

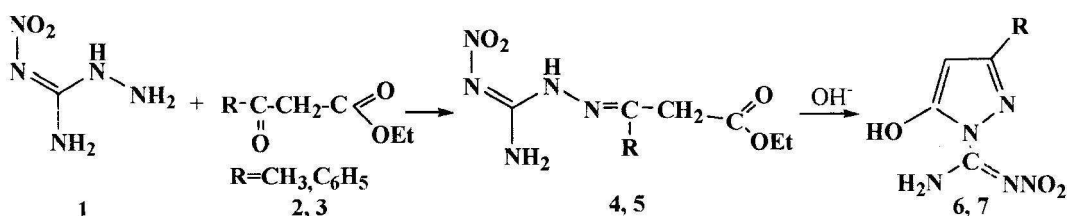
1-АМИНО-2-НИТРОГУАНИДИН В РЕАКЦИЯХ С ЭФИРАМИ β -КЕТОКАРБОНОВЫХ КИСЛОТ

Тихомиров Р.А., Ефимова Т.П., Новикова Т.А., Берестовицкая В.М.

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

Нитрогуанидин является перспективным исходным реагентом в синтезе открытоцепных и гетероциклических полиазотистых систем. На основе замещенных гуанидина синтезировано большое число биологически активных соединений, обладающих противоопухолевой, туберкулостатической, анальгетической, фунгицидной, гербицидной активностью, и нашедших применение в медицине и сельском хозяйстве [1]. Производные нитрогуанидина используются в технике как компоненты ракетных топлив и взрывчатых веществ [2]. Карбонилсодержащие замещенные 2-нитрогуанидина можно рассматривать в качестве предшественников полиазотистых гетероциклов [3]. Известно, например, что в результате взаимодействия 1-амино-2-нитрогуанидина с ацетилацетоном [4], образуются линейный ацетилацетоннитрогуанидиллазон (20%) и 3,5-диметил-1-нитрогуанилпиразол (67%).

Нами исследовались реакции 1-амино-2-нитрогуанидина (1) с эфирами β -кетокислот (2, 3). Взаимодействие протекало в условиях кислотного катализа при кипячении реакционной смеси в спиртовой среде и заканчивалось образованием соответствующих нитроформамидилгидразонов (4, 5) с выходами 93 и 68% соответственно. В отличие от ацетоуксусного эфира его бензоильный аналог вступал в реакцию в более жестких условиях - даже при кипячении 1,5 ч (вместо 0,3 ч) выход соединения (5) не превышал 68%.



Полученные гидразоны кетокислот легко в щелочной среде циклизуются в 1-нитроформамидил-3-*R*-5-пиразолонны (6, 7). Строение синтезированных веществ (4-7) подтверждено данными ИК и ЯМР ¹H-спектроскопии, свидетельствующими также о существовании рассматриваемых пиразолонов в растворе ДМСО-*d*₆ и в твердой фазе в енольной форме.

- [1] Бармин М.И., Громова С.А., Лебединцева О.В., Тютеров С.Л., Меньшиков В.В. ЖПХ. 1995, 68, 8, 1333.
 [2] Urbanski T. Technology of explosives. Warsaw, Pergamon Press. 1984, 4.
 [3] Новикова Т.А., Метелкина Э.Л., Ефимова Т.П., Берестовицкая В.М. ЖОрХ. 2004, 40, 1257.
 [4] Scott F.L., Kennedy M.T., Reilly J. J. Am. Chem. Soc. 1953, 75, 1294.

1-AMINO-2-NITROGUANIDINE IN REACTIONS WITH β -KETOKARBOXILIC ETHERS

Tihomirov R.A., Efimova T.P., Novikova T.A., Berestovitskaya V.M.

*Herzen State Pedagogical University of Russia,
191186, Saint-Petersburg, Moika embankment, 48; e-mail: kohrgpu@yandex.ru*

Nitroformamidyldrazones (4, 5) were obtained through the interaction between 1-amino-2-nitroguanidine with β -ketocarboxylic ethers. Nitroformamidyldrazones undergo heterocyclization with the yield of 1-nitroformamidyld-3-*R*-5-pyrazolones (6, 7). All synthesized compounds were identified by IR and ¹H NMR.