

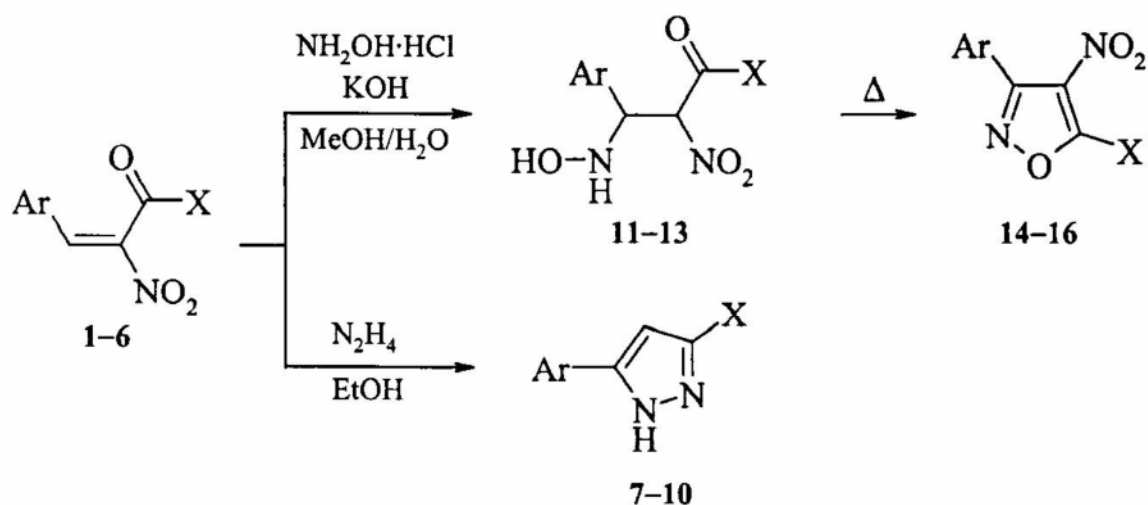
# Синтез замещенных пиразолов и изоксазолов на основе гем-ацилнитроэтенон

Абоскалова Н.И., Смирнова Н.Н., Скобелева А.В.,  
Берестовицкая В.М.

Российский государственный педагогический университет им. А.И. Герцена  
191186, Санкт-Петербург, наб. р. Мойки, 48

Известно, что многие производные пиразола и изоксазола обладают высокой фармакологической активностью и широко применяются в медицинской практике. К ним принадлежат, в частности, антипирин, анальгин, бутадиион, сульфаметоксазол, оксациллин, циклосерин и др.

С целью синтеза замещенных пиразолов и изоксазолов нами изучены реакции гидразина и гидроксиламина с  $\beta$ -ацил- $\beta$ -нитростиролами, зарекомендовавшими себя как высокорекреационноспособные соединения. Оказалось, что нитроенкетонны 1–4 реагируют с гидразином в этаноле при комнатной температуре с образованием замещенных пиразолов 7–10 (выходы до 76%). Однако в случае гем-ацилнитроэтенон 5, 6 успешному формированию гетероциклов препятствует наличие в бензольном кольце нитроалкена электронодонорной диметиламиногруппы. В этом случае процесс идет по другому пути и приводит к азину соответствующего альдегида.



X = Me: Ar = Ph (1, 7), *p*-MeOC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (3, 9), *p*-Me<sub>2</sub>NC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (5);

X = Ph: Ar = Ph (2, 8, 11, 14), *p*-MeOC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (4, 10, 12, 15), *p*-Me<sub>2</sub>NC<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (6, 13, 16)

Взаимодействие бензоильных аналогов 2, 4, 6 с гидроксиламином (хлоргидрат) при кипячении (водноспиртовая среда, KOH, выдержка 3 ч) приводит к нитро-содержащим изоксазолам 14–16 (выходы до 61%). Проведение реакции в менее жестких условиях (комнатная температура, выдержка 1 ч) позволило получить линейные продукты Ad<sub>N</sub> по C=C связи нитроенкетонны 11–13 (выходы до 95%), которые при кипячении в метаноле претерпевают гетероциклизацию в соответствующие нитроизоксазолы 14–16.

Строение синтезированных замещенных пиразолов и изоксазолов доказано спектральными методами. Температуры плавления соединений 7, 9, 10 и описанных в литературе образцов, полученных другими способами, совпадают.