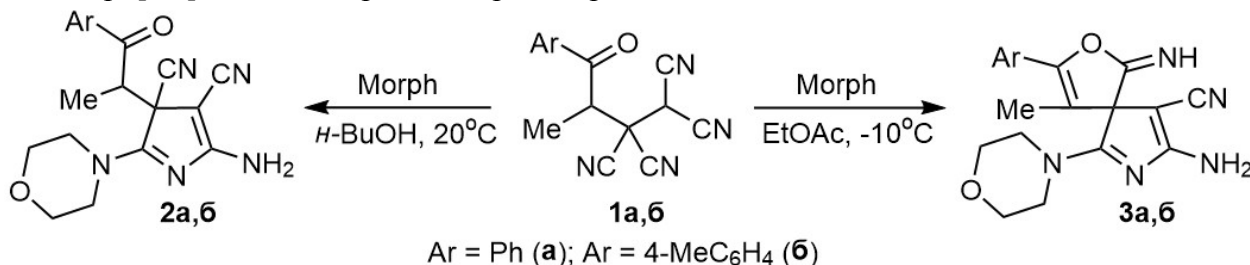


разработка методов синтеза 3*H*-пирролов является актуальной задачей.

В качестве исходного соединения для синтеза 3*H*-пирролов нами использованы 4-оксобутан-1,1,2,2-тетракарбонитрилы **1**. Как удалось выяснить, соединения **1** способны трансформироваться в 3*H*-пирролы различного строения в зависимости от условий проведения процессов. Так при взаимодействии нитрилов **1а,б** с морфолином образуются 5-амино-2-морфолин-4-ил-3-(1-арил-1-оксопропан-2-ил)-3*H*-пиррол-3,4-дикарбонитрилы **2а,б** и изомерные им спиросоединения – 8-амино-3-арил-1-имино-4-метил-6-морфолин-4-ил-2-окса-7-азаспиро[4.4]нона-3,6,8-триен-9-карбонитрилы **3а,б**.



Показано, что образованию 3*H*-пирролов **2** способствует проведение взаимодействия в протонном растворителе, а именно в *n*-бутаноле, при комнатной температуре, тогда как формирование спиросоединений **3** наблюдается в этилацетате при пониженной температуре. При этом стоит отметить, что процесс образования 3*H*-пирролов **2** является диастереоселективным.

Строение синтезированных соединений доказано данными комплекса физических методов (ИК, ЯМР-спектроскопия, масс-спектрометрия).

*Работа выполнена при поддержке стипендии Президента РФ для молодых ученых и аспирантов № СП-2501.2016.4.*

- [1] Liao J.-Y., Shao P.-L., Zhao Y. *J. Am. Chem. Soc.* **2015**, *137*, 628-631.  
 [2] Shabalin D.A., Dvorko M.Yu., Schmidt E.Yu., Ushakov I.A., Protsuk N.I., Kobychiev V.B., Soshnikov D.Yu., Trofimov A.B. et al. *Tetrahedron.* **2015**, *71*, 3273-3281.  
 [3] Yavari I., Ghanbari E., Hosseinpour R. *Helv. Chim. Acta.* **2014**, *97*, 1004-1008.  
 [4] Belikov M.Yu., Ershov O.V. et al. *Tetrahedron Lett.* **2011**, *52*, 6407-6410.  
 [5] Das P., Ray S., Mukhopadhyay C. *Org. Lett.* **2013**, *15*, 5622.

## МЕТОДЫ ПОСТРОЕНИЯ НОВЫХ ПРОИЗВОДНЫХ АЗОТИСТЫХ ГЕТЕРОЦИКЛОВ В РЯДАХ ПИРАЗОЛА, 1,2,4-ТРИАЗОЛА И 1,2,4-ТРИАЗИНА

Берестовицкая В.М., Озерова О.Ю., Ефимова Т.П.

ФГБОУ ВО "Российский государственный педагогический университет имени А. И. Герцена"  
*kohrgpu@yandex.ru*

Производные пиразола, 1,2,4-триазола и 1,2,4-триазина привлекательны своей потенциальной биологической активностью; среди них найдены вещества с анальгетическим, антигипоксическим, противоопухолевым, противогрибковым действием и другими полезными свойствами. К числу анальгетических лекарственных средств относятся широко известные препараты пиразольного ряда *анальгин* и *антипирин*. Представители функционализированных 1,2,4-триазолов *флуконазол* и *рибавирин* [1] применяются как антигрибковые и противовирусные средства, *байлетон* и *импакт* [2] являются гербицидами и фунгицидами. Замещенные 1,2,4-триазина *метрибузин* и *метамитрон* [3] проявляют себя как эффективные гербициды.

Проведенные нами исследования показали, что удобным строительным блоком для конструирования названных азотистых гетероциклов является высокоактивный *N*-амино-*N'*-нитрогуанидин. На основе его реакций с хлорангидридами карбоновых кислот разработан способ синтеза 1,2,4-триазолов, взаимодействием с  $\alpha$ -дикетонами и 3-бром-3-нитроакрилами получены нитроаминосодержащие 1,2,4-триазины, а конденсацией с  $\beta$ -дикетонами синтезированы пиразолы.

В докладе обсуждаются особенности реакций 1-амино-2-нитрогуанидина с серией карбонилсодержащих биелектрофилов ( $\alpha$ - и  $\beta$ -дикарбонильные соединения,  $\alpha$ -кетокрбоновые кислоты, хлорангидриды карбоновых кислот) и с сопряженными нитроалкенами (2-арил- и 2-арил-1-бром(1-бензоил)-1-нитроэтен, 3-арил-2-нитроакрилаты, 3-нитроакрилаты, а также 3-бром- и 2,3-дибром-3-нитроакрилаты), анализируются выявленные закономерности и условия проведения синтезов по стадиям и в режиме *one pot*.

Строение всех впервые синтезированных веществ охарактеризовано методами ИК, УФ, ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $^{13}\text{C}\{^1\text{H}\}$  спектроскопии с привлечением двумерных гомоядерных (COSY, NOESY) и гетероядерных (HMOC, HMBC) экспериментов, а представители гетероциклических структур дополнительно изучены с помощью рентгеноструктурного анализа.

Коммерческая доступность исходных реагентов, простота оформления синтезов, проводимых в большинстве случаев в водно-спиртовой среде (в соответствии с требованиями зеленой химии) и высокие выходы продуктов определяют возможность масштабирования разработанных способов получения гетероциклов и в случае необходимости – их промышленного внедрения.

*Работа выполнена при финансовой поддержке Министерства образования и науки РФ в рамках базовой части государственного задания.*

Литература

1. Машковский М.Д. Лекарственные средства. М.: Новая волна, 2010. С. 165, 875, 920.
2. Здрожжевская С.Д., Нечипоренко Н.И. // Научные основы химической защиты сельскохозяйственных культур от болезней. Л.: ВИЗР, 1991. С. 73.
3. Солдатенков А.Т., Колядина Н.М., Туан А.Л. // Пестициды и регуляторы роста. М.: Бином, Лаборатория знаний. 2013. 223.

## **МУЛЬТИКОМПОНЕНТНЫЕ РЕАКЦИИ САЛИЦИЛОВЫХ АЛЬДЕГИДОВ, МАЛОНОНИТРИЛА И 4-ГИДРОКСИ-6-МЕТИЛ-2Н-ПИРАН-2-ОНА: БЫСТРЫЙ И ЭФФЕКТИВНЫЙ ДИЗАЙН СОЕДИНЕНИЙ С 2-АМИНО-4Н-ХРОМЕНОВЫМ ФАРМАКОФОРНЫМ КАРКАСОМ**

Бобровский С.И., Верещагин А.Н., Элинсон М.Н., Рыжков Ф.В.

*Институт органической химии им. Н.Д. Зелинского  
losyashssu@mail.ru*

Хроменовая система широко распространена среди биологически активных соединений, как синтетических, так и природных. Она широко представлена в природных флавоноидах (флавоны, флавонолы, катехины, токоферолы, антоцианы, антоцианидины), а также находится в составе некоторых алкалоидов. Среди различных видов хроменов особенно востребованы 2-амино-4*H*-хромены, т. к. они обладают высокой фармакологической активностью и используются для лечения вирусного гепатита, болезни Альцгеймера, сердечно-сосудистых заболеваний, эпилепсии, гипертензии и атеросклероза [1,2]. Возрастающий интерес к 2-амино-4*H*-хроменам, содержащим нитрильную группу, связан с их применением в лечении воспалительных заболеваний человека, таких как карцинома, артрит, лейкоз, а также в терапии многих видов рака [3].

В данной работе сообщается о новой эффективной мультикомпонентной трансформации