

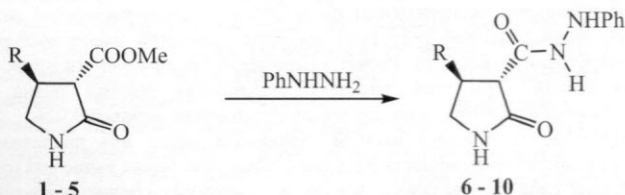
СИНТЕЗ ФЕНИЛГИДРАЗИДОВ 4-(ГЕТ)АРИЛ-2-ПИРРОЛИДОН-3-КАРБОНОВЫХ КИСЛОТ

Е.С. Остроглядюв, Н.В. Городничева, Р.И. Байчури

Российский государственный педагогический университет им. А. И. Герцена

Замещенные 2-пирролидоны, содержащие при С³ атоме лактамного цикла карбогидразидные группы, могут рассматриваться как структурные аналоги рацетамов [1]. В этом отношении несомненный интерес представляет разработка методов синтеза перспективных потенциально биологически активных субстанций, содержащих в составе молекул фармакофорные лактамный и индольный гетероциклы, 4-хлорфенильный заместитель, а также фенилгидразидную функцию. Удобным способом синтеза подобных веществ могут быть реакции гидразинолиза 2-пирролидон-3-карбоксилатов фенилгидразином [2].

Нами осуществлены реакции диастереооднородных (3*R**,4*S**)-4-(4-хлорфенил)-, 4-индол-3-ил-, 4-(1-метилиндол-3-ил)- и 4-(1,2-диметилиндол-3-ил)-2-пирролидон-3-арбоксилатов (**1-5**) с фенилгидразином. Кипячение смеси реагентов в *n*-ксилоле в течение 4 часов с последующей выдержкой при 18–20°C в течение 20 часов привело к получению фенилгидразидов (**6-10**) с выходами 60-80 %.



R = 4-ClPh (**1, 6**), Ind (**2, 7**), 1-MeInd (**3, 8**), 2-MeInd (**4, 9**), 1,2-диMeInd (**5, 10**).

Строение синтезированных соединений (**6-10**) комплексно охарактеризовано методами ИК, ЯМР ¹H, ¹³C спектроскопии с использованием НМРС и НМВС экспериментов. Установлено, что хиральные центры молекул фенилгидразидов (**6-10**) имеют (3*R**,4*S**)-конфигурацию и *Z*-конформацию (относительно амидной (O)C-N связи) карбофенилгидразидного заместителя.

Таким образом, нами разработан способ получения индолсодержащих фенилгидразидов (3*R**,4*S**)-2-пирролидон-3-карбоновых кислот, что позволило расширить ряд 2-пирролидон-3-фенилкарбогидразидов.

Литература

1. Берестовицкая В.М., Тюренков И.Н., Васильева О.С., Перфилова В.Н., Остроглядюв Е.С., Багмстова В.В. Рацетамы: методы синтеза и биологическая активность. Монография. – СПб.: Астерион, 2016. – 287 с.
2. Городничева Н.В., Остроглядюв Е.С., Васильева О.С., Пелипко В.В., Гуржий В.В., Берестовицкая В.М., Липина Э.С. *ЖОрХ*. **2016**. Т. 52. Вып. 11. С. 1622. [Gorodnicheva N.V., Ostrogladyov E.S., Vasil'eva O.S., Pelipko V.V., Gurzhii V.V., Berestovitskaya V.M., Lipina E.S. *Russ. J. Org. Chem.* **2016**. Vol. 52. № 11. P. 1616].