

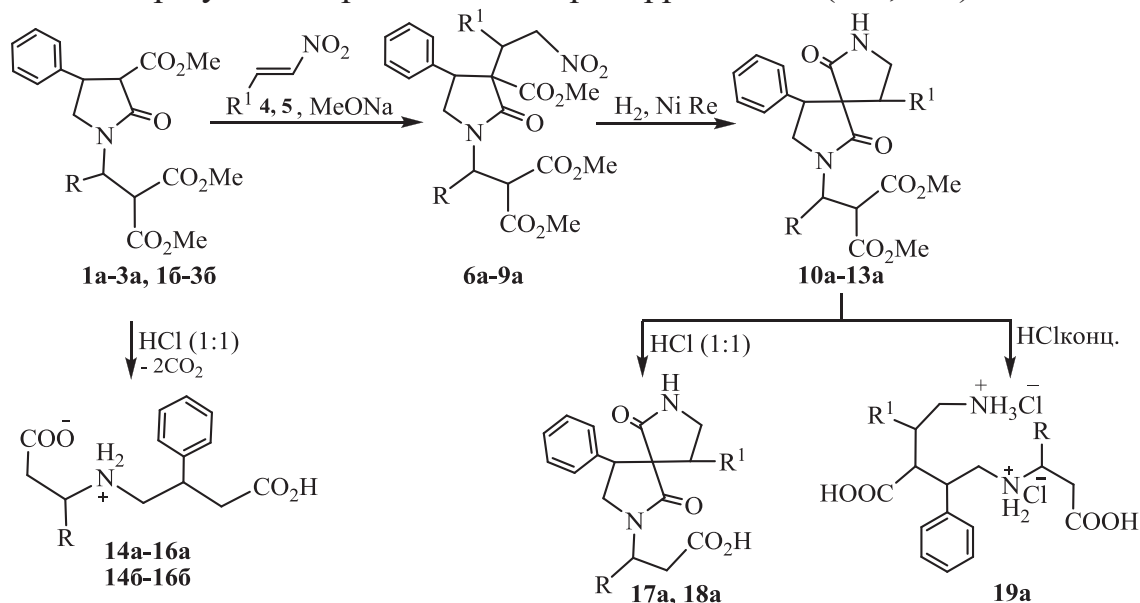
# N-ЗАМЕЩЁННЫЕ ПИРРОЛИДОНКАРБОКСИЛАТЫ В СИНТЕЗЕ ПРОИЗВОДНЫХ $\gamma$ -АМИНОМАСЛЯНОЙ КИСЛОТЫ И $\alpha$ -ПИРРОЛИДОНА

*Н.Д. Хохлова, А.А. Никоноров, О.С. Васильева, Е.С. Остроглядов*

*Санкт-Петербург, РГПУ им. А.И. Герцена*

N-Замещённые пирролидонкарбоксилаты – это ценные реагенты в органическом синтезе, так как их химические превращения открывают путь к получению принципиально нового типа производных  $\gamma$ -аминомасляной кислоты (ГАМК) и  $\alpha$ -пирролидона. Исходные N-замещённые эфиры пирролидонкарбоновых кислот (**1а-3а**, **1б-3б**) синтезированы в виде чистых диастереомеров «а» и «б». Реакцией соединений (**1а-3а**) с арилнитроэтенами (**4,5**) получены нитропредшественники спиропирролидонов - N-замещённые нитроэтилпирролидонкарбоксилаты (**6а-9а**). Гидрирование их на скелетном никелевом катализаторе привело к соответствующим спиропирролидонам (**10а-13а**).

Нами изучено поведение N-замещённых пирролидонкарбоксилатов (**1а-3а**, **1б-3б**) и спиропирролидонов (**10а-13а**) в условиях кислотного гидролиза: кипячение соединений (**1а-3а**, **1б-3б**) в 6 н соляной кислоте приводит к новым N-карбоксиэтилГАМК (**14а-16а**, **14б-16б**), а вещества (**10а**, **13а**) в этих условиях образуют N-карбоксиэтилспиропирролидоны (**17а**, **18а**).



R = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub> (**1а**, **1б**, **14а**, **14б**), 4-ClC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**2а**, **2б**, **15а**, **15б**) пиридил-3 (**3а**, **3б**, **16а**, **16б**);

R<sup>1</sup> = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub> (**4**), 4-ClC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**5**); R = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>: R<sup>1</sup> = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub> (**6а**, **6б**, **10а**, **17а**, **19а**), 4-ClC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**7а**, **11а**),

R = 4-ClC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>: R<sup>1</sup> = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub> (**8а**, **8б**, **12а**), 4-ClC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**9а**, **13а**, **18а**)

Гидролиз спиропирролидона **10а** в более жёстких условиях (12 н соляная кислота, 50 часов) сопровождается раскрытием пирролидоновых циклов с образованием представителя нового типа ГАМК - N-карбоксиэтил-1,5-диаминопентан-3-овой кислоты **19а**. Все синтезированные нами соединения можно рассматривать как потенциально биологически активные структурные аналоги ГАМК.