

УДК 547.836.3.75.07

## СИНТЕЗ МЕТИЛ-, МЕТОКСИПИРРОЛО[3,2-*f*]ХИНОЛОНОВ И ИХ ФТОРИРОВАННЫХ АНАЛОГОВ ИЗ 6-ЗАМЕЩЕННЫХ-5-АМИНОИНДОЛОВ

С.А. Ямашкин, Г.А. Романова, М.А. Юровская

(кафедра органической химии; e-mail: yumar@org.chem.msu.su)

Изучены реакции ацетоуксусного и трифторацетоуксусного эфиров с 2,3,6-триметил-, 1,2,3,6-тетраметил-, 2,3-диметил-6-метокси- и 1,2,3-триметил-6-метокси-5-аминоиндолами. Обнаружено активирующее влияние на реакционную способность группы 1-CH<sub>3</sub> как на стадии образования енаминокротонатов, так и при циклизации. Разработаны методы синтеза некоторых пирроло[3,2-*f*]хинолонов, а также их фторированных аналогов.

Ранее мы сообщали, что кипячение в бензоле 2,3,6-триметил- и 2,3-диметил-6-метокси-5-аминоиндолов с ацетоуксусным эфиром приводит к образованию соответствующих β-(индолиламино)кротонатов, которые далее подвергали термической циклизации [1]. Метильная группа в положении 6 β-(индолил-5)аминокротоната не оказывает существенного влияния на процесс циклизации. Соответствующий ангулярный пирролохинолон образуется с достаточно высоким выходом. Однако введение в это положение метоксигруппы настолько дезактивирует положение 4 к электрофильной атаке, что 6-метокси-5-индолиламинокротонат не удалось термически превратить в соответствующий пирролохинолон.

Было интересно изучить поведение в аналогичных реакциях 1-метил-6-замещенных-5-аминоиндолов с целью выявления влияния группы 1-CH<sub>3</sub> на их реакционную способность. Мы установили, что аминоиндолы **2**, **4**, как и их NH-аналоги, реагируют с ацетоуксусным эфиром с образованием кротонатов **5**, **6**, но с большим выходом (схема 1).

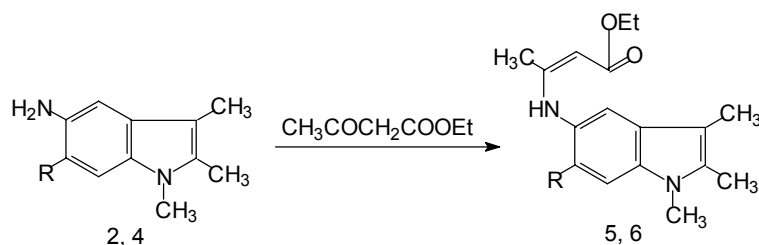
По данным спектра ЯМР <sup>1</sup>H в растворах ДМСО-d<sub>6</sub> и ДМСО-d<sub>6</sub> + CCl<sub>4</sub> (1: 3) аминокротонат

**5** находится в *Z*-форме (на основе сравнения химических сдвигов сигналов протонов с литературными данными [2]). В спектре полученного соединения проявляются сигналы протонов группы CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>O-, метильных групп и бензольного кольца. Енаминное строение продукта реакции подтверждается наличием сигналов протонов иминной группы и винильного протона.

В спектре ЯМР <sup>1</sup>H индолиламинокротоната **6** имеются триплет и квадруплет протонов этоксикарбонильной группы, сигналы протонов метильных групп, ароматических протонов. Слабопольное положение сигнала аминного протона (10.00 м.д.) и сигнала протонов енаминной метильной группы (1.84 м.д.) свидетельствует о *Z*-(*cis*)-хелатированном строении енаминокротоната **6** [2].

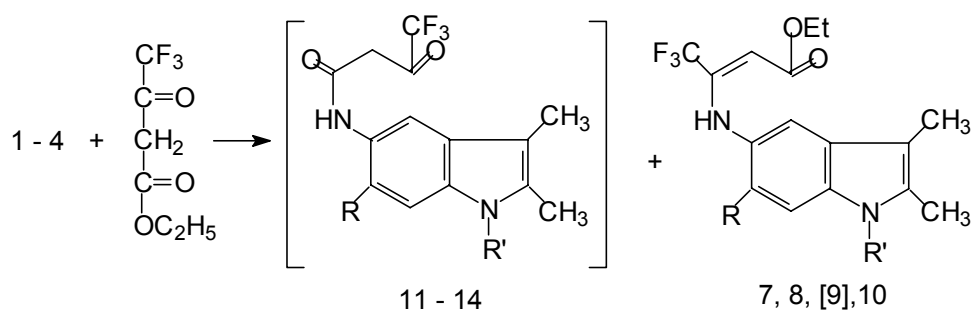
В масс-спектрах аминокротонатов **5**, **6**, кроме пика молекулярного иона, присутствует пик иона [M-46]<sup>+</sup>, что говорит об элиминировании молекулы C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>OH и образовании пирролохинолоновой структуры. Дальнейшая фрагментация иона [M-46]<sup>+</sup> подобна картине распада пирролохинолонов **15**, **16**. УФ-спектры аминокротонатов **5**, **6**, полученных

Схема 1



2, 5 R=CH<sub>3</sub>; 4, 6 R'=OCH<sub>3</sub>

Схема 2



2, 7, 11 R=CH<sub>3</sub>; R'=H; 2, 8, 12 R=R'=CH<sub>3</sub>;  
3, 13 R=OCH<sub>3</sub>; R'=H; 4, 10, 14 R=OCH<sub>3</sub>; R'=CH<sub>3</sub>.

нами и синтезированных ранее из неметилованных аминокетонидолов [1], идентичны.

При нагревании аминов 1, 2, 4 с трифторацетоуксусным эфиром в абсолютном бензоле со следами ледяной уксусной кислоты образуется трудноразделимая смесь енаминов 7, 8, 10 и предполагаемых амидов 11, 12, 14, а в случае аминокетонидола 3 – лишь амид 13.

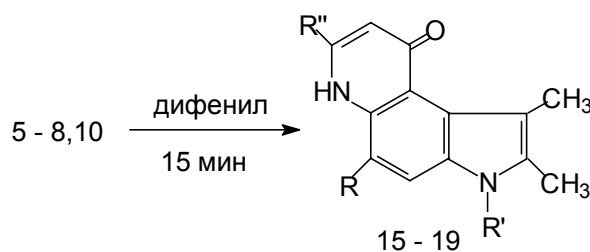
Подтверждением образования амидов 11–14 является отсутствие в их спектрах ЯМР <sup>1</sup>H сигналов протонов этоксигруппы. Четкое отнесение сигналов в спектрах выявить трудно, так как амиды 11–14 в ДМСО-d<sub>6</sub> существуют в нескольких формах. В связи с этим они как индивидуальные соединения не охарактеризованы.

Обнаружено, что взаимодействие аминов 1–4 с трифторацетоуксусным эфиром в абсолютном бензоле в присутствии каталитических количеств уксусной кислоты и водоотнимающего средства (прока-

ленного сульфата кальция) при постоянном перемешивании и температуре 10–15°C приводит к образованию енаминов 7–10, т.е. реакция реализуется только за счет кетонной группы β-дикарбонильного соединения. При этом аминокетонидол 3 проявляет очень низкую реакционную способность в отличие от метилированного аналога 4. Продукт реакции 9 обнаруживается лишь хроматографически в следовых количествах, в то время как соединение 10 получается с достаточно хорошим выходом. Образование 1-CH<sub>3</sub>-замещенного енамина 8 также идет быстрее и с более высоким выходом, чем его неметилованного аналога 7. В спектрах ЯМР <sup>1</sup>H наличие триплета и квадруплета этоксигруппы, сигналы иминной группы и винильного протона, а также их химические сдвиги для соединений 7, 8, 10 подтверждают их Z-енаминную структуру.

Масс-спектральный распад енаминов 7, 8, 10 аналогичен таковому для аминокетонидатов 5, 6, что

Схема 3



5, 15 R=R'=R''=CH<sub>3</sub>; 6, 16 R=OCH<sub>3</sub>, R'=R''=CH<sub>3</sub>; 7, 17 R=CH<sub>3</sub>, R'=H, R''=CF<sub>3</sub>;  
8, 18 R=R'=CH<sub>3</sub>; R''=CF<sub>3</sub>; 10, 19 R=OCH<sub>3</sub>, R'=CH<sub>3</sub>, R''=CF<sub>3</sub>

Т а б л и ц а 1

## Физико-химические характеристики полученных соединений

Соединение	Брутто-формула	Найдено, % (Вычислено, %)			$R_f$ (система)	$T_{пл}$ , °С
		С	Н	М		
5	$C_{18}H_{24}N_2O_2$	71,95 (71,97)	8,06 (8,05)	300	0,74 (А)	152–153 из петролейного эфира
6	$C_{18}H_{24}N_2O_3$	68,28 (68,33)	7,71 (7,65)	316	0,65 (Б)	129–130 из петролейного эфира
7	$C_{17}H_{19}F_3N_2O_2$	59,89 (59,99)	5,77 (5,63)	340	0,77 (А)	130–131 из петролейного эфира
8	$C_{18}H_{21}F_3N_2O_2$	60,92 (61,06)	6,09 (5,97)	354	0,42; 0,74 (В)	115–116 из петролейного эфира
10	$C_{18}H_{21}F_3N_2O_3$	58,25 (58,37)	5,90 (5,71)	370	0,69 (Г)	102–103 из петролейного эфира
15	$C_{16}H_{18}N_2O$	75,54 (75,56)	7,15 (7,13)	254	0,3 (Д)	183–184 из спирта
16	$C_{16}H_{18}N_2O_2$	71,03 (71,09)	6,79 (6,71)	270	0,23 (Е)	244–245 из этилацетата
17	$C_{15}H_{13}F_3N_2O$	61,16 (61,22)	4,53 (4,45)	294	0,6 (Б)	248–249 из этилацетата
18	$C_{16}H_{15}F_3N_2O$	62,23 62,33	5,04 4,90	308	0,73 (Б)	206–208 из этилацетата
19	$C_{16}H_{15}F_3N_2O_2$	58,98 59,26	5,11 4,66	324	0,22 (Б)	204–205 из толуола

\* $R_f$  (система): А – бензол:этилацетат (5:1); Б – бензол:этилацетат (3:1); В – бензол; Г – бензол:этилацетат (10:1); Д – этилацетат: метанол:аммиак (4:1:следы); Е – этилацетат:метанол:аммиак (5:1:следы).

Т а б л и ц а 2

## Спектральные параметры полученных соединений

Соединение	Спектр ЯМР $^1\text{H}$ , $\delta$ , м.д., $J$ (Гц)	Масс-спектр, $m/z$ ( $I$ отн., %)	УФ-спектр	
			$\lambda_{\text{макс}}$	$\lg \epsilon$
1	2	3	4	5
<b>5</b>	1.24 (3H, т, $J=7$ Гц, O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> ), 1.74 (3H, с, C=C-CH <sub>3</sub> ), 2.17 (3H, с, 2-CH <sub>3</sub> ), 2.35 (6H, с, 3-, 6-CH <sub>3</sub> ), 3.63 (3H, с, 1-CH <sub>3</sub> ), 4.06 (2H, к, $J=7$ Гц, O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> ), 4.52 (1H, с, Нвин.), 7.06 (1H, с, 4-Н), 7.10 (1H, с, 7-Н), 9.97 (1H, с, N-Н).	300 (100), 285 (6), 255 (22), 254 (46), 253 (21), 239 (26), 226 (67), 225 (37), 213 (44), 211 (32), 198 (12), 172 (15), 144 (4), 127 (10), 115 (8), 106 (14), 105 (12), 91 (7), 77 (7), 56 (5), 39 (17).	208 233 299	4.39 4.48 4.52
<b>6</b>	1.20 (3H, т, $J=7$ Гц, O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> ), 1.84 (3H, с, C=C-CH <sub>3</sub> ), 2.13 (3H, с, 3-CH <sub>3</sub> ), 2.28 (3H, с, 2-CH <sub>3</sub> ), 3.61 (3H, с, 1-CH <sub>3</sub> ), 3.84 (3H, с, OCH <sub>3</sub> ), 4.04 (2H, к, $J=7$ Гц, O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> ), 4.59 (1H, с, Нвин.), 7.02 (1H, с, 7-Н), 7.17 (1H, с, 4-Н), 10.00 (1H, с, N-Н).	316 (100); 271 (20); 270 (24); 269 (15); 256 (14); 255 (15); 241 (19); 239 (11); 229 (21); 228 (15); 227 (62); 225 (16); 214 (27); 213 (25); 212 (30); 211 (36); 201 (15); 199 (20); 197 (12); 185 (17); 158 (22); 145 (13); 143 (14); 130 (12); 115 (12); 107 (16); 56 (13); 42 (17); 41 (10); 39 (20).	233 290 303	4.38 4.37 4.31
<b>7</b>	1.33 (3H, т, $J=7$ Гц, O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> ), 2.17 (3H, с, 3-CH <sub>3</sub> ), 2.32 (6H, с, 2-, 6-CH <sub>3</sub> ), 4.24 (2H, к, $J=7$ Гц, O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> ), 5.30 (1H, с, Нвин.), 7.06 (1H, с, 4-Н), 7.60 (1H, с, 7-Н), 9.62 (1H, с, N-Н), 10.56 (1H, с, 1-Н).	340 (100), 294 (51), 293 (40), 279 (25), 267 (21), 266 (41), 265 (48), 252 (26), 251 (26), 225 (13), 197 (40), 182 (12), 158 (20), 157 (12), 143 (10), 115 (17), 91 (11), 69 (10).	208 233 294	4.27 4.5 4.4
<b>8</b>	1.23 (3H, т, $J=7$ Гц, O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> ), 2.12 (3H, с, 3-CH <sub>3</sub> ), 2.30 (6H, с, 2-, 6-CH <sub>3</sub> ), 3.61 (3H, с, 1-CH <sub>3</sub> ), 4.18 (2H, к, $J=7$ Гц, O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> ), 5.22 (1H, с, Нвин), 7.19 (1H, с, 4-Н), 7.21 (1H, с, 7-Н), 9.55 (1H, с, N-Н). * 1.32 (3H, т, $J=7$ Гц, O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> ), 2.18 (3H, с, 3-CH <sub>3</sub> ), 2.32 (3H, с, 6-CH <sub>3</sub> ), 2.38 (3H, с, 2-CH <sub>3</sub> ), 3.63 (3H, с, 1-CH <sub>3</sub> ), 4.19 (2H, к, $J=7$ Гц, O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> ), 5.20 (1H, с, Нвин), 7.05 (1H, с, 4-Н), 7.17 (1H, с, 7-Н), 9.60 (1H, с, N-Н).	354 (82), 309 (20), 308 (100), 307 (63), 293 (34), 280 (53), 279 (63), 266 (35), 265 (42), 211 (43), 197 (17), 172 (38), 156 (17), 119 (17), 115 (15), 91 (15), 77 (11), 69 (16), 56 (16), 44 (28), 40 (81), 32 (63).	206 235 294	4.21 4.44 4.36

также подтверждает их строение. Пик иона с  $m/z$  69 в масс-спектрах свидетельствует о наличии трифторметильной группы. УФ-спектральные характеристики согласуются с литературными данными для подобных структур [1].

При исследовании поведения енаминокротонатов **5–8**, **10** в термических (280°C), а амидов **11–14** в кислотных условиях с целью выявления возможности циклизации с образованием пирролохинолонов, было обнаружено, что аминокротонаты как **5**, так и

Продолжение табл. 2

Соединение	Спектр ЯМР $^1\text{H}$ , $\delta$ , м.д., J (Гц)	Масс-спектр, $m/z$ (I отн., %)	УФ-спектр	
			$\lambda_{\text{макс}}$	$\lg \epsilon$
1	2	3	4	5
<b>10</b>	1.23 (3H, т, $J=7$ Гц, O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> ), 2.12 (3H, с, 3-CH <sub>3</sub> ), 2.29 (3H, с, 2-CH <sub>3</sub> ), 3.62 (3H, с, 1-CH <sub>3</sub> ), 3.81 (3H, с, O-CH <sub>3</sub> ), 4.16 (2H, к, $J=7$ Гц, O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> ), 5.21 (1H, с, Нвин.), 7.00 (1H, с, 7-Н), 7.20 (1H, с, 4-Н), 9.50 (1H, с, N-Н)	370 (100); 325 (16); 324 (50); 323 (18); 310 (14); 309 (36); 295 (17); 281 (28); 267 (26); 265 (19); 240 (32); 239 (10); 213 (18); 120 (22); 69 (16); 56 (27)	238 290	4,49 4,34
<b>15</b>	2.37 (6H, с, 2-, 7-CH <sub>3</sub> ), 2.58 (6H, с, 1-, 5-CH <sub>3</sub> ), 3.69 (3H, с, 3-CH <sub>3</sub> ), 5.82 (8H, с, 4-Н), 7.33 (1H, с, 4-Н), 9.5 (1H, с, 6-Н)	254 (76), 239 (100), 225 (6), 209 (8), 127 (33), 119 (8), 105 (6)	222 250 256 294 357	4,68 4,4 4,4 4,24 4,22
<b>16</b>	2.20 (3H, с, 2-CH <sub>3</sub> ), 2.24 (3H, с, 7-CH <sub>3</sub> ), 2.62 (3H, с, 1-CH <sub>3</sub> ), 3.69 (3H, с, 3-CH <sub>3</sub> ), 4.04 (3H, с, OCH <sub>3</sub> ), 5.84 (1H, с, 8-Н), 7.35 (1H, с, 4-Н), 10.38 (1H, с, 6-Н)	–	222 238 <sub>пл</sub> 253 260 303 357	4,49 4,29 4,25 4,21 4,04 3,89
<b>17</b>	2.37 (3H, с, 2-CH <sub>3</sub> ), 2.52 (3H, с, 5-CH <sub>3</sub> ), 2.66 (3H, с, 1-CH <sub>3</sub> ), 7.28 (1H, с, 8-Н), 7.64 (1H, с, 4-Н), 11.35 (1H, с, 6-Н), 11.71 (1H, с, 3-Н)	–	213 241 282 345	4,26 4,3 4,17 3,79
<b>18</b>	2.40 (3H, с, 2-CH <sub>3</sub> ), 2.57 (3H, с, 5-CH <sub>3</sub> ), 2.72 (3H, с, 1-CH <sub>3</sub> ), 3.78 (3H, с, 3-CH <sub>3</sub> ), 7.21 (1H, с, 8-Н), 7.84 (1H, с, 4-Н), 11.55 (1H, с, 6-Н)	308 (100), 307 (73), 293 (67), 245 (8), 154 (7), 144 (12), 91 (4), 69 (3)	215 241 282 348	4,17 4,24 4,17 3,7
<b>19</b>	2.37 (3H, с, 2-CH <sub>3</sub> ), 2.53 (3H, с, 1-CH <sub>3</sub> ), 3.76 (3H, с, 3-CH <sub>3</sub> ), 4.01 (3H, с, OCH <sub>3</sub> ), 7.21 (1H, с, 8-Н), 7.42 (1H, с, 4-Н), 11.62 (1H, с, 6-Н)	324 (55), 323 (13), 310 (19), 309 (100)	217 244 294 357	4,37 4,32 4,08 3,84

**6** (в отличие от его метилированного аналога) [1] в условиях термической циклизации с количественными выходами превращаются в соответствующие пирроло[3,2-*f*]хинолоны **15**, **16**.

Аналогично подвергаются циклизации и енамины **7**, **8**, причем в случае 1-метилзамещенного енамина **8** выход пирролохинолона **18** также выше, чем пир-

ролохинолона **17** из 1-Н енамина **7**. Енамин **10** в аналогичных условиях также циклизуется с образованием пирролохинолона **19**.

Строение полученных соединений **15–19** подтверждают спектры ЯМР  $^1\text{H}$ , в которых имеются сигналы протонов метильных групп, синглетные сигналы ароматических протонов. При этом наблю-

дается слабополюсный сдвиг сигналов протонов группы  $1\text{-CH}_3$ , находящейся в *peri*-положении к  $\gamma$ -пирридоновому кислороду, что ранее уже наблюдалось для пирроло[3,2-*f*]хинолонов [1]. Масс- и УФ-спектральные параметры соединений **15–19** также согласуются с характеристиками исследованных ранее подобных структур [1]. Кипячение амидов **11–14** в трифторуксусной кислоте или в дифениле не приводит к образованию пирролохинолонов. При этом в реакционной среде обнаруживается исходный амид и продукты его распада.

Таким образом, введение по пиррольному азоту метильной группы усиливает реакционную способность 6-замещенных-5-аминоиндолы в реакциях конденсации с ацетоуксусным и трифторацетоуксусным эфирами, что, по-видимому, связано с повышением основности аминогруппы. Аналогично метильный заместитель в положении 1 повышает электронную плотность на атоме С-4 в енаминах, что значительно облегчает циклизацию с образованием пирроло[3,2-*f*]хинолоновой системы. Неспособность амидов циклизоваться с образованием  $\alpha$ -пирроло[3,2-*f*]хинолонов объясняется стерическими факторами – пространственной напряженностью в угловых пирролохинолонах с метильной и трифторметильной группами в *peri*-положениях.

#### Экспериментальная часть

Спектры ПМР записаны на приборе “*Bruker DRX 500*” в  $\text{DMCO-d}_6$  (соединения **6, 8, 10, 16–19**), в  $\text{CDCl}_3$  (**7**), в  $\text{DMSO-d}_6 - \text{CCl}_4$  (1:3) (соединения **5, 8, 15**) относительно 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 “*Specord*” в этаноле. Очистку продуктов реакции проводили методом колоночной хроматографии и методом препаративной хроматографии на пластинках с толстым незакрепленным слоем. В качестве сорбента использовали  $\text{Al}_2\text{O}_3$  (нейтральная, I и II степени активности по Брокману). Контроль за ходом реакции и чистотой полученных соединений, определение *Rf* осуществляли с помощью ТСХ на пластинках *Silufol UV-254*.

#### Общая методика получения енаминов аминоиндолы и ацетоуксусного эфира (А)

Смесь аминоиндола, ацетоуксусного эфира и каталитических количеств уксусной кислоты кипятят в абсолютном бензоле в течение нескольких часов

(контроль хроматографический). По окончании реакции бензол отгоняют. Выделенное вещество очищают пропусканием нагретого до кипения раствора в петролейном эфире с небольшим количеством бензола через слой (1 см) окиси алюминия, затем перекристаллизовывают из петролейного эфира.

#### Общая методика получения енаминоваминоиндолы и трифторацетоуксусного эфира (Б)

Смесь аминоиндола и этилового эфира 4,4,4-трифторацетоуксусной кислоты в абсолютном бензоле с каталитическими количествами уксусной кислоты в присутствии прокаленного сульфата кальция перемешивают в течение 2 мес (контроль хроматографический) при температуре 10–15°C. По окончании реакции раствор отфильтровывают от сульфата кальция, бензол упаривают. Выделенное вещество очищают пропусканием нагретого до кипения раствора вещества в петролейном эфире через слой (1 см) окиси алюминия. Перекристаллизовывают из петролейного эфира.

#### Общая методика получения пирроло[3,2-*f*]хинолонов (В)

Енамин нагревают 15–20 мин в кипящем дифениле. По окончании реакции еще теплую реакционную массу выливают в петролейный эфир. Выпавший осадок отфильтровывают и многократно промывают горячим петролейным эфиром от дифенила. Очищают на пластинках с толстым незакрепленным слоем окиси алюминия в этилацетате со следами метанола и аммиака (соединения **16, 17, 18**), перекристаллизацией из спирта (соединение **15**), толуола (соединение **19**).

*Этиловый эфир (Z)-3-(1,2,3,6-тетраметил-1H-5-индолиламино)бут-2-еновой кислоты (5)* получают по методике (А) из 0,501 г (1.67 ммоль) аминоиндола **2** и 0,5 г (3,85 ммоль) ацетоуксусного эфира. Выход 0,537 г (67 %).

*Этиловый эфир (Z)-3-(6-метокси-1,2,3-триметил-1H-5-индолиламино)бут-2-еновой кислоты (6)* получают аналогично из 0,5 г (2,45 ммоль) аминоиндола **4** и 0,46 г (3,54 ммоль) ацетоуксусного эфира. Выход 0,485 г (63 %).

*Этиловый эфир (Z)-4,4,4-трифтор-3-(2,3,6-триметил-1H-5-индолиламино)бут-2-еновой кислоты (7)* получают по методике (Б) из 0,5 г (2.86 ммоль) аминоиндола **1** и 0,7 г (3,8 ммоль) трифторацетоуксусного эфира. Выход 0,64 г (66 %).

*Этиловый эфир (Z)-4,4,4-трифтор-3-(1,2,3,6-тетраметил-1H-5-индолиламино)бут-2-еновой*

кислоты (**8**) получают аналогично из 0,51 г (2,71 ммоль) аминоиндола **2** и 0,65 г (3,53 ммоль) трифторацетоуксусного эфира. Выход 0,85 г (88 %).

Этиловый эфир (*Z*)-4,4,4-трифтор-3-(6-метокси-1,2,3-триметил-1*H*-5-индолиламино)бут-2-еновой кислоты (**10**) получают двумя способами: 1. По методике (А) из 0,625 г (3,06 ммоль) аминоиндола **4**, но используют трифторацетоуксусный эфир, при этом образуются два соединения – амид **14** и енамин **10** в соотношении 6:1 соответственно. Соединение **10** выделяют осаждением гексаном из фильтра, оставшегося после отделения осадка амида, выход 0,106 г (9%). 2. По методике (Б) из 0,503 г (2,47 ммоль) аминоиндола **4** и 0,6 г (3,26 ммоль) трифторацетоуксусного эфира, выход 0,623 г (68%).

1,2,3,5,7-Пентаметил-6,9-дигидро-3*H*-пирроло[3,2-*f*]хинолин-9-он (**15**) получают по методике (В) из 0,308 г (0,1 ммоль) енамина **5**, выход 0,224 г (86%).

5-Метокси-1,2,3,7-тетраметил-6,9-дигидро-3*H*-пирроло[3,2-*f*]хинолин-9-он (**16**) получают анало-

гично из 0,137 г (0,43 ммоль) енамина **6**, выход 0,086 г (73%).

1,2,5-Триметил-7-трифторметил-6,9-дигидро-3*H*-пирроло[3,2-*f*]хинолин-9-он (**17**) получают аналогично из 0,069 г (0,2 ммоль) енамина **7**, выход 0,047 г (76%).

1,2,3,5-Тетраметил-7-трифторметил-6,9-дигидро-3*H*-пирроло[3,2-*f*]хинолин-9-он (**18**) получают аналогично из 0,214 г (0,6 ммоль) енамина **8**, выход 0,145 г (78 %).

5-Метокси-1,2,3-триметил-7-трифторметил-6,9-дигидро-3*H*-пирроло[3,2-*f*]хинолин-9-он (**19**) получают аналогично из 0,118 г (0,32 ммоль) енамина **10**, выход 0,087 г (84%).

#### СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Ямашкин С. А., Кучеренко Н.Я., Юровская М. А. // ХГС. 1997. № 8. С. 1080.
2. Ямашкин С.А., Юровская М.А. // ХГС. 1999. № 10. С. 1336.

Поступила в редакцию 17.10.03

## SYNTHESES OF METHYL-, METHOXYPYRROLO[3,2-*f*]QUINOLONES AND THEIR FLUORINATIONS ANALOGUES FROM 6-SUBSTITUTED-5-AMINOINDOLES

S.A. Yamashkin, G.A. Romanova, M.A. Yurovskaya

(Division of Organic Chemistry)

The studied reactions of ethyl acetoacetate and ethyl 4,4,4-trifluoroacetoacetate with 2,3,6-trimethyl-, 1,2,3,6-tetramethyl-, 2,3-dimethyl-6-methoxy- and 1,2,3-trimethyl-6-methoxy-5-aminoindoles. In last is discovered actuating influence upon reactionary ability 1-CH<sub>3</sub> groups both on stage of the formation enamincrotonates and at cyclization. Designed methods of the syntheses some pyrrolo[3,2-*f*]quinolones and their fluorinations analogues.