

СИНТЕЗ АНАЛОГОВ АНТИПИРИНА И ПРОПИФЕНАЗОНА АЛКИЛИРОВАНИЕМ 1-ФЕНИЛ-3-ТРИФТОРМЕТИЛПИРАЗОЛ-5-ОЛОВ

Лапшин Л.С.^(1,2), Агафонова Н.А.⁽²⁾, Щегольков Е.В.⁽²⁾,

Бургарт Я.В.⁽²⁾, Салоутин В.И.⁽²⁾

⁽¹⁾ Уральский федеральный университет

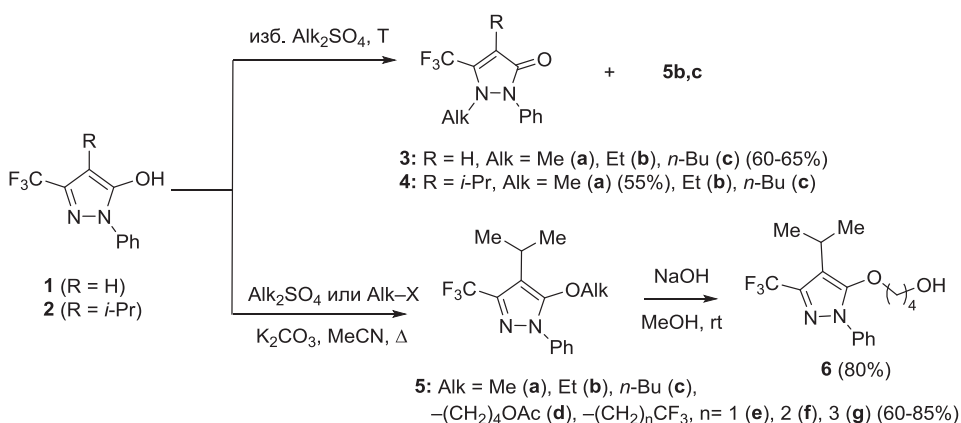
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

⁽²⁾ Институт органического синтеза УрО РАН

620137, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22

Для получения новых фторсодержащих аналогов анальгетиков *антипирин* и *пропифеназон* нами изучены реакции алкилирования пиразолов **1** и **2**.

N-Алкилирование пиразолов **1** и **2** проходило при нагревании в избытке диалкилсульфата с образованием пиразолонов **3a-c** как аналогов *антипирина* и пиразолонна **4a** как аналога *пропифеназона*. При взаимодействии *изо*-пропилпиразола **2** с диэтил- и дибутилсульфатом образовывалась смесь N-алкил-**4b,c** и O-алкил-изомеров **5b,c** в соотношении ~1:1, разделить которые методом колоночной хроматографии не удалось.



O-Алкилирование пиразола **2** диалкилсульфатами селективно осуществлялось в присутствии основания K₂CO₃ при кипячении в MeCN, в результате чего получены пиразолы **5a-c**. Использование 4-бромбутилацетата или трифторалкилйодидов в аналогичной реакции с пиразолом **2** приводило к O-алкилированным производным **5d-g**. Следует отметить, что полнота прохождения реакции алкилирования снижалась с уменьшением длины цепи трифторалкилйодидов. Для устранения этого недостатка при получении продуктов **5e-g** реакцию проводили в закрытых виалах, что способствовало меньшей потере летучих йодидов и увеличению выхода целевых пиразолов. Гидролиз ацетильной группы продукта **5d** под действием щелочи в метаноле позволил получить пиразол **6**, имеющий функциональный гидроксильный заместитель.

Работа выполнена при финансовой поддержке АААА-А19-119017790134-1.