

Пиразолсодержащие полициклические производные дигидротиофен-1,1-диоксида

Герасимов Д.Р., Цаплинская М.В., Ефремова И.Е.

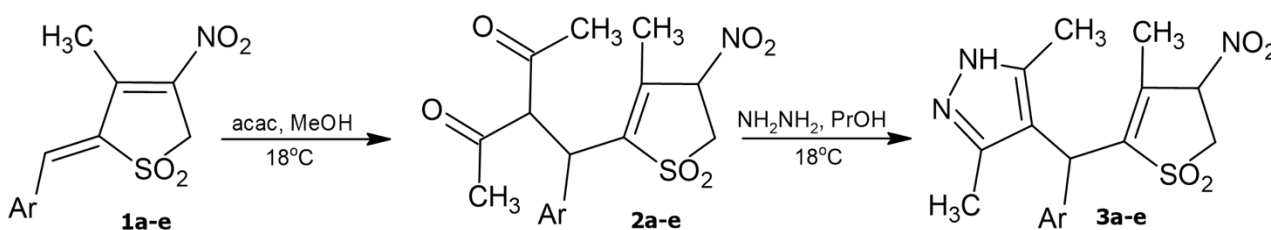
Российский государственный педагогический университет

им. А. И. Герцена, Санкт-Петербург, Россия

E-mail: kohrgpu@yandex.ru

Производные пиразола являются важными структурными блоками биологически активных соединений и лекарственных субстанций [1]. Определенный интерес в плане фармакологических свойств представляют пиразолсодержащие производные тиофен-1,1-диоксида, рекомендуемые для лечения заболеваний сердечно-сосудистой системы [2].

В плане развития работ по синтезу аннелированных сульфолано-пиразолидинов и пиразолинов [3], нами исследована возможность конструирования полициклических систем, содержащих неконденсированные кольца пиразола и дигидротиофен-1,1-диоксида. Схема синтеза включает присоединение ацетилацетона по диеновой системе бензилиденнитродигидротиофен-1,1-диоксидов **1a-e**, протекающее в мягких условиях (MeOH, 18°C), и последующее взаимодействие аддуктов Михаэля **2a-e** с гидразингидратом с образованием 5-(3,5-диметил-1H-пиразол-4-ил)арил-4-метил-3-нитро-2,3-дигидротиофен-1,1-диоксидов **3a-e** в виде смеси двух диастереомеров.



Ar = Ph **1a-3a**, 4-ClC₆H₄ **1b-3b**, 4-BrC₆H₄ **1c-3c**, 4-MeC₆H₄ **1d-3d**, 4-MeOC₆H₄ **1e-3e**

Строение соединений **3a-e** установлено на основании данных спектроскопии ИК, ЯМР ¹H, ¹³C, ¹H–¹³C HMQC, ¹H–¹³C HMBC, подтверждено данными элементного анализа.

Список литературы

- [1] Ivanova, A. E., Burgart, Y. V., Saloutin, V. I., Orshanskaya, Y. R., Zarubaev, V. V. // Mendeleev Commun. 2018. Iss. 28. P. 52.
- [2] Patent N 1433788, Int. Cl. C07D 413/14, A61K31/4155. Pyrazole-derivatives as factor Xa inhibitors : N 02028915.3 : register 23.12.2002 : published 30.06.2004 / The designation of the inventor has not yet been filed URL: <https://patents.google.com/patent/EP1433788A1/en/> (accessed: 22.11.2024).
- [3] Efremova I.E., Lapshina L.V., Baichurin R.I., Serebryannikova A.V., Savel'ev I.I. // Russ. J. Gen. Chem. 2020. Vol. 90. N 8. P. 1369.