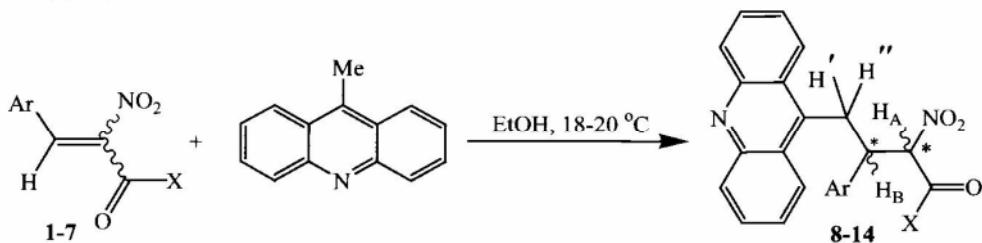


ГЕМИНАЛЬНО АКТИВИРОВАННЫЕ НИТРОСТИРОЛЫ В РЕАКЦИЯХ С МЕЗО-МЕТИЛАКРИДИНОМ

Р.И. Байчурина, Л.В. Байчурина, В.М. Берестовицкая

Российский государственный педагогический университет им. А.И. Герцена
kohrgpu@yandex.ru

Ранее на кафедре органической химии РГПУ им. А.И. Герцена было показано, что мезометилакридин как СН-кислота за счет метильной группы способен вступать в реакции с 2-алкил(арил, гетерил)-1-нитроэтенами с образованием продуктов присоединения[1-3]. Нами впервые осуществлено взаимодействие мезометилакридина с β -нитrostиролами, содержащими в *гем*-положении к нитрофункции карбонильную [C(O)Me, C(O)Ph] и сложноэфирную [COOEt] группы (1-7). Реакции протекают в этаноле при комнатной температуре без дополнительных катализитических агентов и приводят к продуктам Ad_N (8-14); выходы достигают 89%.



X = Me: Ar = Ph (1, 8), 4-MeOC₆H₄ (2, 9), 4-ClC₆H₄ (3, 10), 4-O₂NC₆H₄ (4, 11);
X = Ph: Ar = Ph (5, 12), 4-MeOC₆H₄ (6, 13); X = OEt: Ar = 4-O₂NC₆H₄ (7, 14)

В ИК спектрах соединений (8-14) присутствуют интенсивные полосы поглощения валентных колебаний несопряженных нитро- (1555-1565, 1345-1360 cm^{-1}) и карбонильной (1695-1750 cm^{-1}) групп. Картина спектров ЯМР ¹Н веществ (8-14) характерна для спектров смесей диастереомеров в разных соотношениях. Так, в спектре ЯМР ¹Н (CDCl₃) соединения (8) присутствует удвоенный набор сигналов всех структурных фрагментов. Метиновый протон H_A проявляется в виде дублета при 5.86 м.д. (³J_{AB} 10.20 Гц), метиновый протон H_B и метиленовые протоны H' и H'' – в виде мультиплетов при 4.25, 4.05, 3.97 м.д. для одного и 5.88 (³J_{AB} 10.40 Гц), 4.25, 4.03, 3.82 м.д. для второго диастереомера (соотношение ~1 : 1), протоны ацетильной группы фиксируются в виде синглетов при 2.04 и 2.46 м.д.

Таким образом, нами показано, что взаимодействие *гем*-ацил(алкоксикарбонил)-нитrostиролов с мезо-метилакридином протекает в достаточно мягких условиях и приводит к михаэлевским аддуктам линейного строения – α -нитрокетонам и α -нитроэфирам, содержащим в молекулах активную фармакофорную структуру акридина. Полученные вещества представляют несомненный практический интерес, так как многие соединения, содержащие в своем составе акридиновый фрагмент, используются как лекарственные средства. Например, противомалярийный препарат *акрихин*, антибактериальное средство *риванол*, обратимые ингибиторы холинэстеразы *такрин* и *велнакрин*, применяемые против болезни Альцгеймера.

Список литературы

- Полянская А.С. Взаимодействие нитроолефинов с веществами с активными метильными группами. Дисс. ... канд. хим. наук. Ленинград: 1958. 198 с.
- Перекалин В.В., Полянская А.С. // ДАН СССР. 1957. Т. 112. № 3. С 441.
- Перекалин В.В., Полянская А.С. // ЖОХ. 1957. Т. 27. Вып. 7. С. 1933.