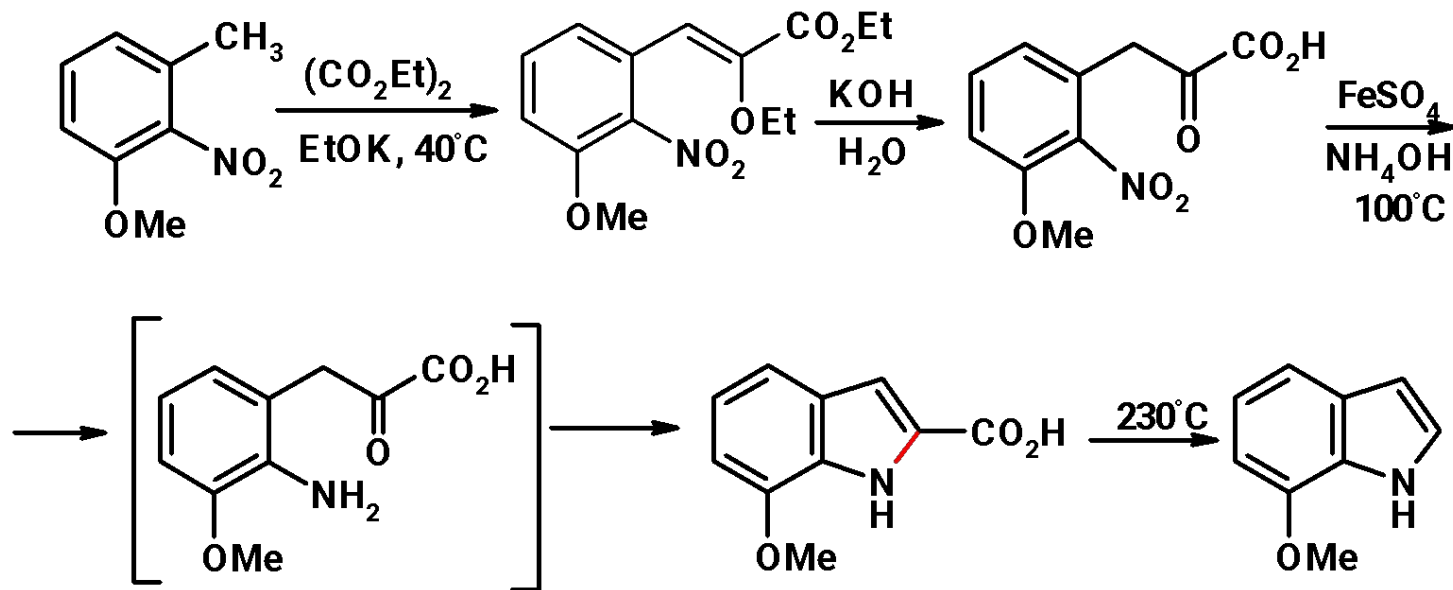


Реакция Губена-Гёша

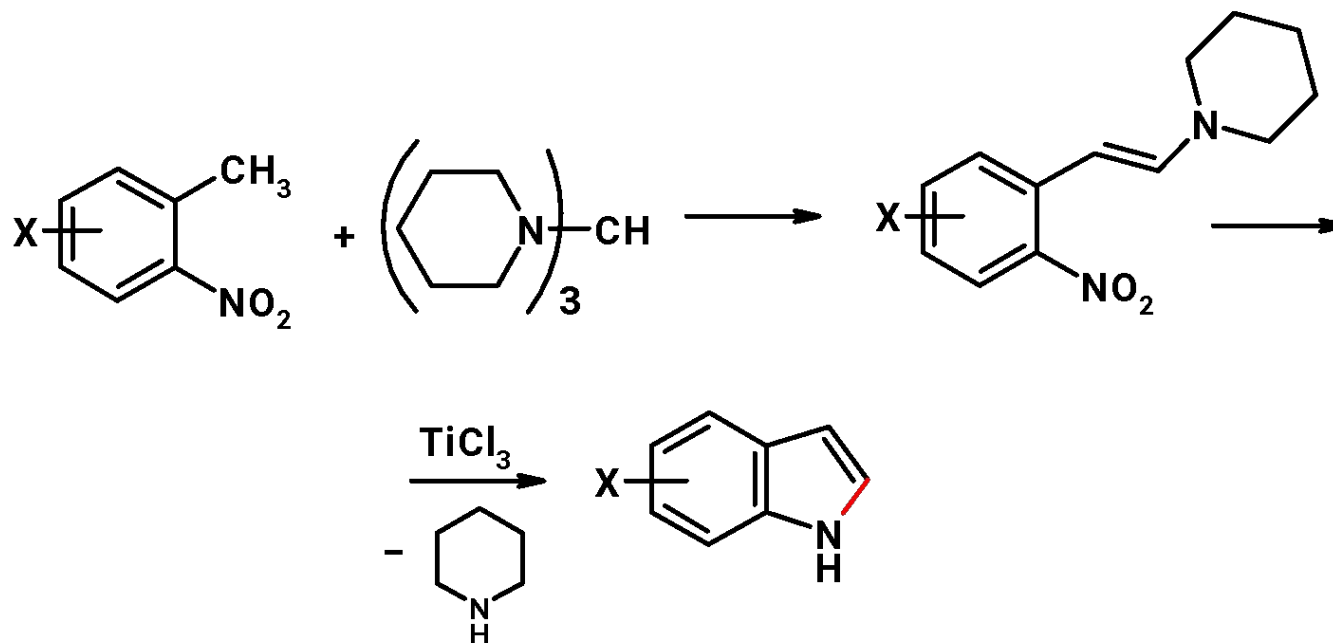


*Synth. Commun.*, 18, 265 (1988)

# Синтез индолов по Рейсерту (восстановительная конденсация о-нитрофенилпировиноградной кислоты)



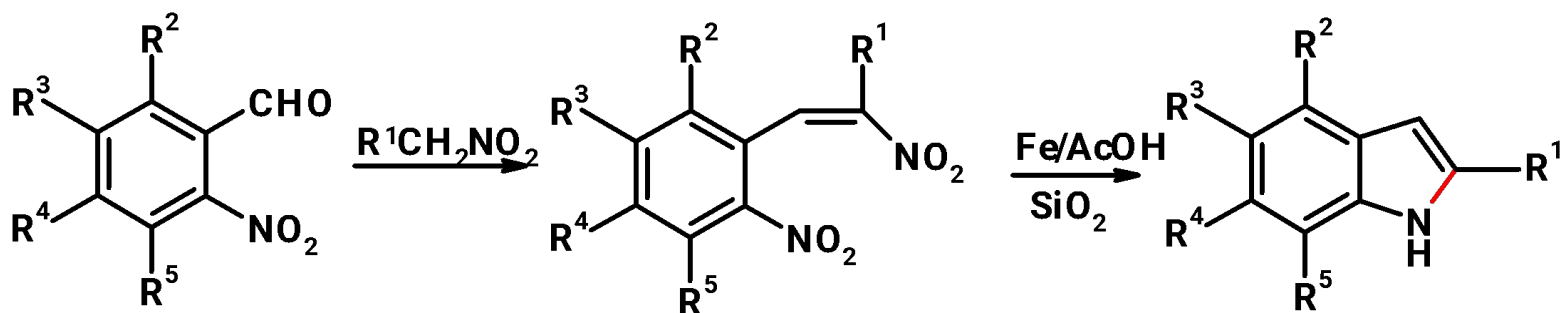
## Модификация метода



*Tetrah. Lett.*, 24, 4561 (1983)

*Tetrah. Lett.*, 25, 285 (1984)

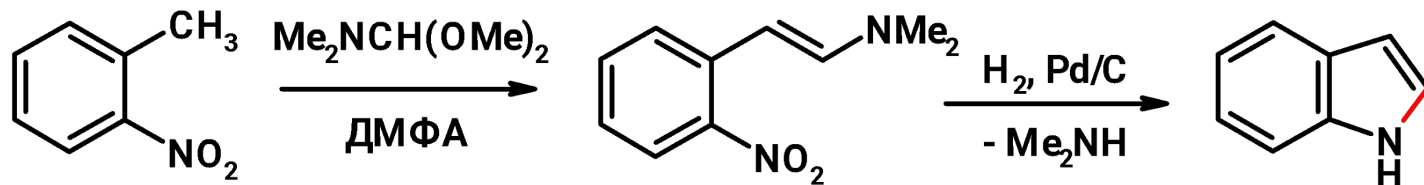
## Восстановительная циклизация 2,β-нитростирола



Реакция Анри

R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = Me, H, R<sup>3</sup> = OMe, OBz, R<sup>4</sup> = OMe, OBz, H, R<sup>5</sup> = H, Me, OMe, OBz  
*J.Org.Chem.*, 48, 3347 (1983)

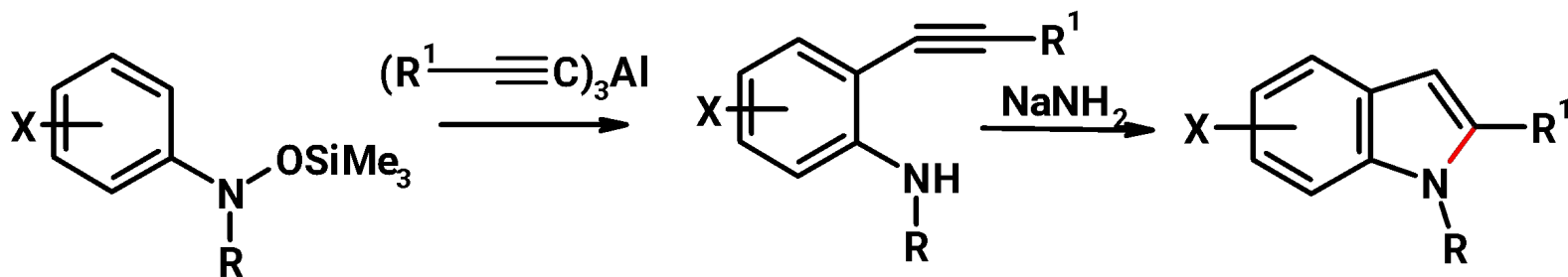
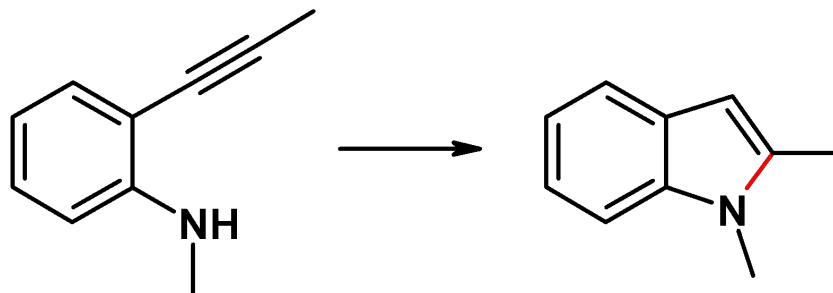
## Синтез индолов по Леймгрубелю-Бачо (восстановительная циклизация β-диметиламино-2-нитростирола)



Me<sub>2</sub>NCH(OMe)<sub>2</sub> - Диметилацеталь диметилформамида

*Heterocycles*, 22, 195 (1984)

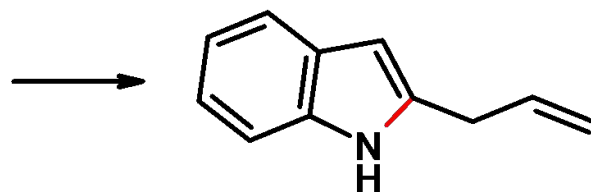
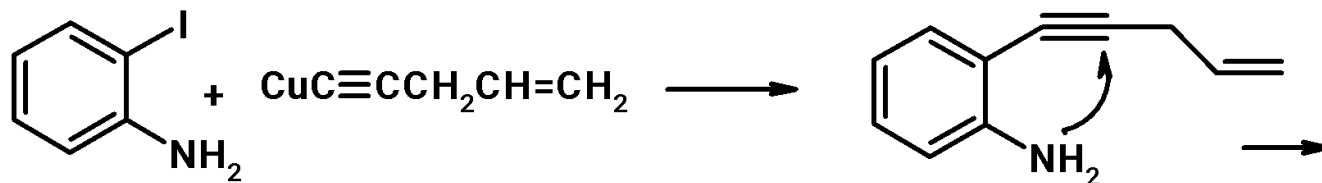
## Циклизация о-алкиниланилинов



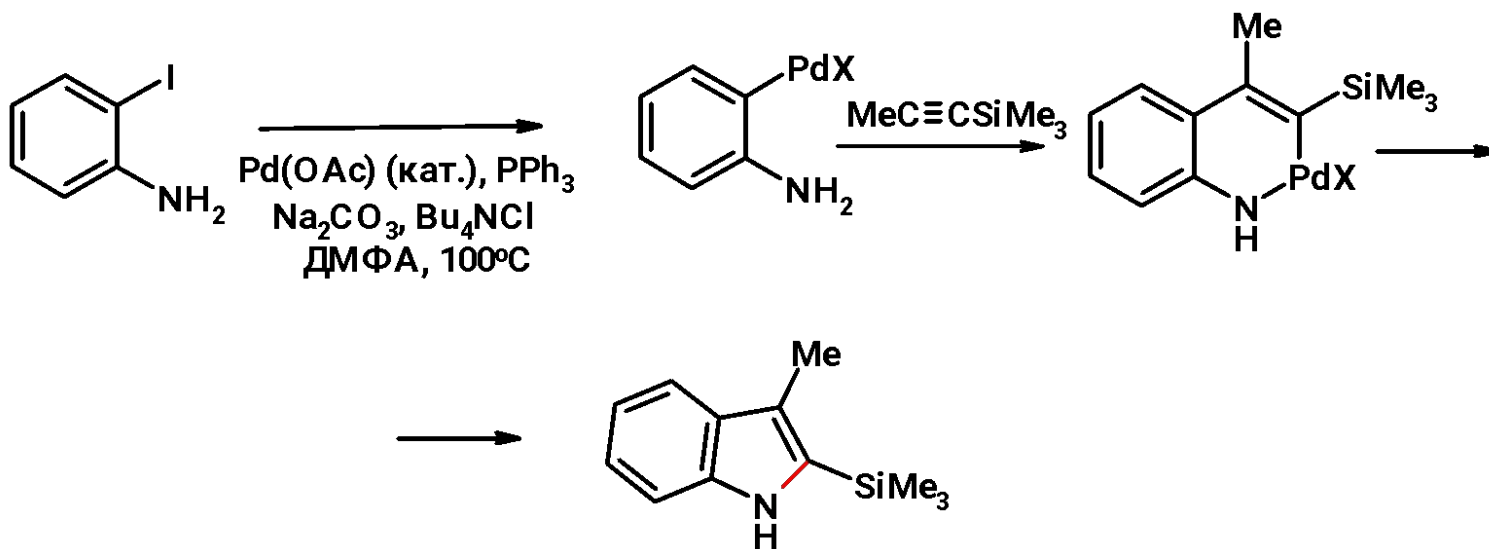
X = F, R = H, R' = Bu (95%); X = F, R = CH\*(Me)Ph, R' = H (96%)

*J.Amer.Chem.Soc.*, 105, 7177 (1983)

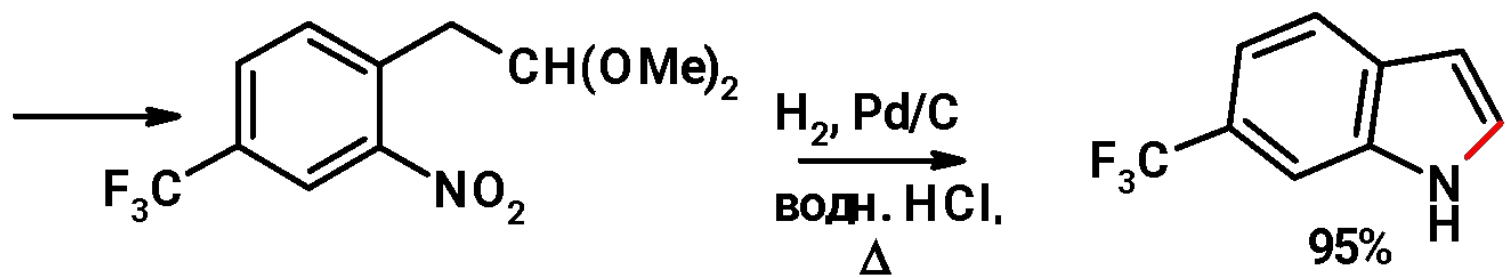
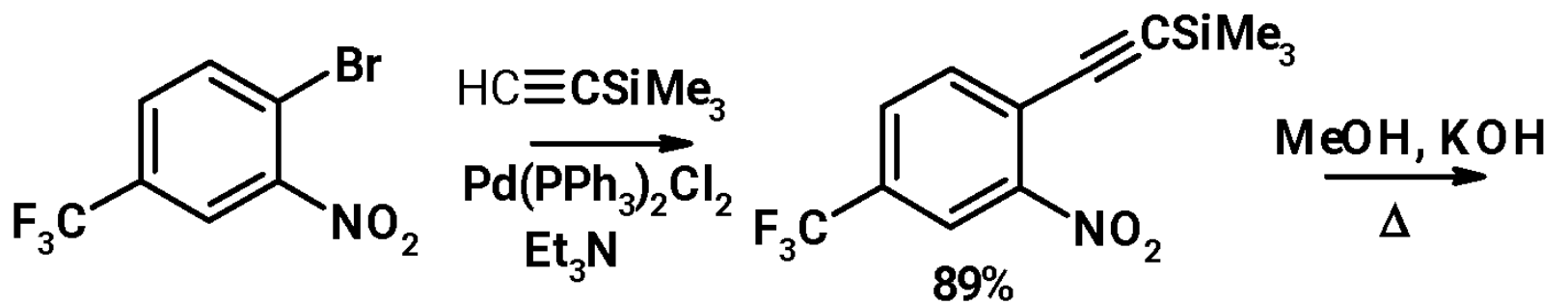




*Chem.Ber.*, 104, 2027 (1971)

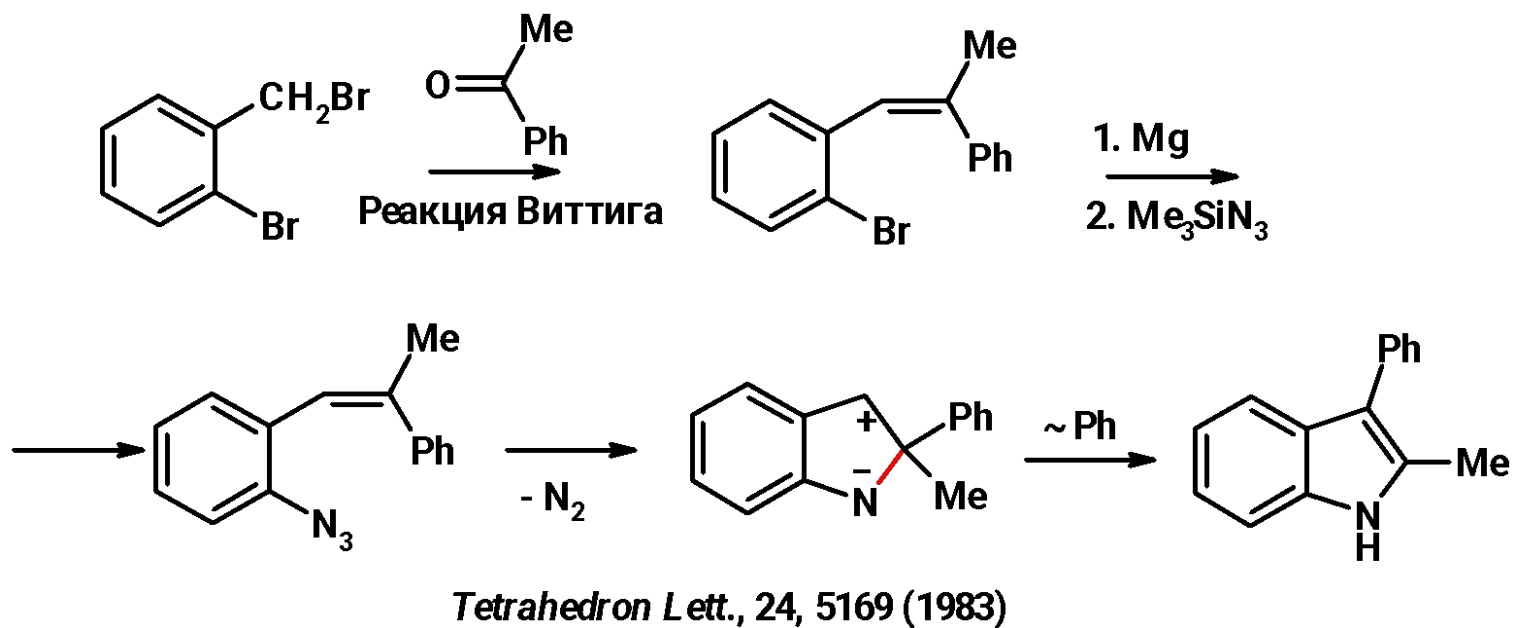
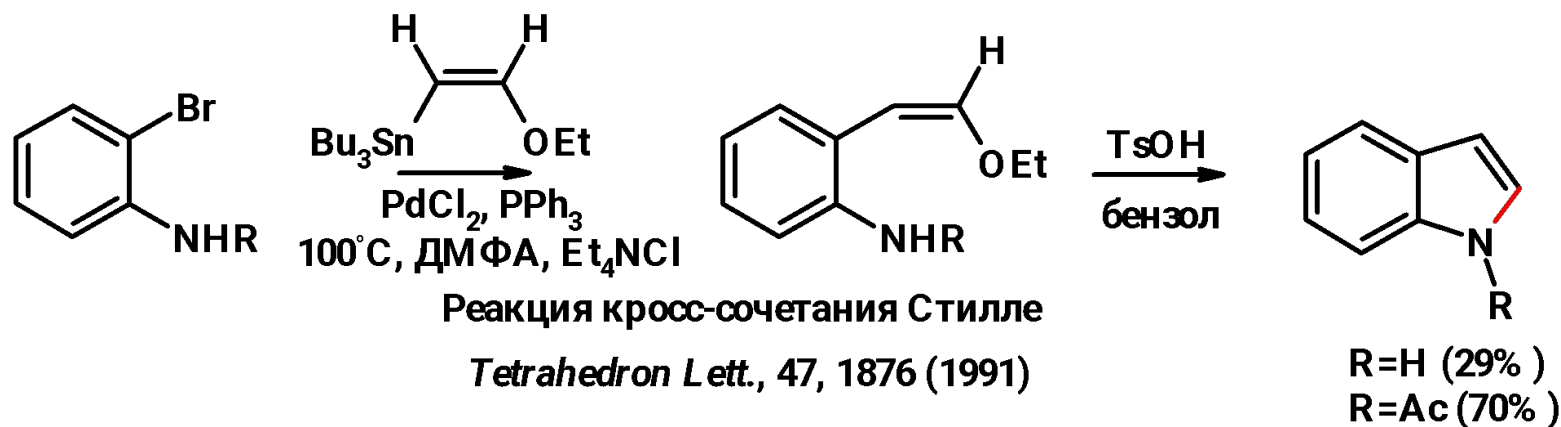


*J.Org.Chem.*, 63, 7652 (1998)

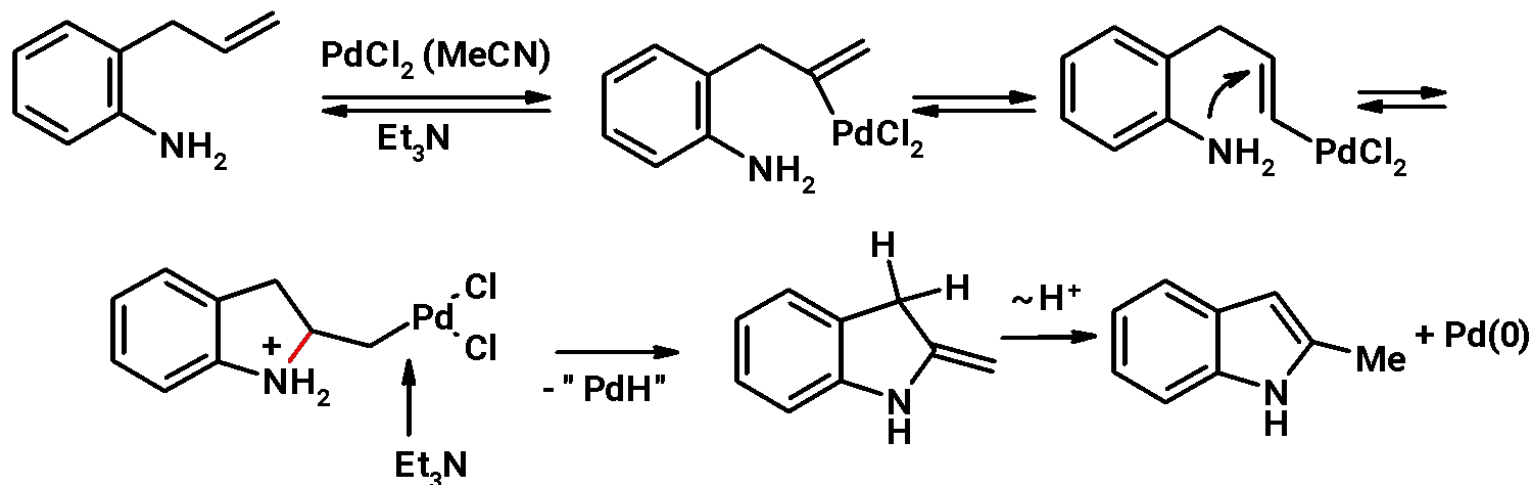


*Heterocycles*, 29, 1013 (1989)

## Циклизация о-виниланилинов и о-винилнитренов

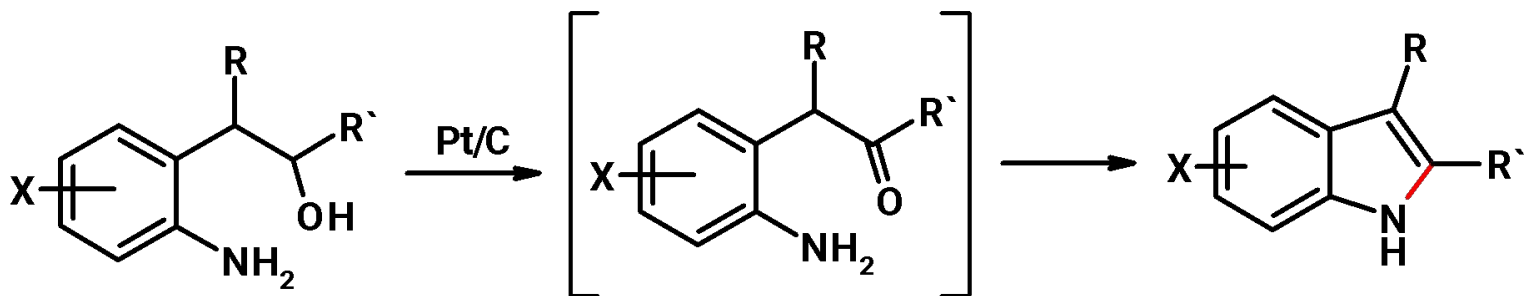


## Циклизация о-аллиланилинов, катализируемая палладием

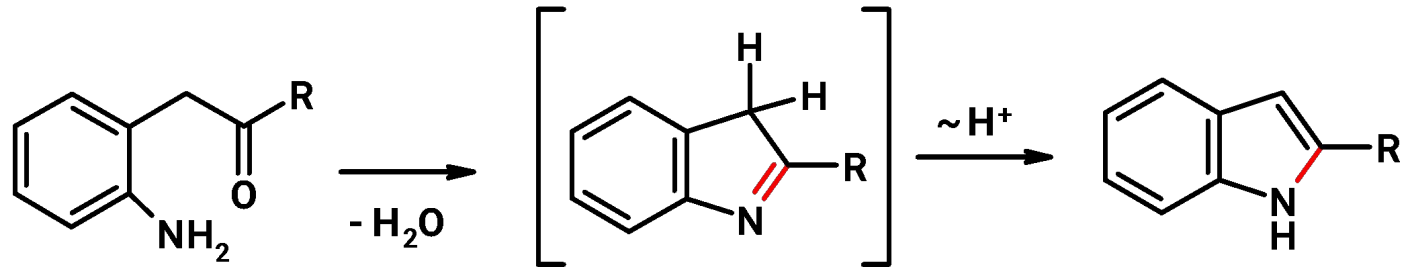


*Tetrahedron Lett.*, 14, 1037 (1977); *J.Am.Chem.Soc.*, 100, 5800 (1978); *J.Am.Chem.Soc.*, 102, 3583 (1980); *J.Am.Chem.Soc.*, 106, 5759 (1984); *Helv.Chim.Acta*, 62, 2581 (1979)

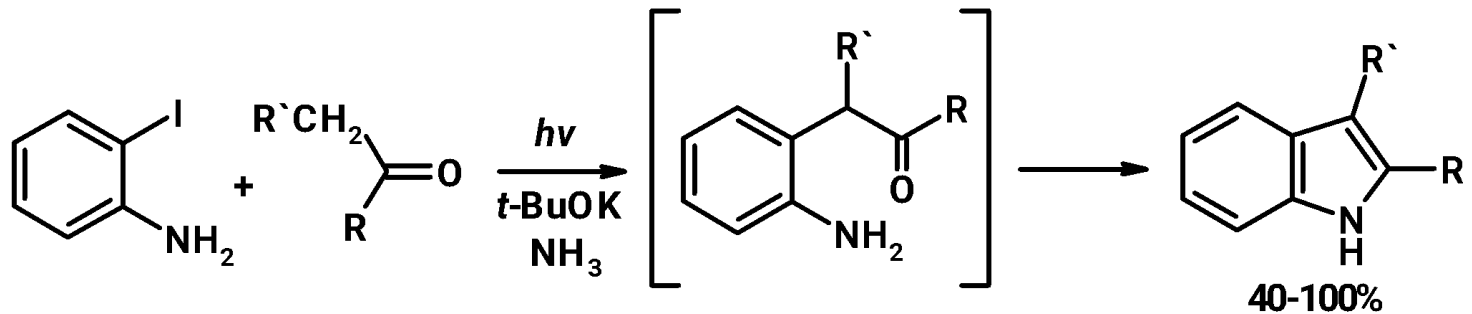
## Циклизация (о-аминофенил)алканолов, катализируемая металлами платиновой группы на активированном угле



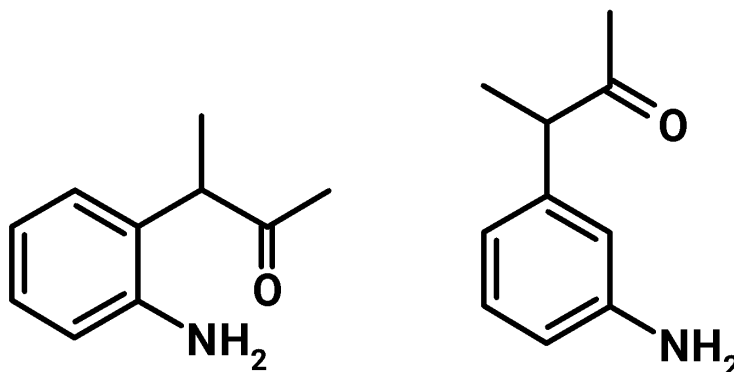
## Циклизация о-аминобензилкетонов



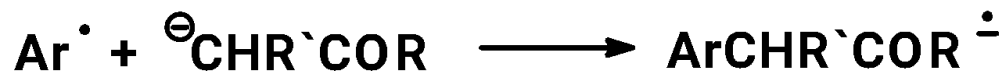
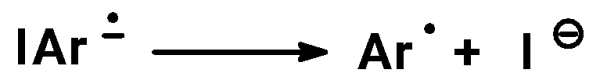
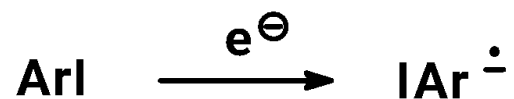
## Взаимодействие о-галогенанилинов с енолями кетонов при облучении ( $S_{RN}1$ – механизм)



1. процесс не идет без облучения
2. процесс ингибируется кислородом
3. процесс региоселективен

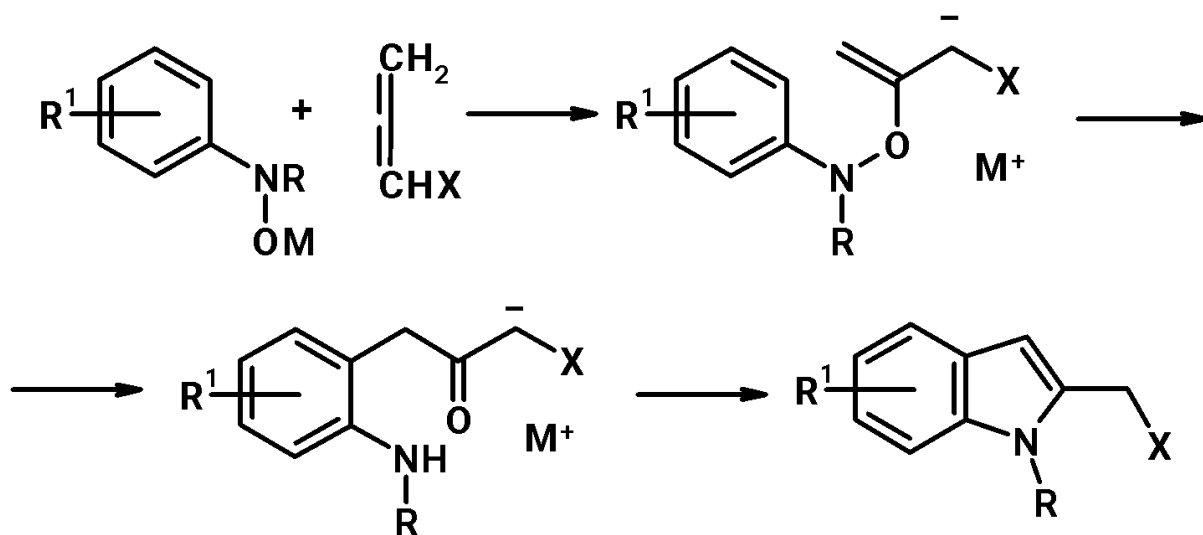


Общий механизм  $S_{NR}1$ -процессов по Баннету



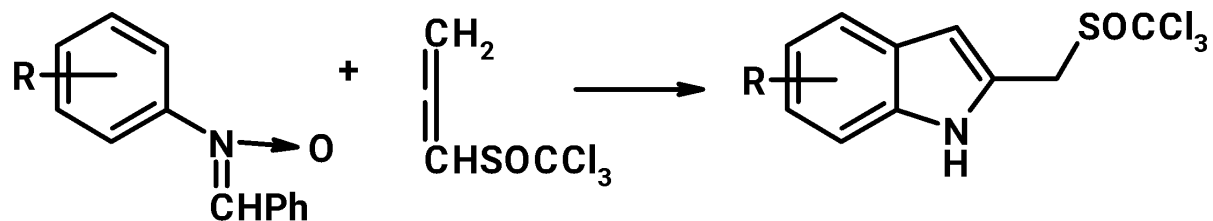
*J.Chem.Soc.*, N 21, 950 (1979)

# Перегруппировка Коупа производных *N*-фенилгидроксиламина

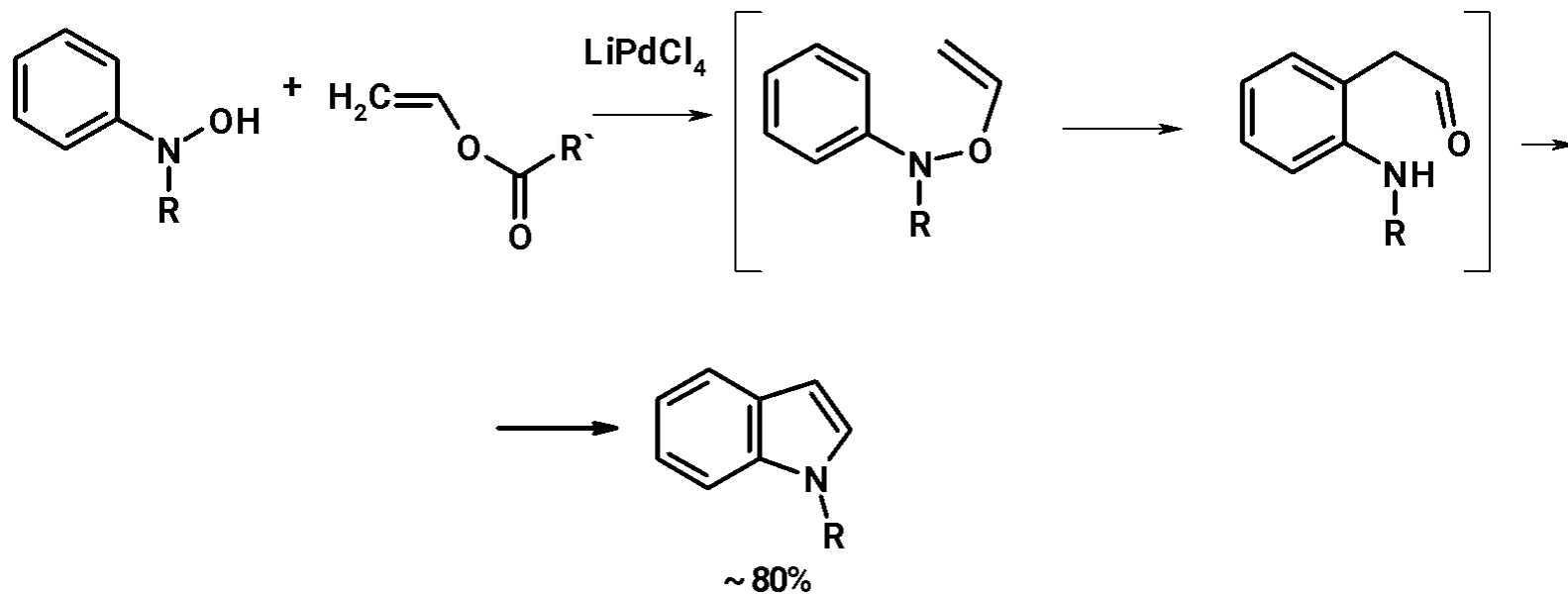


$R^1$	R	X	Выход, %
5-Me	COMe	SO <sub>2</sub> Ph	95
H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	SO <sub>2</sub> Ph	80

*Tetrah. Lett.*, 25, 1547 (1984)



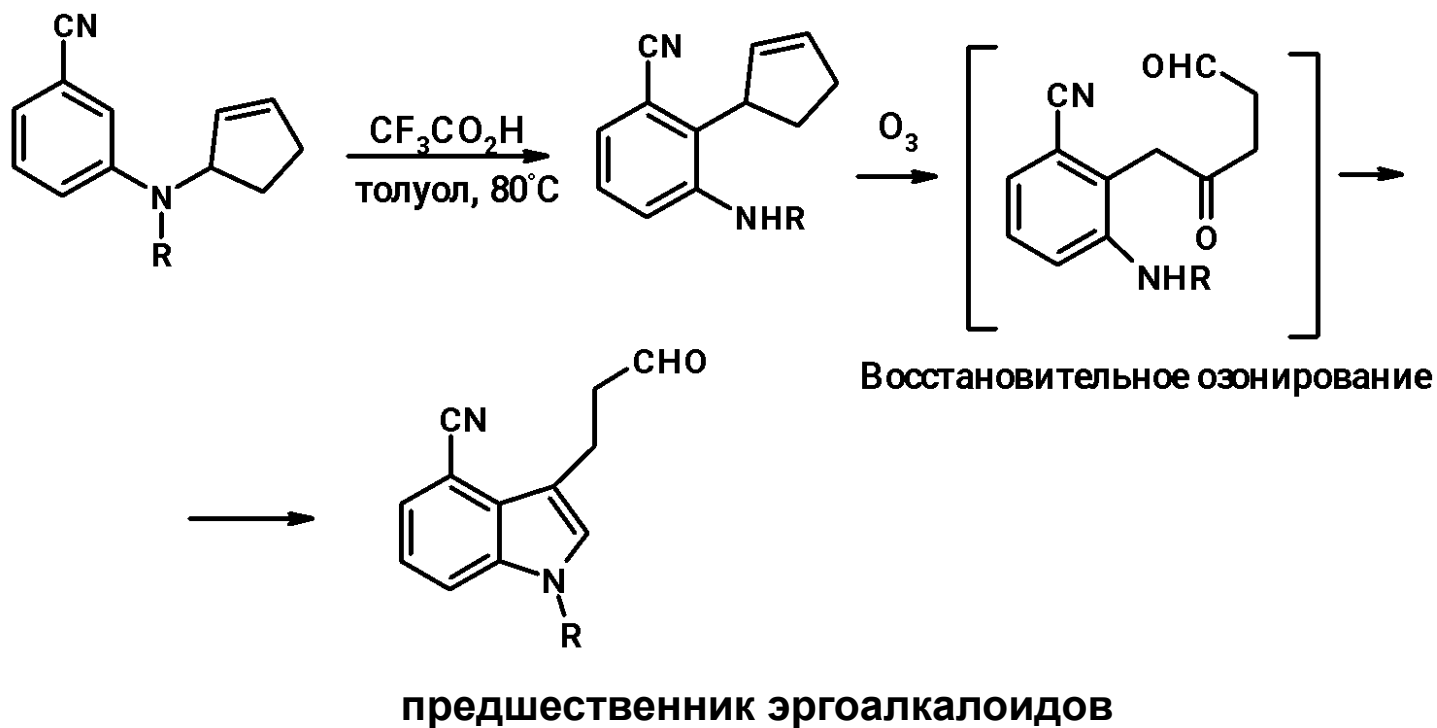
## O-Винилирование фенолгидроксиламинов винилкарбоксилатами



*Tetrah. Lett.*, 25, 1547 (1984); *Helv. Chim. Acta*, 68, 1835 (1985);

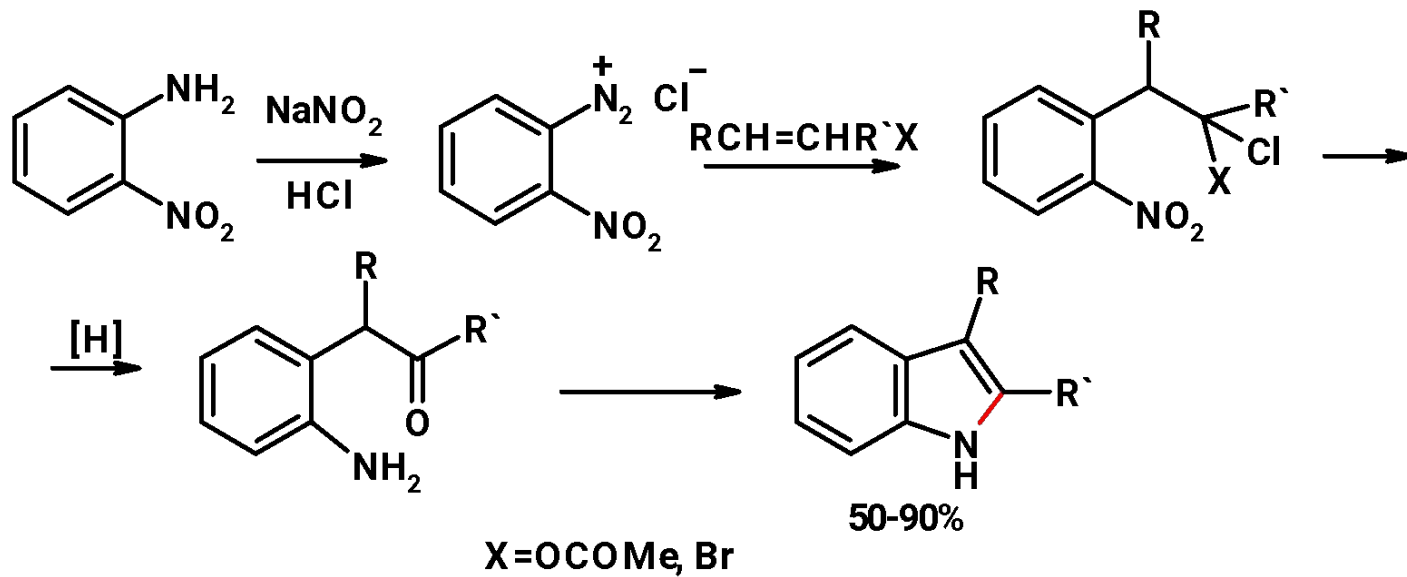


**аза-Перегруппировка Кляйзена *мета*-замещенных N-аллиланилинов  
с последующим озонлизом двойной связи**



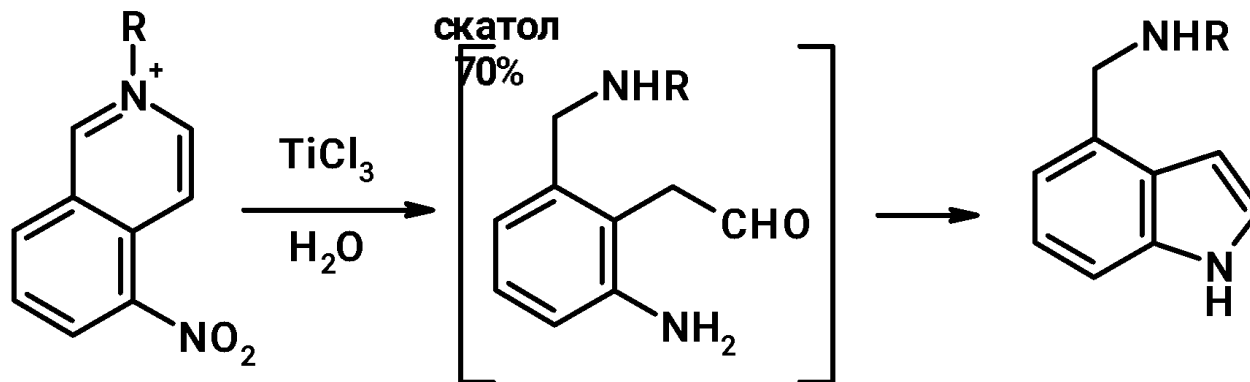
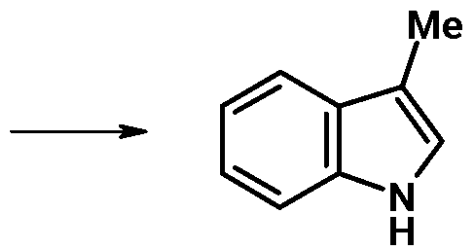
*Tetrah. Lett.*, 25, 3159 (1984)

## Арилирование винилацетатов и винилбромидов по Мейервейну – образование эквивалентов о-нитробензилкетонов



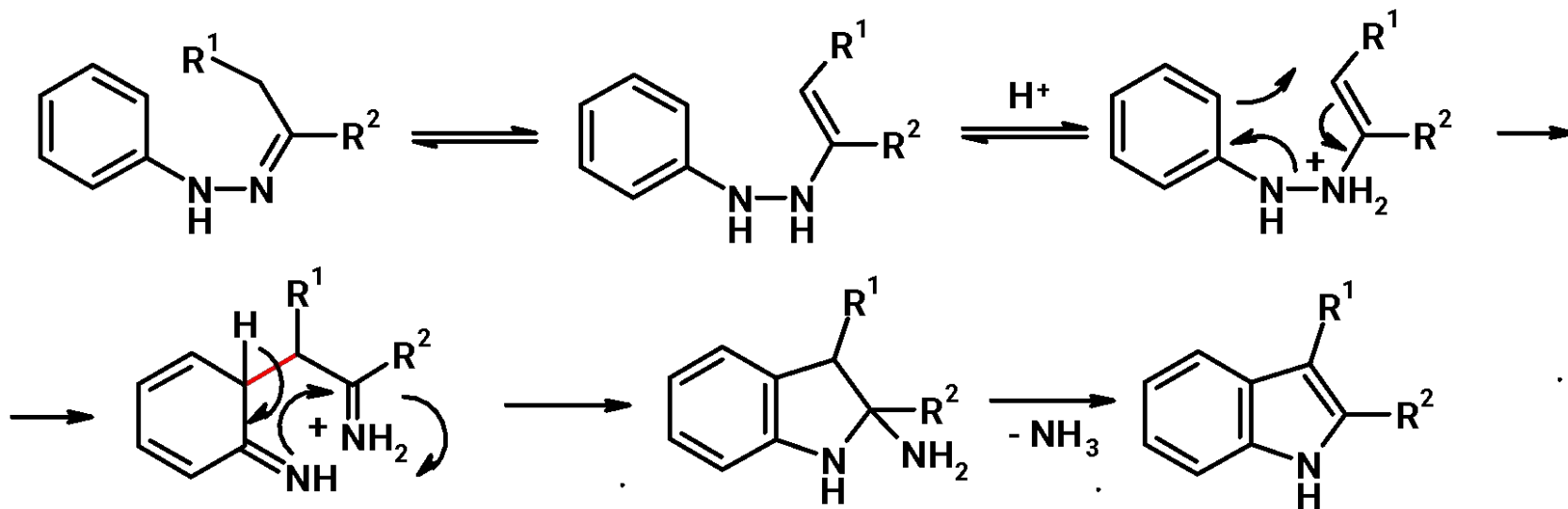
*J.Org.Chem.*, 48, 2066 (1983)

Применение гомогенного и гетерогенного родиевого катализатора для получения 2-незамещенных индолов из производных *o*-аминофенилуксусного альдегида

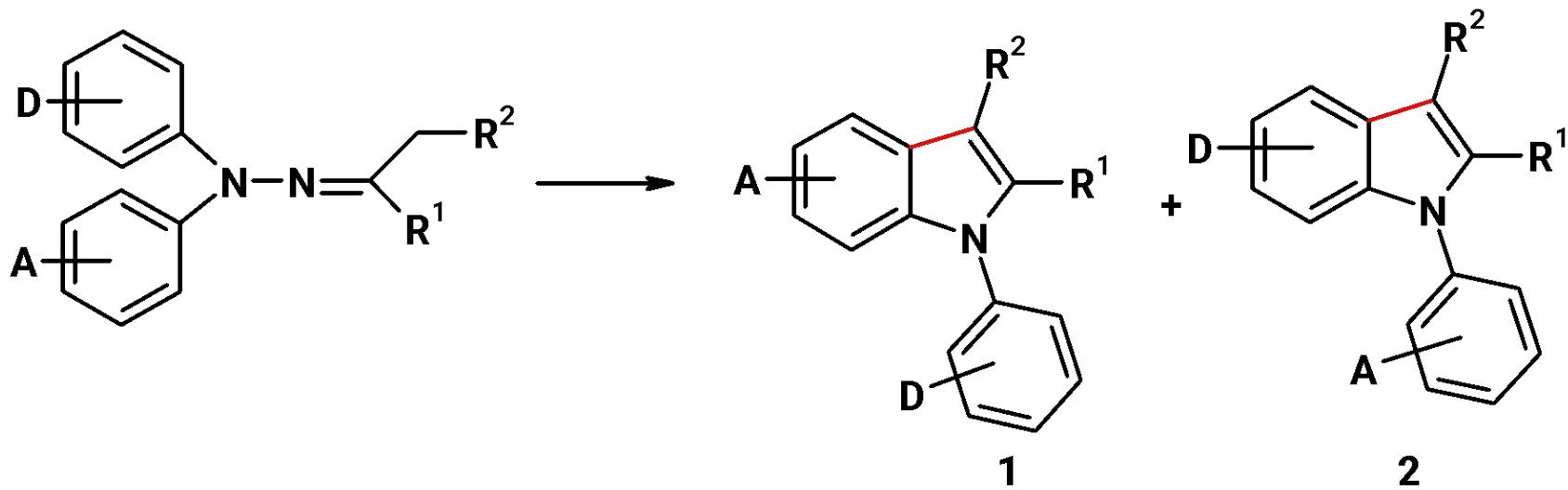
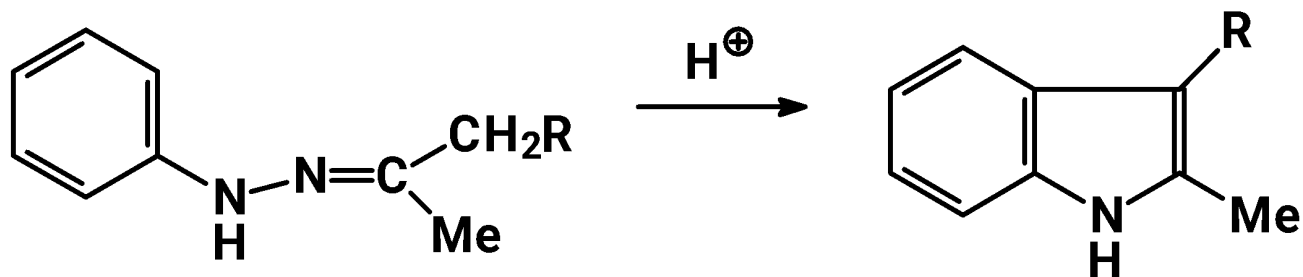
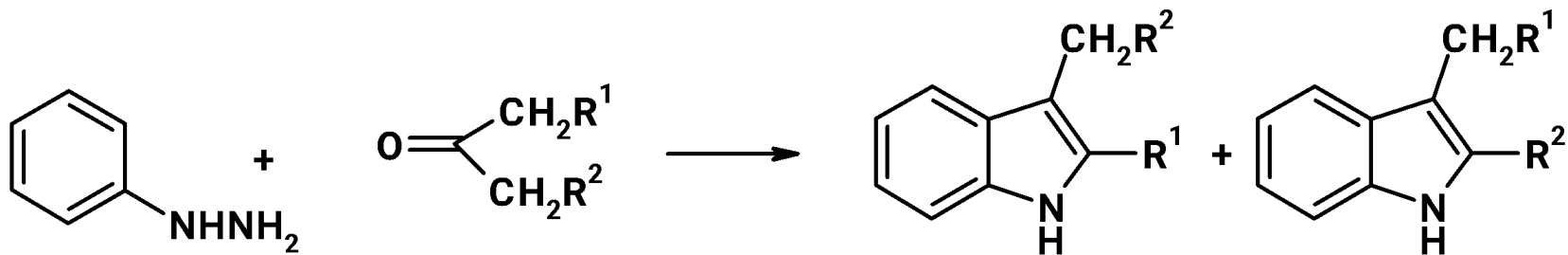


# Образование связи C<sub>(3)</sub>-C<sub>(3a)</sub>

Синтез Фишера – циклизация арилгидразонов  
под действием кислых агентов

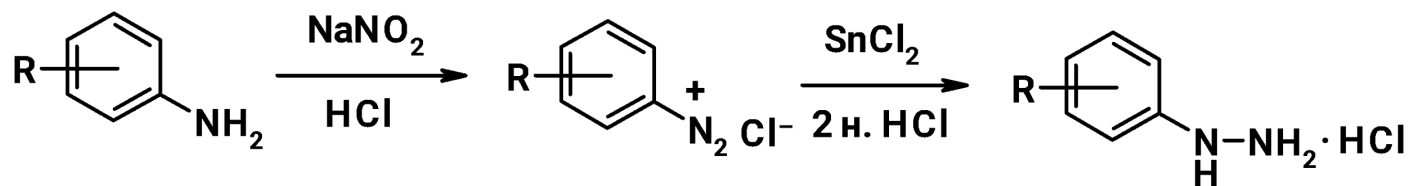


Катализаторы: H<sup>+</sup>, ZnCl<sub>2</sub>, ПФК, PC<sub>13</sub>

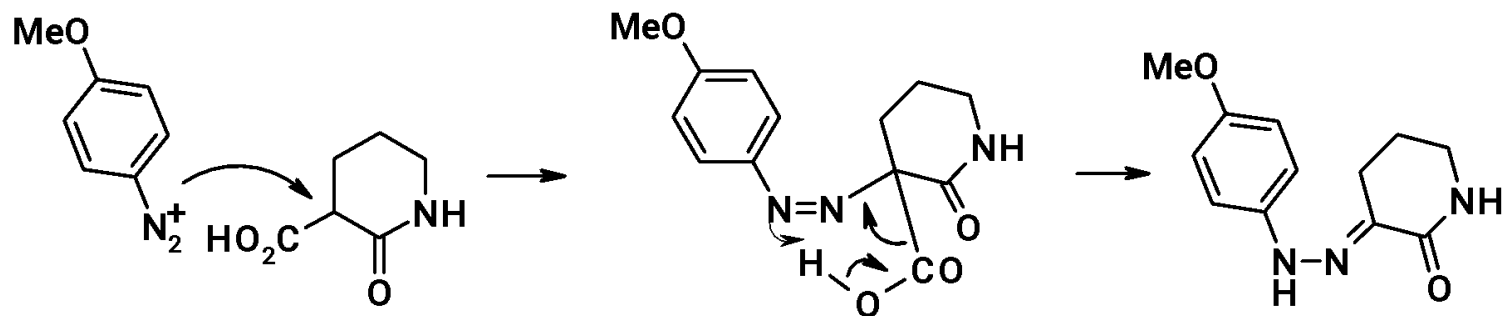


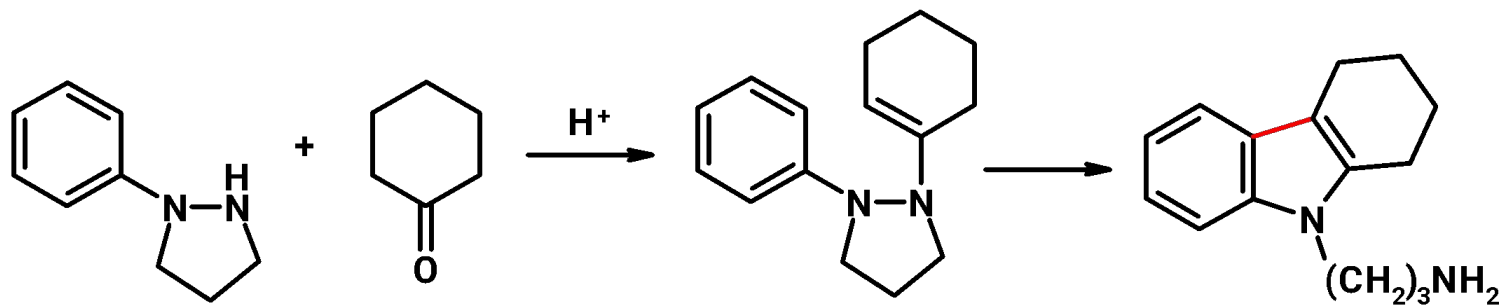
И.И.Грандберг

## Получение фенилгидразинов

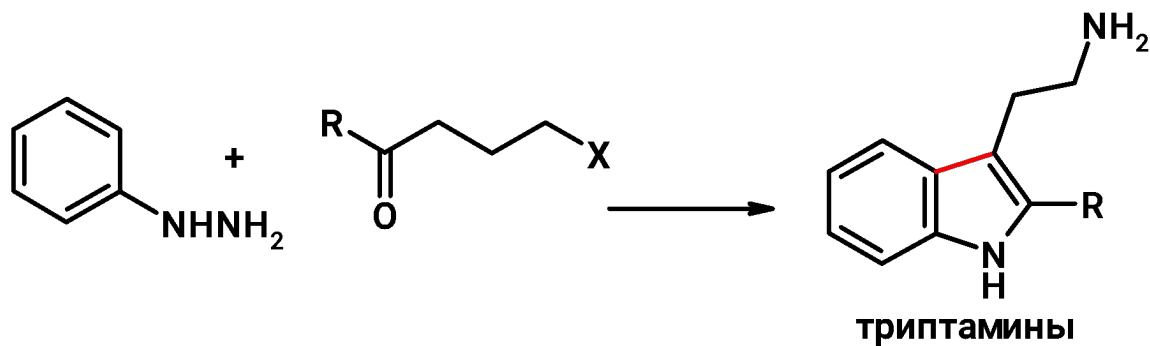


## Реакция Яппа-Клингемана





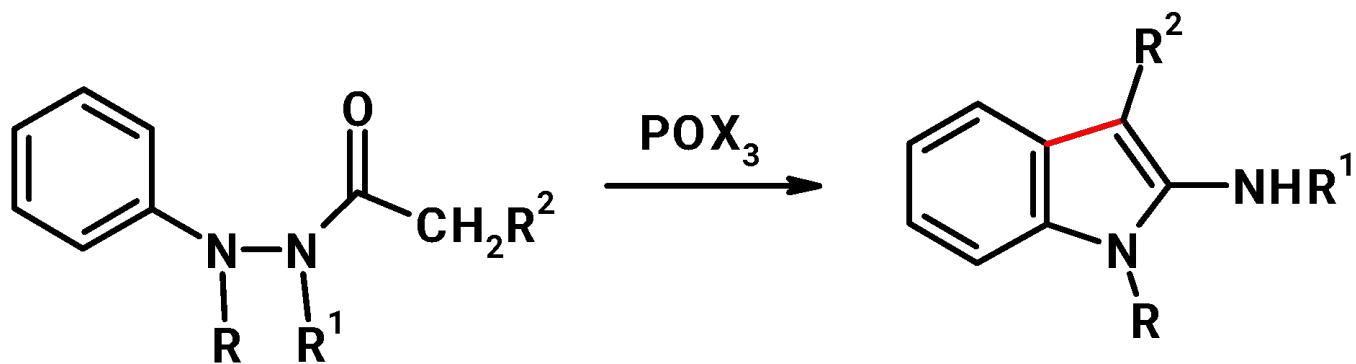
Г.А.Голубева, Л.А.Свиридова, ХГС, № 3, 371 (1970)



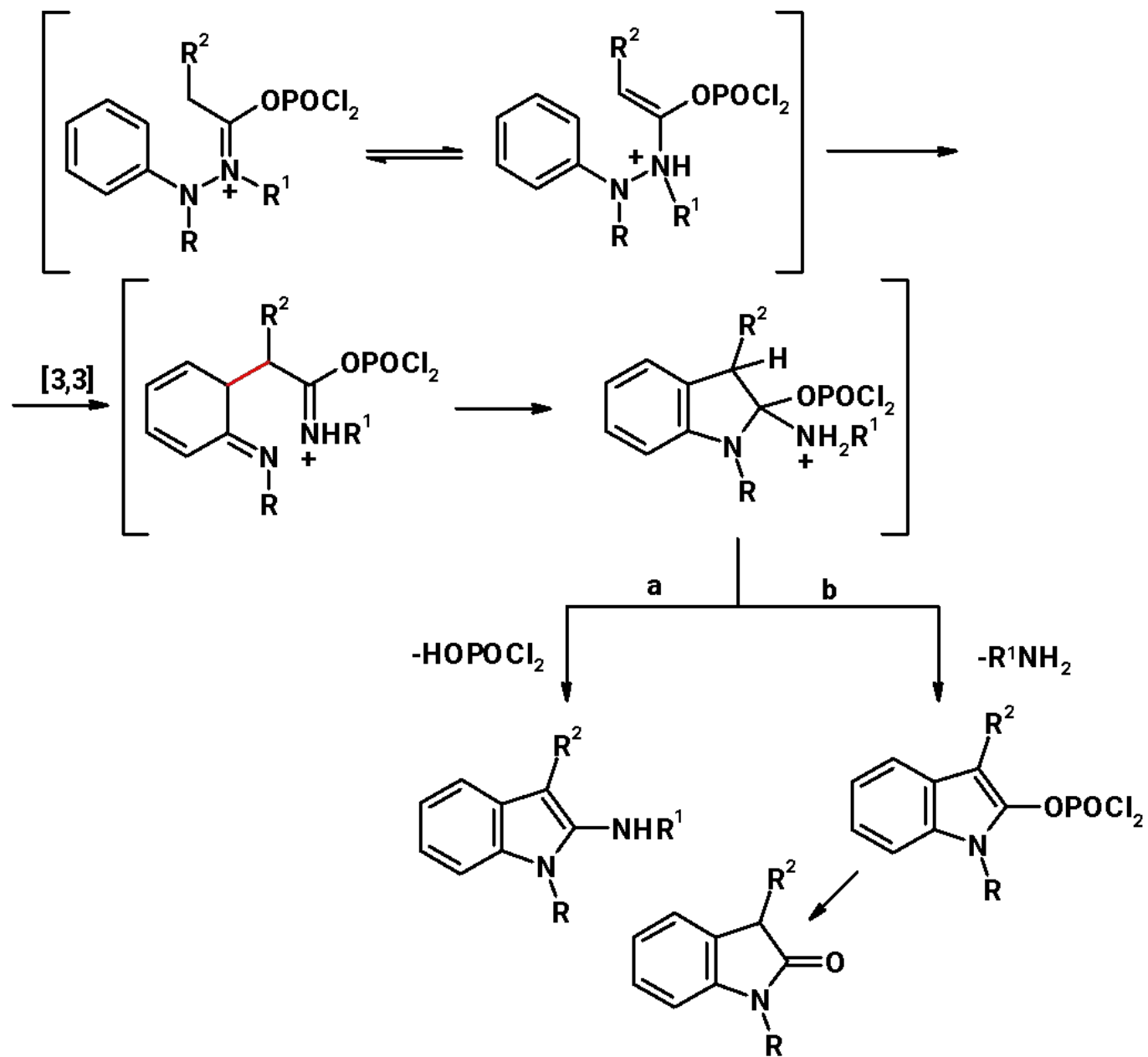
X = Hal

И.И.Грандберг, ДАН СССР, 176, 538 (1972)

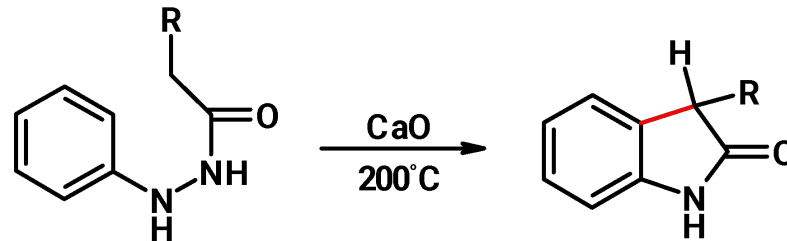
## Реакция Коста







## Синтез оксидолов по Бруннеру



## Использование циклизации гидразидов кислот в основных средах

