

Синтез и строение потенциально биологически активных эфиров и амидов 2-пирролидон-3,5,5-трикарбоновых кислот

**Остроглядое Е.С.,
Берестовицкая В.М.,
Васильева О.С.,
Семенов В.В.**

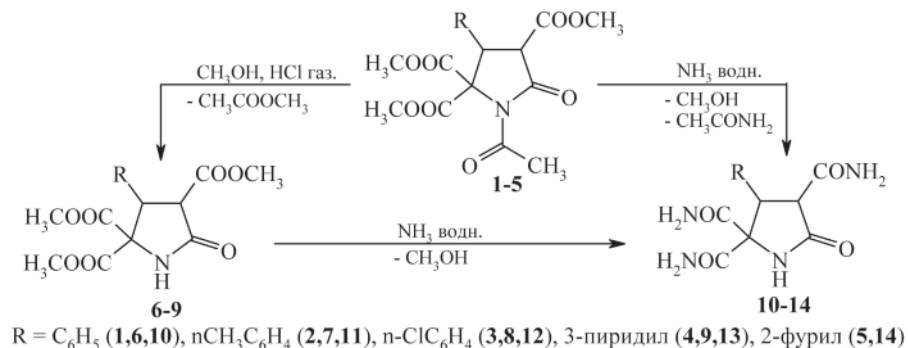
Российский государственный педагогический университет имени А.И. Герцена, 191186, Санкт-Петербург.

e-mail: kohrgpu@yandex.ru

Пирролидонкарбоксилаты являются удобными прекурсорами в синтезе производных γ -аминомасляной, глутаминовой кислот и α -пирролидона, в том числе и представителей, содержащих амидные группы – распространённые фрагменты синтетических и природных биологически активных соединений.

В этой связи особый интерес представляют легко получаемые N-ацетил-3,5,5-триметоксикарбонил-4-арил(гетарил)-2-пирролидоны, открывающие путь к синтезу оригинальных производных 2-пирролидона – эфиров и амидов пирролидонтрикарбоновых кислот. Так, при пропускании хлористого водорода через растворы N-ацетил-3,5,5-триметокси-

карбонил-2-пирролидонов (**1-4**) в метаноле происходит отщепление ацетильной группы; сложноэфирные функции при этом сохраняются. Выделенные с высокими выходами 3,5,5-триметоксикарбонил-4-арил(гетарил)-2-пирролидоны (**6-9**) представляют не только самостоятельный интерес как потенциально биологически активные вещества, но и как исходные реагенты в синтезе новых перспективных в прикладном аспекте соединений. Например, триэфиры (**6-9**) в мягких условиях в среде 25%-ного водного аммиака, при энергичном перемешивании и температуре 18–20°C образуют соответствующие амиды пирролидонтрикарбоновых кислот (**10-13**).



Установлено, что аммонолиз N-ацетил-3,5,5-триметоксикарбонил-2-пирролидонов (**1-5**) в аналогичных условиях (в среде 25%-ного водного аммиака) также сопровождается дезацилированием ацетильной функции и приводит к амидам (**10-14**), физико-химические характеристики которых совпадают с таковыми для веществ, полученных из эфиров (**6-9**). Этот способ получения амидов пирролидонкарбоновых кислот не только более рационален, но и открывает путь синтеза триамидов, содержащих ацидофобные заместители в лактамном цикле. Например, амид фурилпирролидонтрикарбоновой кислоты (**14**) получен только при взаимодействии эфира (**5**) с аммиаком в водной среде. Соединения (**6-14**) получают с выходами до 75 %; это устойчивые кристаллические вещества с чёткими температурами плавления. Их строение подтверждено методами ЯМР¹H и ИК спектроскопии.

Таким образом, нами разработаны препаративно доступные методы синтеза потенциально биологически активных эфиров и амидов 2-пирролидон-3,5,5-трикарбоновых кислот.