

## СИНТЕЗ 3(5)-(НИТРОАМИНО)-1,2,4-ТРИАЗОЛ-5(3)-КАРБОНОВЫХ КИСЛОТ И ИХ ПРОИЗВОДНЫХ

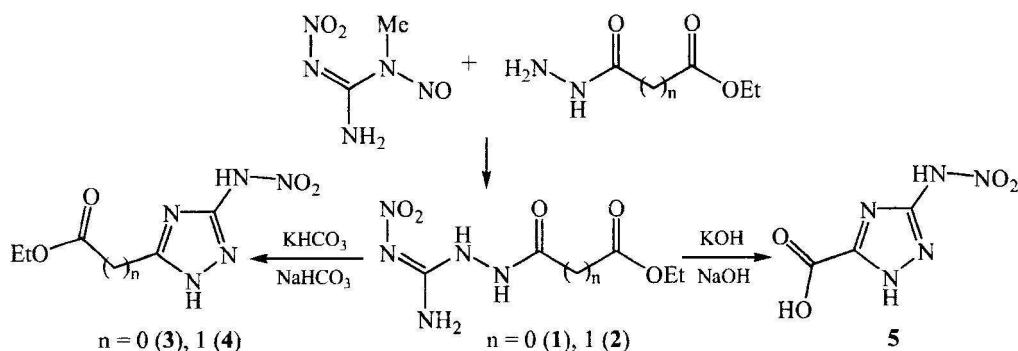
*Е.П. Дихтяренко, Т.П. Ефимова, Т.А. Новикова.*

*Российский государственный педагогический университет имени А.А.Герцена  
191186, Санкт-Петербург, наб.р.Мойки, д.48, e-mail: chemis@herzen.spb.ru*

1,2,4-Триазолы и их производные занимают одно из ведущих мест в синтетической органической химии в связи с широкими возможностями практического использования: от биологически активных препаратов до взрывчатых веществ и компонентов ракетных топлив.

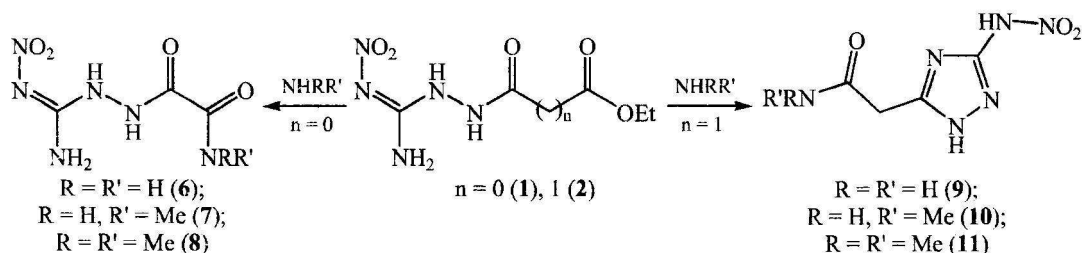
1,2,4-Триазолы с нитроаминной группой в качестве заместителя являются малоисследованными соединениями. В литературе имеются данные, касающиеся синтеза лишь небольшого числа представителей таких замещенных гетероциклов, их строения и свойств [1, 2].

Нами разработан препаративно удобный метод синтеза новых производных 1,2,4-триазола, а именно – 3(5)-(нитроамино)-1,2,4-триазол-5(3)-карбоновых кислот. В основе метода лежит внутримолекулярная циклизация полиазотистых соединений (1,2), получаемых конденсацией 1-метил-2-нитро-1-нитрозогуанидина с моногидрамидами эфиров дикарбоновых кислот.



Циклизация соединений (1,2) при кипячении в водном растворе гидрокарбонатов щелочных металлов приводит к этиловым эфирам соответствующих 3(5)-(нитроамино)-1,2,4-триазол-5(3)-карбоновых кислот (3,4), а осуществление этой реакции в водном растворе гидроксидов щелочных металлов в случае N-(2-нитрогуанидино)-амидэтилоксалата (1) сопровождается гидролизом этоксикарбонильной группы и завершается синтезом 3(5)-(нитроамино)-1,2,4-триазол-5(3)-карбоновой кислоты (5). Циклизация N-(2-нитрогуанидино)-амидэтилмалоната (2) в аналогичных условиях не сопровождается гидролизом этоксикарбонильной группы и приводит к продукту (4).

Изучено поведение синтезированных соединений (1, 2) в реакциях с азотсодержащими мононуклеофилами, такими как аммиак, метиламин и диметиламин. В результате взаимодействия N-(2-нитрогуанидино)-амидэтилоксалата (1) получены оригинальные представители замещенных оксамидов (6–8), содержащие в своем составе нитрогуанидиновый фрагмент. Производные оксамида и оксаминовой кислоты представляют самостоятельный интерес, так как в их ряду найдены вещества, обладающие противотуберкулезной и противосудорожной активностью [3, 4].



В аналогичных условиях взаимодействие N-(2-нитрогуанидино)амидэтилмалоната (2) с N-содержащими мононуклеофилами не останавливается на стадии образования линейных продуктов, а приводит к амидам 3(5)-(нитроамино)-1,2,4-триазол-5(3)-илуксусной кислоты (9–11).

Состав всех полученных соединений подтвержден данными элементного анализа, а строение – методами ИК, УФ и ЯМР  $^1H$  спектроскопии.

[1] Кофман Т.П., Карцева Г.Ю., Щербинин М.Б. *ЖОрХ*, 2002, 38, 1397.

[2] Певзнер М.С., Гладкова Н.И., Кравченко Т.А. *ЖОрХ*, 1996, 32, 1230.

[3] Бердинский И.С. *ЖОХ*. 1964, 34, 1773.

[4] Петюнин П.А., Закалюжный М.В. *ЖОрХ*. 1974, 10, 2584.