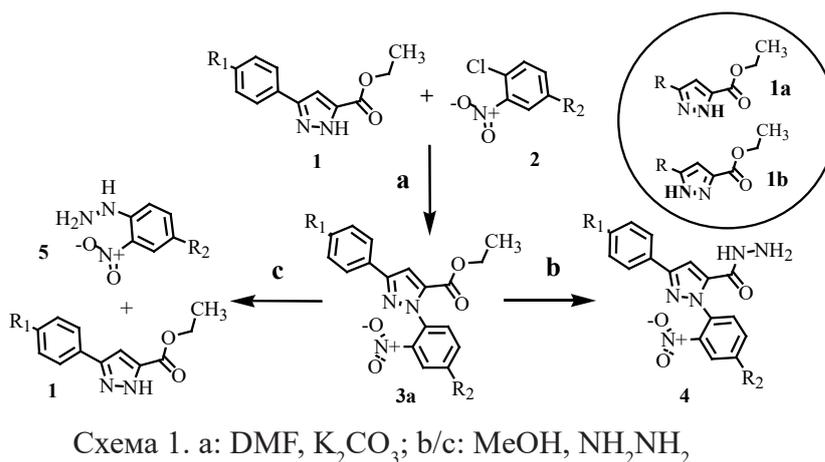


В. А. Панова¹, А. А. Шетнев¹, С. И. Филимонов²¹Ярославский государственный педагогический университет
им. К. Д. Ушинского,Центр трансфера фармацевтических технологий,
150000, Россия, г. Ярославль, ул. Республиканская, 108/1,
v.panova@yspu.org,²Ярославский государственный технический университет,
150023, Россия, г. Ярославль, Московский пр., 88,
filimonovsi@ystu.ruИССЛЕДОВАНИЕ ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ
N-АРИЛ-ПИРАЗОЛКАРБОКСИЛАТОВ С ГИДРАЗИНГИДРАТОМ***Ключевые слова:** пиразол, гидразингидрат, нуклеофильное замещение, арилгидразин.

В химии гетероциклических соединений особый интерес вызывают производные пиразола, проявляющие различную биологическую активность [1]. Присутствие на рынке лекарственных препаратов, таких как противовоспалительное средство Целекоксиб [2], включающих пиразольный цикл в качестве базового структурного фрагмента, дает основания для дальнейшей разработки методов синтеза новых производных ряда N-арилпиразолов.



Нами ранее было установлено, что арилирование пиразолов **1** *o*-нитрохлорбензолами **2** в большинстве случаев приводило к селективному образованию продуктов **3а** [3]. С целью синтеза конденсированных пиразолов полученные эфиры **3** предполагалось трансформировать в гидразиды **4**.

Однако при кипячении соединений **3** с гидразингидратом в спирте, вопреки ожидаемым, по литературным данным [4], гидразидам **4**, происходило

нуклеофильное замещение пиразольного фрагмента гидразином с образованием арилгидразинов **5** и соответствующих пиразолов **1** (схема 1). Мы полагаем, что движущей силой данной реакции является высокая нуклеофильность гидразина, вследствие чего пиразольный фрагмент в условиях реакции выступает как «хорошая» уходящая группа. Эксперимент был проведен для ряда производных пиразола **3**, что давало во всех случаях соответствующие арилгидразины. Выходы полученных арилзамещенных гидразинов представлены в таблице.

| Соединение | R ₁ | R ₂ | Выход 5 , % |
|------------|------------------------|-----------------|--------------------|
| 3a | 4-Cl-Ph | CN | 48 |
| 3b | 4-H ₃ C-Ph | CN | 57 |
| 3c | 4-H ₃ CO-Ph | CN | 61 |
| 3d | 4-Cl-Ph | NO ₂ | 53 |
| 3e | 4-H ₃ C-Ph | NO ₂ | 67 |
| 3f | 4-H ₃ CO-Ph | NO ₂ | 59 |

Структура полученных гидразинов **5** была подтверждена совокупностью данных ИК-, ЯМР-спектроскопии и масс-спектрометрии, а их физико-химические свойства совпадают с литературными данными.

Список литературы

1. *Oliveira L. P. de, Silva D. P. B. da, Florentino I. F. et al.* // *Chemical Biology & Drug Design*. 2016. Vol. 89. P. 124–135.
2. *Penning T. D. et al.* // *J. Med. Chem.* 1997. Vol. 40. P. 1347.
3. *Panova V. A., Korsakov M. K., Shetnev A. A., Filimonov S. I.* // *Mendeleev Commun.* 2019. Vol. 29. P. 114–115.
4. *Hong-Shui L., Bao-Xiang Zh., Ji-Kun L. et al.* // *Dyes and Pigments*. 2010. Vol. 86. P. 25–31.

* Исследование выполнено при финансовой поддержке РФФИ в рамках научного проекта № 18-33-01108.