

## СИНТЕЗ ГИДРАЗИДОВ (4-АРИЛ-2-ПИРРОЛИДОН-1-ИЛ)УКСУСНЫХ КИСЛОТ

*Пелипко В.В., Остроглядюв Е.С., Васильева О.С.*

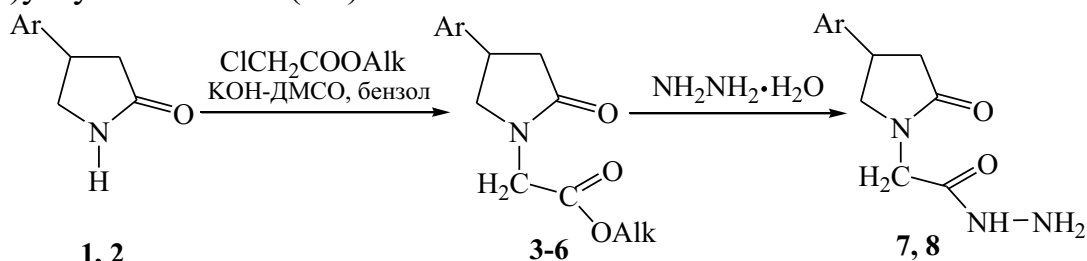
*Санкт-Петербург, РГПУ им. А.И. Герцена*

*kohrgpu@yandex.ru*

Повышенный интерес химиков и фармакологов к структурным аналогам 2-пирролидона связан с наличием среди них веществ с ценными фармакологическими свойствами: ноотропными (пирацетам), дезинтоксикационными (поливинилпирролидон) [1]. Введение в молекулу 2-пирролидона гидразидной группы, входящей в состав молекул ряда антигипертензивных (апрессин) и противотуберкулёзных средств (изониазид) [1], может привести к созданию субстанций с оригинальным фармакологическим действием.

Нами разработана методика получения гидразидов пирролидон-1-уксусных кислот, основой которой являются реакции 4-арил-2-пирролидонов с алкил-монохлорацетатом. Последующее взаимодействие образующихся продуктов N-алкилирования с гидразингидратом приводит к целевым гидразидам пирролидон-1-уксусных кислот.

Исходные 4-фенил- и 4-метоксифенил-2-пирролидоны (**1**, **2**) синтезированы по методике [2]. Осуществлено их алкилирование метил- или этил-монохлорацетатом в суперосновной среде (KOH-DMCO) в растворе бензола. Получены соответствующие эфиры (4-арил-2-пирролидон-1-ил)уксусных кислот (**3-6**).



Ar = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>; Alk = CH<sub>3</sub> (**3**), C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> (**4**);

Ar = *n*-CH<sub>3</sub>OC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; Alk = CH<sub>3</sub> (**5**), C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> (**6**); Ar = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub> (**7**), *n*-CH<sub>3</sub>OC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**8**)

Нами найдены оптимальные условия гидразинолиза эфиров пирролидонуксусных кислот (**3-6**): перемешивание реакционной массы при охлаждении в течение 20 часов в избытке гидразин-гидрата. В результате с хорошими выходами выделены устойчивые в обычных условиях бесцветные кристаллические продукты (**7**, **8**) с чёткими температурами плавления.

Строение всех полученных веществ (**7**, **8**) подтверждено данными современных физико-химических методов. Таким образом, нами разработана удобная методика получения гидразидов (4-арил-2-пирролидон-1-ил)уксусных кислот.

### Список литературы

1. Машковский М.Д. Лекарственные средства. М.: Новая волна/. 2012. 1216 с.
2. Перекалин В.В., Зобачева М.М. // ЖОХ. 1959. Т. 29. Вып. 9. С. 2905-2910.