

НИТРОСОДЕРЖАЩИЕ N-АРИЛАЗИРИДИНЫ: СИНТЕЗ И СТРОЕНИЕ

Макаренко С.В.,^a Лысенко К.А.,^b Смирнов А.С.,^a Берестовицкая В.М.^a

^aРоссийский государственный педагогический университет имени А.И. Герцена, 191186, Россия, Санкт-Петербург, наб. р. Мойки, 48, e-mail: kohrgpri@yandex.ru

^bИнститут элементоорганических соединений, 119991, Россия, Москва, ул. Вавилова 28, В-334

Азиридины (этиленимины) являются хорошими алкилирующими агентами, что обуславливает их мутагенные и токсические свойства. Замещенные азиридины широко применяются в качестве лекарственных средств. В частности, триэтиленмининфосфор-тиоамид (тиоТЭФ) используется в медицинской практике как противоопухолевый препарат¹. Природное соединение митомицин С, содержащее в молекуле азириди-новое кольцо, обладает антибиотической и противоопухолевой активностью².

Впервые на основе 1-бром-1-нитро-2-трихлорметилэтена (1) разработан препартивно удобный двухстадийный метод синтеза новых полифункциональных азиридинов. На первой стадии в результате конденсации гем-броннитроэтена (1) с ариламиналами получаются (в виде смесей эритро- и трео-диастереомеров) продукты нуклеофильного присоединения (2-5) с хорошими выходами/. Кипячение их в спиртовом растворе ацетата калия, приводит к внутримолекулярному N-алкилированию с отщеплением HBr и образованием нитросодержащих N-арилазиридинов (6-9).

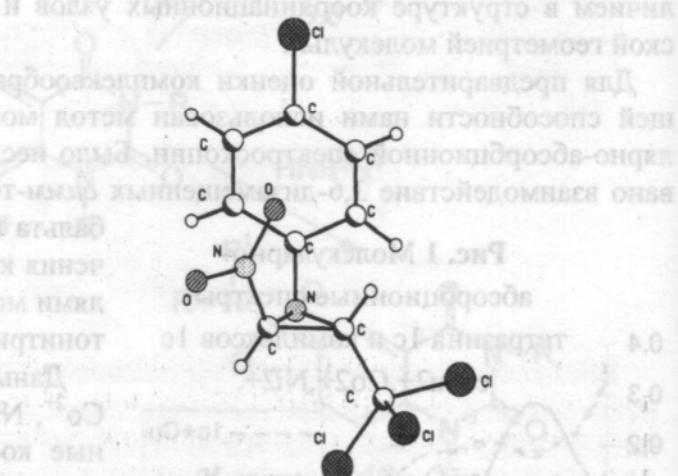
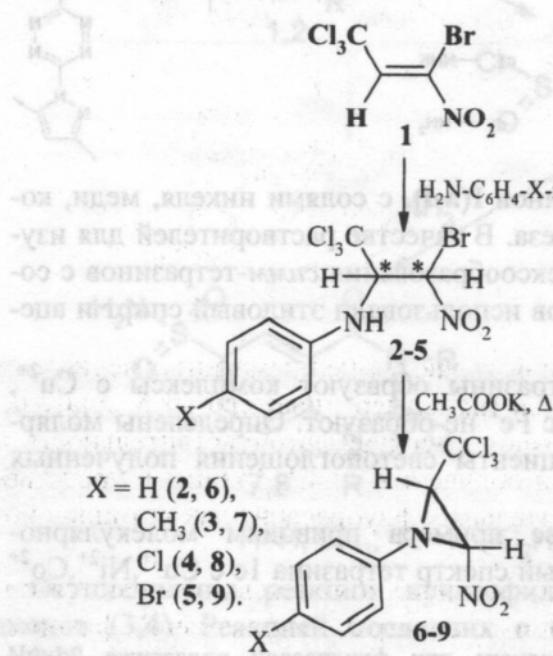


Рис. Структура 2-нитро-3-трихлорметил-1-(*n*-хлорфенил)азиридина (8) по данным рентгеноструктурного анализа.

Строение всех синтезированных веществ установлено методами ИК, ЯМР ^1H , ^{13}C спектроскопии и масс-спектрометрии, а геометрические структуры представителей ряда азиридина (8, 9) изучены методом рентгеноструктурного анализа.

Литература

1. М.Д. Машковский. Лекарственные средства. М.:«Новая Волна», 2005. С. 973.
2. Т. Джилкрист. Химия гетероциклических соединений. М.:«Мир», 1996. С. 403.