

### РАЗРАБОТКА МЕТОДОВ СИНТЕЗА ПОЛИФТОРАЛКИЛ-4-АМИНОПИРАЗОЛОВ

Куц С.О.<sup>(1,2)</sup>, Немытова Н.А.<sup>(2)</sup>, Щегольков Е.В.<sup>(2)</sup>,

Бургарт Я.В.<sup>(2)</sup>, Салютин В.И.<sup>(2)</sup>

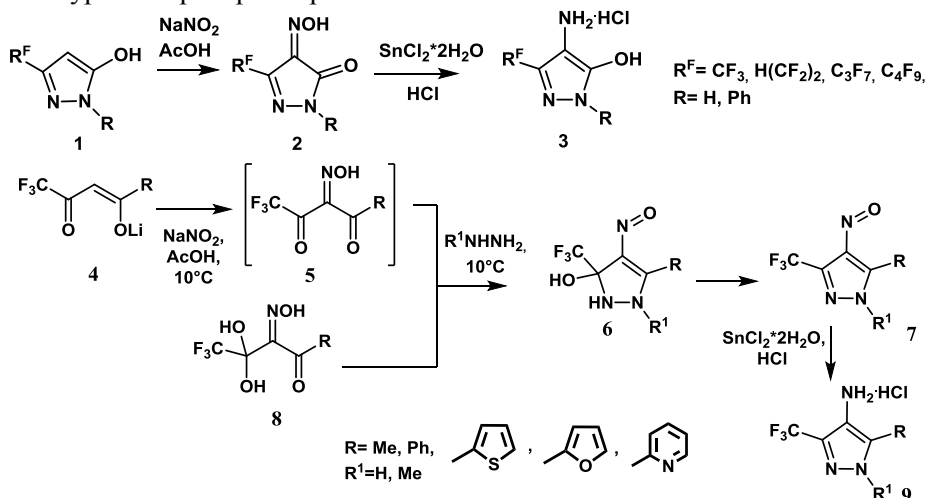
<sup>(1)</sup> Уральский федеральный университет

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

<sup>(2)</sup> Институт органического синтеза УрО РАН

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

В поиске новых анальгетиков аминокипиразольный скелет имеет большую перспективу, поскольку он присутствует в структуре известных лекарств (анальгин и амидопирин). Нами предложен подход к получению полифторалкил-4-аминопиразол-5-онов **3** за счет восстановления 2-гидроксииминопиразол-5-онов **2** под действием  $\text{SnCl}_2$  в  $\text{HCl}$ . Для получения 2-гидроксииминопиразол-5-онов **2** эффективным оказалось нитрозирование 3-полифторалкилпиразол-5-онов **1**. Для синтеза полифторалкил-4-нитропиразолов **7** разработан одnoreакторный метод, основанный на нитрозировании литиевых дикетонатов **4** и последующей циклизации промежуточных 2-гидроксиимино-1,3-дикетонатов **5** с гидразинами. При этом в ряде случаев выделены 3-гидроксипиразолины **6** как интермедиаты. Пиразолы **6**, **7** были также получены из гидроксииминов **5** или их гидратов **8**. Восстановление 4-нитропиразолов **7** в гидрохлориды 4-аминопиразолов **9** реализовано с  $\text{SnCl}_2$ . В докладе обсуждается реакционная способность аминогруппы полифторалкилпиразолов. Биологические исследования показали, что аминокипиразолы **3** и **9** обладают умеренным противовоспалительным действием. Нитропиразолы **7** и их аминокипроизводные **9** проявили анальгетическую активность на уровне препарата сравнения анальгина.



Работа выполнена при финансовой поддержке РНФ (грант 16-13-10255).