

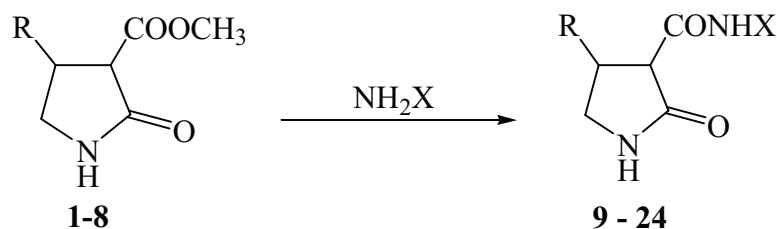
## Синтез амидов и гидразидов 4-арил(гетарил)-2-пирролидон-3-карбоновых кислот

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

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

Синтез новых представителей аналогов пиррацетама, молекулы которых содержат карбамоильный остаток при углеродном атоме пирролидинового цикла, является перспективным направлением поиска новых потенциально биологически активных веществ. Известно, что синтезированные в последнее время замещённые пиррацетама - 1-карбамоилметил-4-(4-метоксифенил)-2-пирролидон и фенилгидразид (4-фенил-2-пирролидон-1-ил)уксусной кислоты проявляют антидепрессантные, анксиолитические и ноотропные свойства [1,2]. Вместе с тем, несомненный интерес представляют арил- и гетарилзамещённые аналоги пиррацетама, содержащие при С(3)-атоме пирролидинового цикла карбамоильный или другие подобные ему заместители.

В настоящей работе изучено взаимодействие 4-арил(гетарил)-2-пирролидон-3-карбоксилатов (**1-8**) с аммиаком, гидразином и фенилгидразином. Вещества (**1-8**) легко получают по описанным нами ранее методикам [3]. Найдены оптимальные условия протекания реакций их аммонолиза и гидразинолиза: в качестве реагентов использовались водный аммиак (25 %), гидразин-гидрат или фенилгидразин, смесь пирролидон-3-карбоксилатов в растворе названных реагентов перемешивалась в течение 20 часов при охлаждении. В результате с хорошими выходами (до 83 %) выделены устойчивые в обычных условиях бесцветные кристаллические амиды (**9-13**), гидразиды (**14-20**) и фенилгидразиды (**21-24**) 4-арил(гетарил)-2-пирролидон-3-карбоновых кислот.



R = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub> (**1**), 4-CH<sub>3</sub>OC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**2**), 4-CH<sub>3</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**3**), n-ClC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**4**), индол-3-ил (**5**), 1-метилиндол-3-ил (**6**), 1-бензилиндол-3-ил (**7**), 2-метилиндол-3-ил (**8**);  
 X = H: R = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub> (**9**), 4-CH<sub>3</sub>OC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**10**), 4-CH<sub>3</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**11**), n-ClC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**12**), индол-3-ил (**13**);  
 X = NH<sub>2</sub>: R = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub> (**14**), 4-CH<sub>3</sub>OC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**15**), 4-CH<sub>3</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**16**), индол-3-ил (**17**), 1-метилиндол-3-ил (**18**), 1-бензилиндол-3-ил (**19**), 2-метилиндол-3-ил (**20**);  
 X = NHC<sub>6</sub>H<sub>5</sub>: R = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub> (**21**), 4-CH<sub>3</sub>OC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**22**), 4-CH<sub>3</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (**23**), индол-3-ил (**24**)

Строение всех полученных веществ (**9-24**) подтверждено данными современных физико-химических методов. Использование двумерной гетероядерной корреляционной спектроскопии <sup>1</sup>H-<sup>13</sup>C НМРС, НМВС позволило сделать корректное отнесение сигналов протонов метиленовых и метиновых групп пирролидонового цикла, а также сигналов протонов гидразидного фрагмента в молекулах веществ (**21-24**).

Таким образом, нами разработаны препаративно удобные методики синтеза и охарактеризовано строение новых производных 2-пирролидона – потенциально биологически активных амидов и гидразидов 4-арил(гетарил)-2-пирролидон-3-карбоновых кислот.

#### *Список литературы*

1. Патент РФ № 2437659. / Берестовицкая В.М., Васильева О.С., Петров В.И., Тюренков И.Н., Багметова В.В., Остроглядов Е.С. Приоритет от 12.11.2010. Оpubл. 27.12.2011.
2. Патент РФ № 2440981. / Берестовицкая В.М., Васильева О.С., Петров В.И., Тюренков И.Н., Багметова В.В., Остроглядов Е.С. Приоритет от 12.11.2010. Оpubл. 27.01.2012.
3. Берестовицкая В.М., Васильева О.С., Остроглядов Е.С., *2-Пирролидон и его производные. Монография*. СПб: Изд-во «Астерион», **2013**, 192 с.