

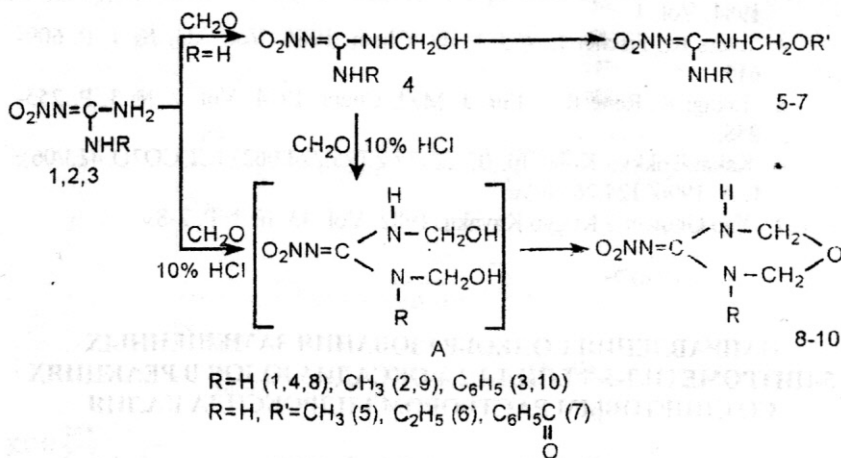
СИНТЕЗ ОКСАДИАЗИНОВ НА ОСНОВЕ 2-НИТРОГУАНИДИНА И ЕГО АНАЛОГОВ

Т.А. Новикова, Э.Л. Метелкина, Н.Н. Абоскалова, В.М. Бересговичкая

Российский государственный педагогический университет
им. А.И. Герцена
(Санкт-Петербург)

2-Нитрогуанидин и его производные проявляют свойства энергоемких [1-3] и биологически активных [4] соединений, некоторые из них рекомендованы в качестве противораковых препаратов [5], а также инсектицидов [6]. Кроме этого 2-нитрогуанидин можно рассматривать как синтон в синтезе обогащенных атомами азота гетероциклических соединений.

Проведенное нами исследование реакции 2-нитрогуанидина (1) с формальдегидом позволило упростить способ синтеза 1-гидрокси-метил-2-нитрогуанидина (4) – в отличие от литературной прописи [7] он получен в отсутствие катализатора. Соединение (4) при действии спиртов или хлористого бензоила легко превращается в соответствующие алкоксильные (5,6) и бензоильные (7) производные.



В условиях кислотного катализа при нагревании взаимодействие 2-нитрогуанидина (1) и его замещенных (2,3) с формальдегидом приводит к 4-нитроиминотетрагидро-1,3,5-оксадиазинам (8-10). По-видимому, процесс идет через промежуточное образование диметилола (А) с последующей его гетероциклизацией за счет дегидратации; дополнительным подтверждением такого маршрута реакции является образование оксадиазина (8) из монометильного производного (4) путем его нагревания с избытком формальдегида в присутствии соляной кислоты.

Строение полученных соединений подтверждено спектральными методами. В частности, в спектрах ЯМР ^1H соединений (8-10) присутствуют сигналы протонов всех структурных фрагментов.

Таблица

Данные спектров ЯМР ^1H
4-нитропимнотетрагидро-1,3,5-оксадиазинол (8-10)

№ соед.	R	Спектр ПМР (δ , м.д.) в ДМСО- d_6		
		NH	CH ₂	R
8	H	9.35 c (1H)	5.10 c (4H)	9.35 c (1H)
9	CH ₃	9.85 c (1H)	5.10c (4H)	3.10 c (3H, CH ₃)
10	C ₆ H ₅	10.13 c (1H)	5.22 c (2H) 5.32 c (2H)	7.53 c (5H, C ₆ H ₅)

Литература

1. McKay A.F., Wright G.F. // J. Am. Chem. Soc. 1948. Vol. 70. № 12. P. 3390-3394.
2. McKay A.F., Wright G.F. // J. Am. Chem. Soc. 1949. Vol. 71. № 6. P. 1970-1973.
3. Urbanski T. Technology of explosives. Warsaw: Pergamon Press, 1984. Vol. 4.
4. Evers R., Fischer E. // J. Prakt. Chem. 1985. Vol. 324. № 4. P. 609-615.
5. Takagi K, Rene R. // Eur. J. Med. Chem. 1974. Vol. 9. № 3. P. 255-258.
6. Kakai Tokkyo Koho Jp. 07.224.062 (95.224.062) (CI CO7D 413/06). C.A. 1996. 124.269469m.
7. Yao Guowei // Kogyo Kagaku. 1982. Vol. 43. № 1. P. 2-8.

НАПРАВЛЕНИЯ СОЛЕОБРАЗОВАНИЯ ЗАМЕЩЕННЫХ 5-НИТРОМЕТИЛ-3-ФЕНИЛ-1,2,4-ОКСАДИАЗОЛОВ В РЕАКЦИЯХ СО СПИРТОВЫМ РАСТВОРОМ ГИДРОКСИДА КАЛИЯ

Н.А. Новикова, А.Г. Тырков

Астраханский государственный педагогический университет
(Астрахань)

Производные 1,2,4-оксадиазола имеют важное значение как биологически активные соединения, обладающие противомикробным и антигельминтным действиями. Аминопроизводные соединения этого класса эффективны как антигузвные агенты, они обладают также анальгетиче-