

1-АМИНО-2-НИТРОГУАНИДИН В РЕАКЦИЯХ С β-НИТРО- И β-БРОМ-β-НИТРОСТИРОЛАМИ

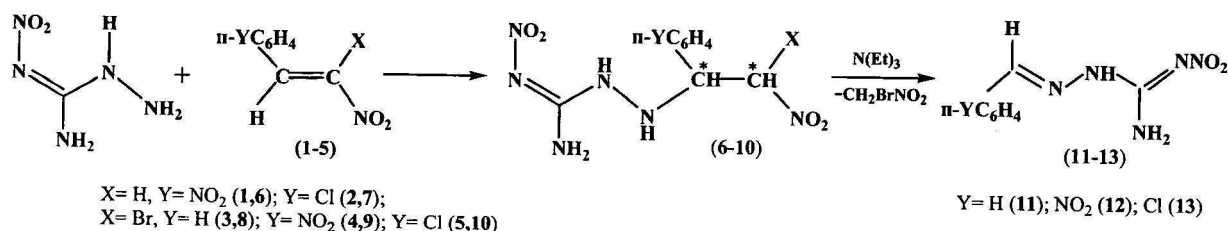
Белик И.В., Ефимова Т. П., Новикова Т. А., Берестовицкая В. М.

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

Производные гуанидина привлекают внимание как соединения с широким спектром биологической активности. В настоящее время в медицинской практике применяются лекарственные препараты, содержащие в своем составе гуанидиновый фрагмент и обладающие гипотензивными (гуанфацин, гуанобенз), антибактериальными (сульгин), антималярийными (бигумаль) и гипогликемическими (фенформин, метформин, буформин) свойствами [1-3].

В литературе имеются сведения о взаимодействии β-нитро- и β-бром-β-нитростирола с такими N,N-бинуклеофилами как семикарбазид, тиосемикарбазид, гидразиды карбоновых кислот и фенилгидразины, но отсутствуют данные о реакциях указанных нитроалкенов с аминогуанидином и его производными.

Нами впервые осуществлено взаимодействие 1-амино-2-нитрогуанидина с замещенными β-нитро- и β-бром-β-нитростиролами (1-5). Реакции протекают в водно-спиртовой среде при температуре 60°C в течение 1-2 ч и завершаются образованием продуктов Ad_N (6-10) с выходами 65-85%. Отметим, что β-нитро- и β-бром-β-нитростирола с электронодонорными заместителями в ароматическом кольце [p-N(CH₃)₂, OCH₃] в названных условиях в эту реакцию не вступают.



В присутствии реагентов основного характера (триэтиламин, ацетат калия) соединения (8-10) претерпевают расщепление, сопровождающееся выбросом бромнитрометана; в результате образуются N-нитроформамидилгидразоны (11-13) с выходами 70-80%. Легкость такой трансформации связана, по-видимому, с высокой стабильностью уходящего функционализированного карбаниона и образованием энергетически выгодной сопряженной системы. Аналогичные результаты отмечаются в реакциях гем-ацетилнитроэтенон с гидразином и ацетилгидразином [4]. Физические характеристики полученных гидразонов (11-13) совпадают с таковыми в модельных соединениях, синтезированных встречным синтезом из ароматических альдегидов и 1-амино-2-нитрогуанидина.

Строение всех вновь полученных соединений (6-13) подтверждено совокупностью данных ЯМР ¹H, ИК и УФ-спектроскопии. Судя по данным спектров ЯМР ¹H, вещества (8-10) существуют в виде смеси двух эритро- и treo-диастереомеров.

1. Машковский М.Д. Лекарственные средства. М.: РИА «Новая волна», 2007, 447, 449, 452, 507, 562, 835.
2. Граник В.Г. Основы медицинской химии. М.: «Вузовская книга», 2001, 291.
3. Граник В.Г. Лекарства (фармакологический, биологический и химический аспекты). М.: «Вузовская книга», 2006, 209, 210.
4. Абоскалова Н.И., Смирнова Н.Н., Катаева О.Н., Байчуринов Р.И., Фельгендлер А.В., Беркова Г.А., Берестовицкая В.М. ЖОХ. 2008, 78 (9), 1479.