

Таблица 2

Характеристики синтезированных соединений

Соединение	Выход, %	Т. пл., °С	Брутто-формула
II	66,1	174—5	C <sub>19</sub> H <sub>22</sub> NCIO <sub>4</sub>
III	59,2	219—20	C <sub>21</sub> H <sub>24</sub> NCIO <sub>4</sub>
IV	94,6	147—8 [6]	C <sub>18</sub> H <sub>16</sub> O <sub>5</sub>
V	85	169—70	C <sub>18</sub> H <sub>15</sub> BrO <sub>5</sub>
VI	74	199—201	C <sub>22</sub> H <sub>26</sub> NCIO <sub>5</sub>
VII	80,7	209—10	C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> NCIO <sub>6</sub>
VIII	73,9	154—5	C <sub>18</sub> H <sub>15</sub> ClO <sub>5</sub>
IX	80	188—9	C <sub>18</sub> H <sub>14</sub> ClBrO <sub>5</sub>
X	84,1	195—6	C <sub>22</sub> H <sub>25</sub> Cl <sub>2</sub> NO <sub>5</sub>
XI	86,8	229—30	C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> Cl <sub>2</sub> NO <sub>6</sub>
XII	75,1	208—10	C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> Cl <sub>2</sub> NO <sub>5</sub>
XIV	71,8	205	C <sub>16</sub> H <sub>11</sub> BrO <sub>5</sub>
XV	40,8	99—100	C <sub>20</sub> H <sub>21</sub> NO <sub>5</sub>
XVI	61,6	134—5	C <sub>20</sub> H <sub>19</sub> NO <sub>8</sub>
XVII	79,4	139—40	C <sub>20</sub> H <sub>21</sub> NO <sub>5</sub>

Примечание. Соединение II перекристаллизовано из ацетона — спирта, 1:1, а III—XII и XIV—XVII — из *i*-PrOH.

#### Экспериментальная биологическая часть

Противомикробную активность полученных соединений II, III, X, XI, XVI, XVII изучали в отделе химиотерапии инфекционных заболеваний (зав. — проф. Е. Н. Падейская). Активность соединений изучали методом двукратных серийных разведений на жидких питательных средах. В опытах с бактериями *Staphylococcus aureus* 209P, *E. coli* ATCC 25922, *Bac. Subtilis* ATCC 6633 использовали бульон Хоттингера, в опытах с дрожжеподобным грибом *Candida albicans* 1755 и дерматофитом *Micoglyphum canis* 3/84 применяли среду Сабуро. Посевная доза для бактерий составляла  $1 \cdot 10^{-5}$  КОЕ/мл, для грибов —  $1 \cdot 10^{-6}$  КОЕ/мл. Посевы бактерий инкубировали при температуре 37 °С на 18—20 ч; грибов — при 25 °С на 1 сут в случае *Candida alb.* и на 5 сут в опытах с дерматофитами. Соединения испытывали начиная с концентраций 250—125 мкг/мл и ниже.

Установлено, что соединения XVI и XVII обладают умеренной активностью в отношении *Staphylococcus aureus* и *Bac. Subtilis*. Минимальная подавляющая концентрация составляет 15,6 мкг/мл в отношении *Staphylococcus aureus* и 15,6—

31,2 мкг/мл в отношении *Bac. subtilis*. В отношении остальных микроорганизмов изученные соединения в концентрации 125—250 мкг/мл активности не проявили.

В отношении вируса гриппа синтезированные соединения оказались неактивными.

Таким образом, переход от аминотетильных производных ряда бензо[*g*]индола и нафто[1,2-*b*]тиофена к аналогичным соединениям ряда нафто[1,2-*b*]фурана ведет к падению антибактериальной и исчезновению противовирусной активности.

#### SUMMARY

Aminomethyl derivatives of naphtho[1,2-*b*]furan were synthesized. The respective 4-aminomethyl derivatives were produced from 2-methyl-3-ethoxycarbonyl-5-hydroxynaphtho[1,2-*b*]furan by the Mannich reaction; oxidation gave rise to a 4,5-dioxy[1,2-*b*]furan derivative (I); acetylation yielded an *O*-acetyl derivative (II), and chlorination produced 4-chloronaphthofuran (III) that was converted to a more stable *O*-acetyl derivative (IV). The respective 2-aminomethyl derivatives were synthesized from I, II, IV naphthofurans by a series of consecutive conversions involving stages of bromination and replacement of bromine by an amine residue. The synthesized aminomethyl derivatives were tested for biological activity and were found to show a weak antimicrobial activity.

#### ЛИТЕРАТУРА

1. Гринев А. Н., Фросин В. Н., Терентьев А. П. // Журн. общ. химии. — 1956. — Т. 25. — С. 523—526.
2. Гринев А. Н., Хунь Ци-Цзюнь, Терентьев А. П. // Там же. — 1960. — Т. 30. — С. 4030—4034.
3. Гринев А. Н., Хунь Ци-Цзюнь, Терентьев А. П. // Там же. — 1962. — Т. 32. — С. 1951—1957.
4. Нестерова И. Н., Николаева И. С., Голованова Е. А., Фомина А. Н. // Хим.-фарм. журн. — 1989. — № 1. — С. 45—47.
5. Федорова И. Н., Шведов В. И., Силин В. А. и др. // Там же. — 1987. — № 11. — С. 1320—1322.
6. Хунь Ци-Цзюнь. Исследования в ряду нафтофуранов и бензиндолов: Автореф. дис. ... канд. хим. наук. — М., 1961.
7. Kuckländer U. // Justus Liebigs Ann. Chem. — 1978. — N 1. — S. 140—149.

Поступила 12.12.89

© КОЛЛЕКТИВ АВТОРОВ, 1990

УДК 615.849.015.25:547.745].012.1

Б. В. Голомолзин, Э. А. Тарахтий, И. И. Мудрецова, В. Н. Федосова, Н. И. Латош, М. И. Ермакова, Ф. П. Сидельковская, В. А. Пономаренко

#### СИНТЕЗ И РАДИОЗАЩИТНЫЕ СВОЙСТВА

##### 1, 3-БИСЦИКЛОАЛКИЛЕНИМИНОПРОПАНОЛ-2

Уральский политехнический институт им. С. М. Кирова; Институт экологии растений и животных Уральского отделения АН СССР, Свердловск; ИОХ им. Н. Д. Зелинского АН СССР, Москва

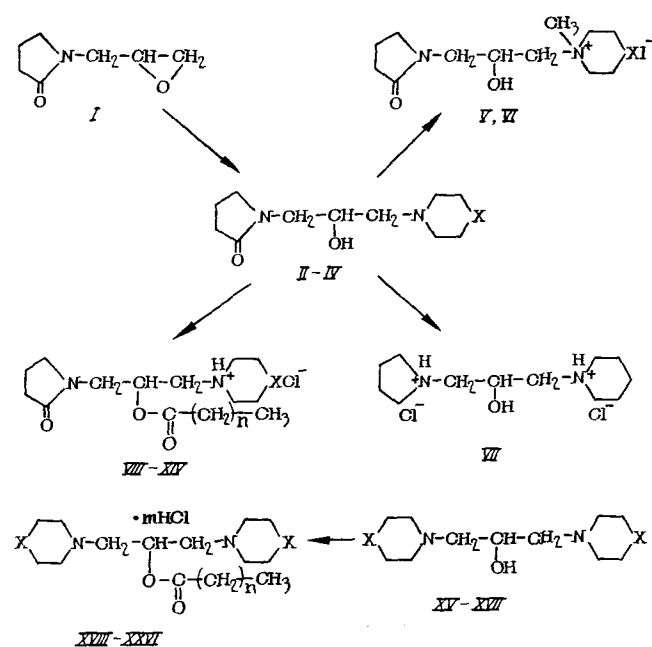
Среди  $\alpha, \omega$ -биспиридиноалканов обнаружены вещества с выраженной радиозащитной активностью [1]. Представлял интерес поиск новых радиопротекторов, содержащих в качестве фармакофора группировку аминоканана, а в качестве носителя — остаток пирролидона, а также остатки природных жирных кислот, изменяющие гидрофобно-гидрофильный баланс в сторону повышения биодоступности вещества.

Взаимодействием *N*-(2,3-эпоксипропил)пирролидона-2 (I) с циклоалкилениминами получены 1-(2-оксопирролидинил)-3-циклоалкилениминопропанола-2 (II—IV), из которых действием йоди-

стого метила получены йодметилаты V, VI. После восстановления II алюмогидридом лития выделен в виде дигидрохлорида 1-пирролидино-3-пиперидинопропанол-2 (VII). Ацилированием соединений II—IV хлорангидридами различных жирных кислот получены гидрохлориды 1-(2-оксопирролидинил)-2-ацилокси-3-циклоалкилениминопропанола (VIII—XIV). Аналогичное ацилирование 1,3-бисциклоалкилениминопропанола-2 (XV—XVII) приводит к гидрохлоридам 1,3-бисциклоалкиленимино-2-ацилоксипропанов (XVIII—XXVI).

В ИК-спектрах йодметилатов V, VI имеют полосы поглощения гидроксильных групп (325—

3247  $\text{cm}^{-1}$ ). ПМР-сигналы протона у центрального атома С пропильной цепи имеют химические сдвиги, хорошо совпадающие с величиной, рассчитанной для приведенных структур V и VI по правилу аддитивности эффективных вкладов экранирования заместителей [3]; в то же время экспериментальные величины значительно отличаются от рассчитанных для альтернативных структур, имеющих первичную спиртовую группу. В ИК-спектрах VIII—XIV исчезает полоса поглощения спиртовой группы OH, наблюдающаяся у исходных соединений II—IV ( $3255\text{—}3280\text{ cm}^{-1}$ ), и появляется вторая полоса карбонильного поглощения сложноэфирной группировки ( $1735\text{—}1750\text{ cm}^{-1}$ ). Последняя наблюдается также и у соединений XVIII—XXVI при отсутствии поглощения спиртового гидроксидла.



X =  $\text{CH}_2$  (II, V, VII—IX, XV, XVIII—XX),  $(\text{CH}_2)_2$  (III, X, XI, XVI, XXI, XXII), O (IV, VI, XII—XIV, XVII, XXIII—XXV); n = 1 (XVIII, XXIII), 4 (XII, XXIV), 6 (X, XXI), 10 (XIII, XIX, XXV), 14 (VIII, XI, XX, XXII, XXVI), 16 (IX, XIV); m = 1 (XXIII—XXVI), 2 (XVIII—XXII).

Изучены токсичность и радиозащитная активность соединений II, IV—XIV, XVIII—XXVI. Токсичность их проявляется в судорожном действии в течение 5—40 мин после введения с последующим снижением двигательной активности, угнетением и гибелью на 1—3-и сутки с поражением желудочно-кишечного тракта. При сравнении соединений, имеющих одинаковую длину углеводородной цепи жирнокислотного остатка, четко прослеживается наименьшая токсичность морфолиновых производных — IV, XII—XIV, XXIII—XXVI (см. табл. 1). Соединения, содержащие в фармакофорной части пиперидиновые и гексаметилениминовые остатки, более токсичны. Токсичность четвертичных солей V, VI значительно выше, чем у соответствующих оснований II, IV. Наблюдается закономерное изменение токсичности в зависимости от структуры носителя — длины углеводородной цепи жирнокислотного остатка: с увеличением длины цепи токсичность уве-

личивается, достигая максимума при  $n=10$  (соединения XIII, XIX, XXV).

Среди производных пирролидонсодержащих аминоспиртов заметная радиозащитная активность обнаружена лишь у соединений IV и XI причем образование четвертичной соли резко снижает активность (сравни IV и VI). Большой эффект показали производные 1,3-бис(циклоалкиленимино)пропанолов: выраженная радиозащитная активность обнаружена у соединений XIX, XX, XXII и XXV. Эти данные характеризуют противолучевой эффект двух приведенных типов фармакофорных групп. Однако несимметричный 1,3-бис(циклоалкиленимино)пропанол-2 VII обнаружил высокий и длительный эффект: в разных опытах выжили от 85 до 94 % облученных животных при введении вещества за 60 мин до облучения, значительный эффект (65—70 % выживания) сохраняется и через 120 мин после введения вещества; увеличивается и средняя продолжительность жизни. В рядах O-ацилированных производных с увеличением длины углеводородной цепи кислотного остатка радиозащитная активность закономерно возрастает: сравни ряды X—XI, XVIII—XX, XXI—XXII, XXIII—XXV. Фактор увеличения дозы для соединения XVIII составляет 1,1. Такое возрастание биологической активности, по-видимому, связано с увеличением липофильности вещества и его биологической доступности.

Таким образом, в результате проведенного исследования в ряду производных алифатических аминоспиртов найдены вещества с выраженной радиозащитной активностью и подтверждена перспективность повышения липофильности вещества для увеличения его радиозащитного эффекта.

#### Экспериментальная химическая часть

Индивидуальность веществ контролировали методом ТСХ на пластинках Silufol в системе бутанол — вода —  $\text{AcOH}$ , 2:2:1. Для всех соединений данные элементного анализа удовлетворительно совпадают с расчетными. ИК-спектры сняты на приборе IR-20 (ГДР) в пасте с вазелиновым маслом.

**1-(2-Оксопирролидинил-1)-3-циклоалкилениминопропанол-2 (II—IV).** К раствору 37,0 г (0,2 моля) I в 100 мл бензола добавляют 0,26 моля циклоалкиленимина (пиперидина, гексаметиленмина или морфолина) и выдерживают при комнатной температуре 1 сут. Затем от реакционной массы отгоняют бензол, остаток растворяют в 150—200 мл петролейного эфира. После выдержки при  $0^\circ\text{C}$  в течение нескольких часов кристаллизуется продукт (II—IV) — бесцветные кристаллы, хорошо растворимые в воде и большинстве органических растворителей. Осадок отфильтровывают и перекристаллизовывают из петролейного эфира (табл. 2).

**Йодметилаты 1-(2-оксопирролидинил-1)-3-циклоалкилениминопропанолов-2 (V, VI).** К раствору 0,01 моля II или III в 30 мл бензола добавляют 2,8 г (0,02 моля) йодистого метила и выдерживают при комнатной температуре 1 сут. Выпавший осадок продукта V или VI отфильтровывают и перекристаллизовывают из абсолютного этанола — бесцветные кристаллы, хорошо растворимые в воде (см. табл. 2).

**Дигидрохлорид 1-пиперидино-3-пирролидинопропанола-2 (VII).** К раствору 2,8 г (0,012 моля) II в 100 мл безводного этилового эфира при комнатной температуре добавляют по каплям 20 мл 4 % эфирного раствора алюмогидрида лития. Реакционную массу кипятят 6 ч, затем добавляют еще 20 мл 4 % раствора алюмогидрида лития и вновь кипятят 6 ч. Реакционную массу охлаждают, добавляют последовательно 2 мл воды, 4 мл 20 % водного раствора едкого натра и 4 мл воды. Эфирный раствор фильтруют, сушат сульфатом натрия и отгоняют эфир. 2,2 г маслообразного остатка растворяют в 10 мл эфира и добавляют насыщенный эфирный раствор HCl до полного осаждения продукта VII. Последний отфильтровывают и очищают 2-кратным переосаждением из

## Токсичность и радиозащитная активность соединений

Соединение	СД <sub>50</sub> , мг/кг	Доза облучения, Гр	Доза вещества, мг/кг	Время введения до облучения, мин	Выживание к 30-м суткам, %	Число животных в опыте	СПЖ, сут
II	>622,4	8,0	226,3	15	0	19	11,2
				30	5,0	20	10,9
			339,5	15	5,0	20	12,0
IV	>1712,2	8,0	228,3	30	0	20	13,5
				15	0	18	23,7
			684,9	30	10,0	20	12,1
				15	58,5	38	12,4
			913,2	30	15,0	40	10,8
V	272,5	8,0	127,1	15	15,0	20	12,0
				30	0	20	11,3
				15	10,0	30	10,0
VI	>1110,7	8,0	370,2	30	0	30	9,5
				15	0	18	11,8
			740,4	30	0	19	11,7
VII	630,4	8,1	222,5	15	0	20	9,5
				30	0	20	5,8
			427,9	15	5	20	0
				30	50,0	20	7,4
				60	31,6	19	5,5
VIII	260,6	7,7	112,3	120	89,7+2,7	58	15,8+3,3
				30	67,5	40	16,4
			112,3	30	14,3	14	8,0
IX	317,6	7,7	105,8	90	0	14	9,0
				10	0	21	9,6
				30	0	35	8,4
X	262,0	8,0	105,8	30	0	14	8,0
				10	7,1	21	6,4
			100,7	30	23,0	21	12,4
XI	422,5	8,1	188,0	45	14,2	21	12,8
				5	4,8	21	11,9
				15	40,0	20	9,5
XII	2500,0	8,1	296,9	60	33,0	21	15,3
			1187,8	30	28,6	21	13,9
				10	0	21	6,0
XIII	183,3	8,1	75,1	45	0	21	6,9
				10	0	21	10,7
				30	0	34	10,5
XIV	446,2	8,0	18,8	30	4,8	21	11,4
			196,0	30	0	20	7,2
			196,0	10	0	35	7,2
XVIII	1094,5	8,1	508,9	30	0	21	9,6
				10	0	21	8,9
				30	7,5	53	9,9
XIX	114,9	8,1	15,0	10	38,1	21	10,8
				45	0	21	13,4
			37,5	30	23,8	21	13,1
XX	258,1	8,1	107,5	10	60,0	20	11,0
				30	28,5	21	12,5
				45	47,6	21	14,2
XXI	112,9	8,1	13,1	30	0	20	6,9
			51,7	10	0	20	8,2
				30	0	20	7,9
XXII	186,8	8,1	58,4	10	35,0	20	12,8
				45	33,0	21	14,3
				60	0	21	10,8
XXIII	2273,6	8,1	219,7	30	0	21	9,0
			1121,5	10	0	21	9,7
				30	4,8	21	9,0
XXIV	1638,5	8,1	1094,8	10	0	21	8,2
				30	0	21	10,5
				30	0	10	10,7
XXV	309,9	7,7	801,7	15	0	42	10,5
			131,1	60	21,4	21	13,3
				10	19,0	21	13,3
XXVI	808,3	7,7	368,8	30	0	21	6,8
				30	17,1	35	7,9
			368,8	30	0	14	8,1
Контроль	—	8,0	—	—	6,0	130	10,3
			—	—	3,8	341	9,3
			—	—	0	364	7,0

абсолютного этанола абсолютным эфиром — бесцветные кристаллы, хорошо растворимые в воде, выход 1,84 г (см. табл. 1).

Гидрохлориды 1-(2-оксопирролидинил)-2-ацилкси-3-циклоалкиленминопропанов (VIII—XIV) и 1,3-бис(циклоалкиленмино)-2-ацилксипропанов (XVIII—XXVI). К раствору

0,03 моля одного из соединений II—IV, XV, XVII (получены по [4]), XVI (получен по [2]) в 50 мл бензола прибавляют в течение 30 мин раствор 0,03 моля одного из хлорангидридов пропионовой, капроновой, каприловой, лауриновой, пальмитиновой, стеариновой кислоты, поддерживая температуру

## Соединения II—XIV, XVIII—XXVI

Соединение	Выход, %	Т. пл., °С	Брутто-формула	ИК-поглощение, см <sup>-1</sup>		
				ОН	С=О пирролидон	С=О сложный эфир
II	68	51—2	C <sub>12</sub> H <sub>22</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	3255	1670	—
III	67	49—50	C <sub>13</sub> H <sub>24</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	3280	1665	—
IV	64	76—7	C <sub>11</sub> H <sub>20</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	3255	1667	—
V	80	163—4	C <sub>13</sub> H <sub>25</sub> IN <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	3254	1665	—
VI	60	143—5	C <sub>12</sub> H <sub>23</sub> IN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	3247	1669	—
VII	52	227—30	C <sub>12</sub> H <sub>26</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O	3260	—	—
VIII	43	103—4	C <sub>28</sub> H <sub>53</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	—	1685	1745
IX	34	94—6	C <sub>30</sub> H <sub>57</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	—	1690	1745
X	61	175—6	C <sub>21</sub> H <sub>39</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	—	1697	1742
XI	40	167—8	C <sub>29</sub> H <sub>55</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	—	1697	1741
XII	42	140—2	C <sub>17</sub> H <sub>31</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>4</sub>	—	1700	1745
XIII	41	143—5	C <sub>23</sub> H <sub>43</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>4</sub>	—	1698	1745
XIV	35	133—5	C <sub>29</sub> H <sub>55</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>4</sub>	—	1695	1745
XVIII	42	240—2	C <sub>16</sub> H <sub>32</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	—	—	1750
XIX	35	130—1	C <sub>25</sub> H <sub>50</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> ·H <sub>2</sub> O	—	—	1740
XX	32	127—9	C <sub>29</sub> H <sub>58</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	—	—	1740
XXI	30	120—1	C <sub>23</sub> H <sub>46</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> ·H <sub>2</sub> O	—	—	1745
XXII	31	122—4	C <sub>31</sub> H <sub>62</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> ·H <sub>2</sub> O	—	—	1750
XXIII	49	188—90	C <sub>14</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>4</sub> ·H <sub>2</sub> O	—	—	1745
XXIV	46	174—6	C <sub>17</sub> H <sub>33</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>4</sub>	—	—	1735
XXV	30	148—50	C <sub>23</sub> H <sub>45</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>4</sub>	—	—	1735
XXVI	32	144—5	C <sub>27</sub> H <sub>53</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>4</sub>	—	—	1735

реакционной массы 25—30 °С охлаждением. Затем кипятят на водяной бане 1 ч. В случае пропионил-, капронил-, каприлоилпроизводных выпавший в конце реакции осадок отфильтровывают и перекристаллизовывают из ацетона или бутанола. В случае лауроил-, пальмитоил-, стеарилоилпроизводных по окончании реакции отгоняют бензол и остаток дважды перекристаллизовывают из ацетона. Полученные продукты — бесцветные кристаллы, хорошо растворимые в воде (см. табл. 1).

## Экспериментальная биологическая часть

Испытания токсичности и радиозащитной активности проводили на половозрелых мышах линии BAL B. Водные растворы веществ вводили внутривентриально из расчета 0,2 мл на 20 г массы животного. Токсичность оценивали по реакции животных на введение вещества и по их острой гибели. Зависимость гибели мышей от дозы вещества обрабатывали пробит-методом и вычисляли CD<sub>16</sub>, CD<sub>50</sub>, CD<sub>84</sub>.

Радиозащитную активность оценивали по 30-дневной выживаемости и средней продолжительности жизни животных, облученных гамма-излучением <sup>137</sup>Cs в дозах, вызывающих 96—100 % летальность (7,7—8,1 Гр). Мощность дозы 1,05 Гр/мин, установка «ИГУР-1». В ряде случаев получены данные с облучением в дозах, дающих смертность ≥50 %; вычислен ФУД. Вещества в дозах 1/8 CD<sub>16</sub> и 1/2 CD<sub>16</sub> вводили за 10—120 мин до облучения. Контрольные животные

получали физиологический раствор, облучались в одной посадке с подопытными животными. Данные представлены в табл. 1.

## SUMMARY

The paper deals with a search for new radioprotective agents containing an aminoalkane group as a pharmacophore and a pyrrolidone residue and naturally occurring fatty acid residues, which modify the hydrophobic-hydrophilic balance towards an increase in the bioavailability of an agent, as a vehicle.

## ЛИТЕРАТУРА

1. Ермакова М. И., Белова И. М., Латош Н. И. и др. // Хим.-фарм. журн.— 1987.— № 6.— С. 699—702.
2. Мамедов Ш., Гаджиев Ф. Р., Хадыров Д. Н. // Журн. орган. химии.— 1966.— Т. 2, № 4.— С. 653—656.
3. Сильверстейн Р., Басслер Г., Мерилл Т. // Спектроскопическая идентификация органических соединений.— М., 1977.— С. 380—384.
4. Gero A. // J. Amer. chem. Soc.— 1954.— Vol. 76, N 4.— P. 5158—5159.

Поступила 14.11.89

© КОЛЛЕКТИВ АВТОРОВ, 1990

УДК 615.281.012.1.07

Ю. Н. Портнов, В. Г. Забродняя, С. Н. Булага, Л. Н. Филитис, О. Ю. Амелькин, В. А. Силин, О. В. Бакланова, Е. Н. Падейская

### СИНТЕЗ И ПРОТИВОМИКРОБНАЯ АКТИВНОСТЬ ГИДРОХЛОРИДОВ 2-АМИНО-3-АРИЛАЗОИНДОЛОВ

НИИ технологии и безопасности лекарственных средств, Купавна Московской области, ВНИХФИ им. С. Орджоникидзе, Москва

Известно, что соединения индольного ряда, имеющие в β-положении арилзагоруппу, проявляют туберкулолостатическую активность [1]. Продолжая исследование в области производных 2-аминоиндола, мы синтезировали неизвестные ранее 2-амино-3-арилазоиндолы (IIa-n) и изучили их противомикробную активность.

Синтез 2-амино-3-арилазоиндолов осуществлен сочетанием 2-амино-1-метилиндолов (I) с солями арилдиазония. В ряду 2-аминоиндолов реакции электрофильного замещения (бромирование, нитрование, сульфирование) дают продукты замещения в положении 3 [3]. И только в сильно кислых средах, где 2-аминоиндол существует в иминоин-