

PR-97

АЛЬТЕРНАТИВНЫЕ ПОДХОДЫ К СИНТЕЗУ ПОЛИФТОРАЛКИЛСОДЕРЖАЩИХ 4-НИТРОЗОПИРАЗОЛОВ

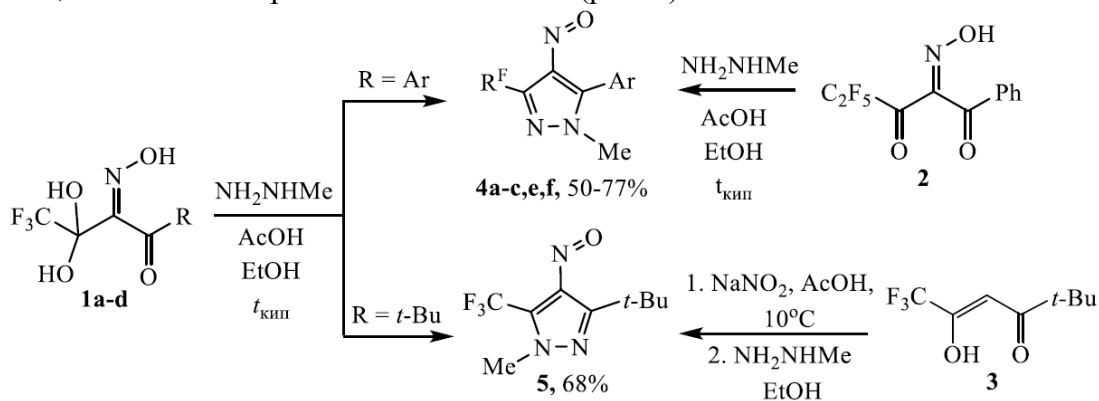
Л. С. Лапшин¹, Н. А. Агафонова², Я. В. Бургарт^{1,2}, В. И. Салоутин^{1,2}

¹Уральский федеральный университет им. первого Президента России Б. Н. Ельцина,
620002, Россия, г. Екатеринбург, ул. Мира, 19;

²Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского, УрО РАН,
620990, Россия, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской/Академическая, 20/22.

E-mail: Luka.lapshin@icloud.com

Недавно нами в ряду полифторалкилсодержащих 4-нитрозопиразолов найдены соединения с высокой антибактериальной, туберкулостатической и антимикотической активностями¹. Для их синтеза используют однореакторную последовательную обработку 1,3-дикетонов нитритом натрия и гидразинами или циклизацию 2-гидроксиимино-1,3-дикетонов с гидразинами. Однако ранее нами было установлено, что CF₃-содержащие 2-гидроксиимино-1,3-дикетоны выделяются в виде гидратов. В данной работе мы показали, что гидраты **1a-d** также могут применяться для синтеза нитрозопиразолов **4** в реакциях гетероциклизации с метилгидразином. При этом гидроксиимины **1a-c** с (гет)арильными заместителями образуют 4-нитрозо-3-полифторалкилпиразолы **4a-c** того же региоизомерного ряда, что и (2*E*)-4,4,5,5,5-пентафтор-2-(гидроксиимино)-1-фенилпентан-1,3-дион **2**. Однако в реакции 6,6,6-трифтор-5,5-дигидрокси-4-(гидроксиимино)-2,2-диметилгексан-3-она **1d** мы наблюдали образование 5-CF₃-изомерного 4-нитрозопиразола **5**. Причем направление циклизации не меняется при использовании one pot подхода при последовательном нитрозировании 6,6,6-трифтор-5-гидрокси-2,2-диметилгекс-4-ен-3-она **3** и конденсации с метилгидразином. Строение полученных соединений подтверждено с помощью ¹H, ¹⁹F и ¹³C спектроскопии ЯМР и РСА (рис. 1).



1: R = Ph (a), Thien-2-yl (b), Fur-2-yl (c), *t*-Bu (d);

4: R^F = CF₃, Ar = Ph (a), Thien-2-yl (b), Fur-2-yl (c); R^F = C₂F₅, Ar = Ph (e).

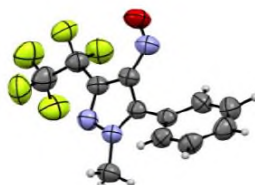


Рисунок 1 – Общий вид молекулы соединения **4e** по данным РСА

Библиографический список

1. Multiple biological active 4-aminopyrazoles containing trifluoromethyl and their 4-nitroso-precursors: Synthesis and evaluation / Ya.V. Burgart, N. A. Agafonova, [et al.] // Eur. J. Med. Chem. – 2020. – Vol. 208, N 112768.

Работа выполнена в рамках гос. задания АААА-А19-119011790134-1.