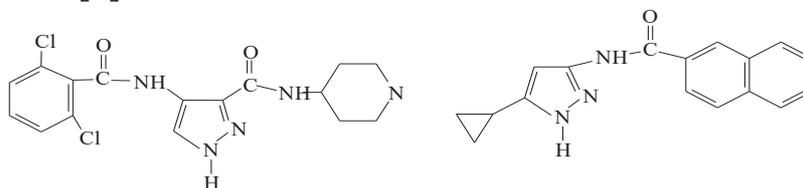


ИЗУЧЕНИЕ РЕАКЦИИ ДИБЕНЗАЛЬАЦЕТОНА С ФЕНИЛГИДРАЗИНОМ

Среди многообразия гетероциклических соединений, исследования которых развиваются и находят широкое практическое применение, важное место занимают пиразол и его производные. Органические соединения, содержащие в своей основе пиразольный цикл, редко встречаются в природе.

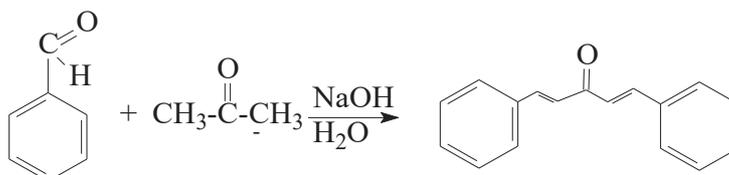
Впервые особенности пиразолов изучил немецкий химик Людвиг Кнорр. В 1883 году он обнаружил, что производные пиразола оказывают жаропонижающее действие. В 1954 году выделили первое производное пиразола, 3-нонилпиразол из растений семейства перечных. В 1959 году из семян арбуза был выделен β -(1-пиразолил)-аланин. Производные пиразола обладают широким спектром биологической активности. В медицине применяются в качестве нестероидных противовоспалительных препаратов, таких как антипирин (феназон), метамизол (аналгин).

Установлена противоопухолевая активность соединений на основе пиразола [1].

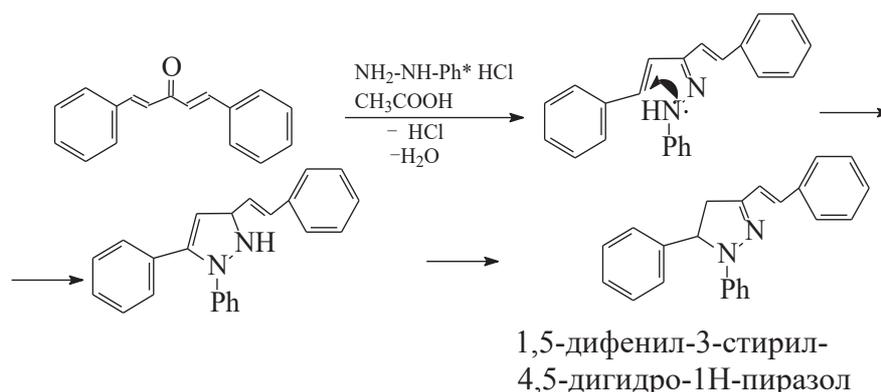


Пиразолы можно получить реакцией 1,3-дифункциональных систем с гидразином или его производными. В качестве субстратов используют: α,β -ненасыщенные ацетиленовые кетоны, винилкетоны, винилкетоны, содержащие уходящую группу при двойной связи.

Цель данной работы изучить реакцию дибензальацетона с фенилгидразином в разных условиях. Дибензальацетон получали реакцией конденсации избытка бензальдегида с ацетоном.



Реакцию циклоконденсации дибензальацетона проводили с солянокислым фенилгидразином в растворе уксусной кислоты при комнатной температуре [2]. Общий механизм реакции можно представить следующей схемой:



Реакцию проводили в течение 2 часов, затем оставляли на ночь при комнатной температуре. Выпавший осадок отфильтровали, затем исследовали фильтрат для более полного извлечения продукта. Для этого в маточный раствор добавили небольшое количество воды. В фильтрате продукта оказалось больше. Анализ полученных осадков показал, что они имеют одинаковый Rf в среде петролейный эфир – этилацетат (10:1) и температуры плавления отличались незначительно. В результате 1,5-дифенил-3-стирил-4,5-дигидро-1Н-пиразол был получен с выходом 64%. $T_{\text{пл}}$ 153–154°C.

Затем изучили реакцию дибензальацетона с молекулярным фенилгидразином в тех же условиях, а реакционную смесь оставляли в холодильнике. Продукт выделяли по той же схеме. Было установлено, что выход 1,5-дифенил-3-стирил-4,5-дигидро-1Н-пиразола немного ниже – 59%.

Следует отметить, что окисление гетероцикла до пиразольного в условиях проведения реакции не происходило.

Таким образом, применение фенилгидразина в виде солянокислой соли незначительно увеличивает выход целевого продукта.

Реакция дибензальацетона с фенилгидразином позволяет получать функционализированное производное пиразолина, которое, возможно, обладает физиологической активностью, а также интересно в плане получения новых производных на его основе.

ЛИТЕРАТУРА

1. Optimization of 6,6-dimethyl pyrrolo[3,4-c]pyrazoles: Identification of PHA-793887, a Potent CDK Inhibitor Suitable for Intravenous Dosing / M. Brasca, C. Albanese, R. Alzani et al. // *Bioorg. Med. Chem.* – 2011. – Vol. 18, № 15. – P. 1844–1853.

2. Botvinnik, E. Reaction of 1,5-Diphenyl-1,4-pentadien-3-one and 1,5-Diphenyl-1-penten-4-yn-3-one with Monosubstituted Hydrazines/ E. V. Botvinnik, A. N. Blandov, and M. A. Kuznetsov // *Russ. J. Org. Chem.* – 2001. – Vol. 37, № 3. – P. 421–425.