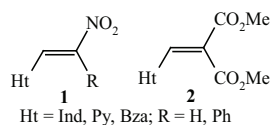


Гетерилсодержащие 1-нитро- и 1,1-диалкоксикарбонилэтены как перспективные стартовые реагенты в синтезе новых замещённых ГАМК, Глу и пиретама

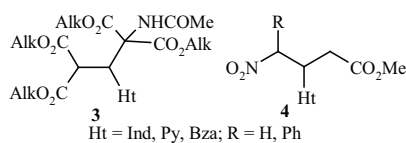
**Берестовицкая В.М.,
Васильева О.С.,
Остроглядов Е.С.**

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

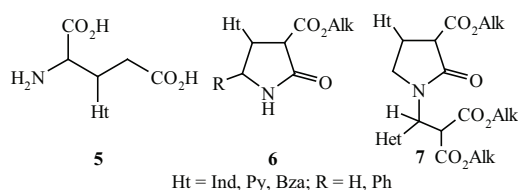
Высокая реакционная способность, синтетическая и коммерческая доступность электронодефицитных 1-нитро- и 1,1-диалкоксикарбонилэтенных позволяет использовать их для получения ряда оригинальных веществ с ценными фармакологическими свойствами. В частности, они применяются в синтезе генетически связанных между собой производных глутаминовой (Глу), γ -аминомасляной кислот (ГАМК) и α -пирролидона, в том числе, широко используемых в медицине фенибута, фенотропила и их аналогов [1-3]. Особый интерес представляют индол-, пиридин- и бензимидазолсодержащие 1-нитро- и 1,1-диалкоксикарбонилэтены, как носители гетероциклов, которые широко распространены в природе и входят в состав многих лекарственных препаратов.



Названные функционализированные алкены **1,2** – удобные стартовые реагенты для получения ацетиламиноглутаратов **3** и нитробутаноатов **4** – предшественников соответствующих Глу и ГАМК.



Гидролизом в кислой среде веществ **3** синтезированы индол-, пиридин- и бензимидазолсодержащие Глу **5**.

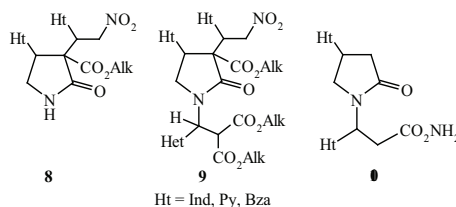


Гидрирование соединений **4** в присутствии скелетного никелевого катализатора приводит

к образованию эфиров пирролидонкарбонных кислот **6** – предшественников новых аналогов ноотропного препарата пиретама.

3-Алкоксикарбонил-2-пирролидоны **6** обладают большим синтетическим потенциалом. Их реакции с 1,1-диалкоксикарбонилэтенами идут по NH-, а с 1-нитроэтенами – по C³-центрам с образованием соответствующих продуктов Михаэля **7,8**; причем, первые успешно вступают в реакции с нитроалкенами по C³-центру, формируя пирролидонкарбоксилаты **9**.

Синтезированные аддукты **7-9** легко подвергаются модификации – их дальнейшие превращения открыли путь к новым семействам замещённых ГАМК и пирролидона, например, к N-карбамоилэтилпирролидонам – аналогам пиретама **10**.



В докладе будут обсуждаться наиболее значимые результаты исследований коллектива кафедры (за последние годы), направленные на изыскание путей синтеза новых типов замещённых ГАМК, Глу и пиретама, содержащих в молекуле высокофармакофорные гетероциклические системы.

Литература

1. Берестовицкая В. М., Васильева О. С., Остроглядов Е. С., Дубовцева Е. Ю. *Известия РГПУ им. А. И. Герцена. Естественные и точные науки.* СПб. 4(8), 158 (2004).
2. Евразийский патент 002380. В.М. Берестовицкая и др. Бюлл. изобр. Евразийского патентного ведомства № 1 от 26.02.2001.
3. Евразийский патент 002379. В.М. Берестовицкая и др. Бюлл. изобр. Евразийского пат. ведомства № 1 от 26.02.2001.

Авторы выражают благодарность правительству Санкт-Петербурга за финансовую поддержку (ПСР № 10517).