

БОБРОВСКАЯ О. В., ГЕЙН В. Л.

## СИНТЕЗ 3,4-ДИАРИЛ-5-(4-АЦЕТИЛАМИНОСУЛЬФОНИЛ ФЕНИЛ)-4,6-ДИГИДРОПИРРОЛО[3,4-С]ПИРАЗОЛ-6-ОНОВ

**Аннотация.** При взаимодействии 5-арил-4-ароил-1-(4-ацетиламиносульфонилфенил)-3-гидрокси-3-пирролин-2-онов с гидразингидратом в уксусной кислоте образуются 3,4-диарил-5-(4-ацетиламиносульфонилфенил)-4,6-дигидропирроло[3,4-с]пиразол-6-оны.

**Ключевые слова:** 5-арил-4-ароил-1-(4-ацетиламиносульфонилфенил)-3-гидрокси-3-пирролин-2-оны; гидразингидрат; 3,4-диарил-5-(4-ацетиламиносульфонилфенил)-4,6-дигидропирроло[3,4-с]пиразол-6-оны.

BOBROVSKAYA O.V., GEIN V.L.

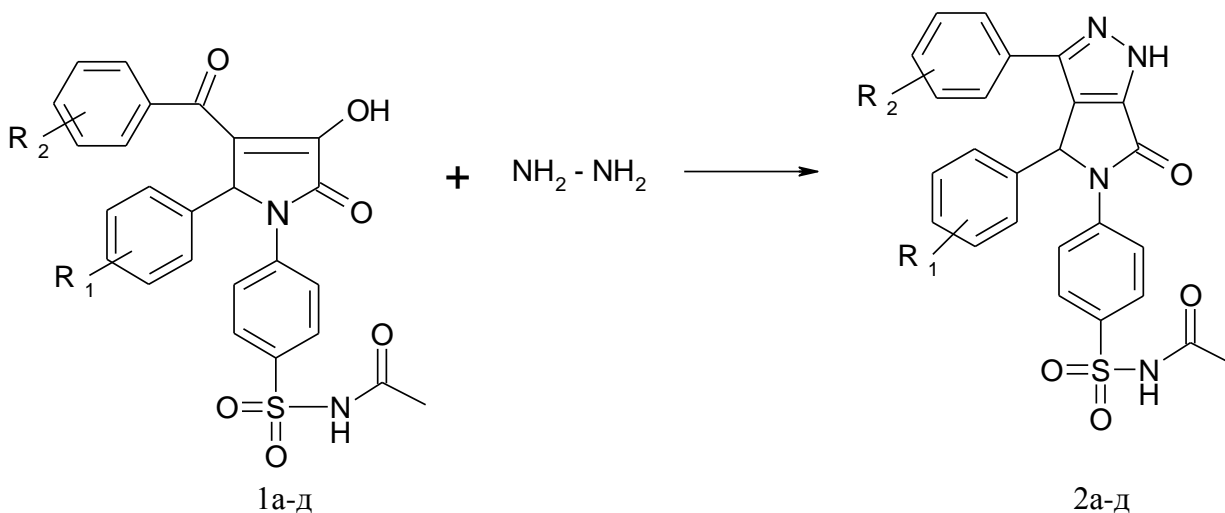
## SYNTHESIS OF 3,4-DIARYL-5-(4-ACETYLAMINOSULFONYLPHENYL)-4,6-DIHYDROPYRROLO[3,4-C]PYRAZOLE-6-ONES

**Abstract.** The synthesis of 3,4-diaryl-5-(4-acetylaminosulfonylphenyl)-4,6-dihydropyrrolo[3,4-c]pyrazole-6-ones was achieved by reaction of 5-aryl-4-aryl-1-(4-acetylaminosulfonylphenyl)-3-hydroxy-3-pyrrolin-2-ones with hydrazine hydrate in acetic acid.

**Keywords:** 5-aryl-4-aryl-1-(4-acetylaminosulfonylphenyl)-3-hydroxy-3-pyrrolin-2-ones; hydrazine hydrate; 3,4-diaryl-5-(4-acetylaminosulfonylphenyl)-4,6-dihydropyrrolo[3,4-c]pyrazole-6-ones.

Ранее были получены 3-гидрокси-3-пирролин-2-оны, содержащие в 1 положении 4-ацетиламиносульфонилфенильный заместитель [1], который входит в структуру известного лекарственного средства сульфацетамида натрия (сульфацил-натрия), относящегося к числу химиотерапевтических (антибактериальных) препаратов [2].

С целью синтеза конденсированных гетероциклических систем и изучения их биологической активности нами была исследована реакция 5-арил-4-ароил-1-(4-ацетиламиносульфонилфенил)-3-гидрокси-3-пирролин-2-онов (1а-д) с гидразингидратом. Установлено, что при кипячении исходных реагентов в течение 1-2 часов в ледяной уксусной кислоте образуются 3,4-диарил-5-(4-ацетиламиносульфонилфенил)-4,6-дигидропирроло[3,4-с]пиразол-6-оны (2а-д).



R<sub>1</sub> = 2-F, R<sub>2</sub> = 4-Cl (а); R<sub>1</sub> = 4-Cl, R<sub>2</sub> = H (б); R<sub>1</sub> = 3-F, R<sub>2</sub> = 4-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>O (в); R<sub>1</sub> = 2-F, R<sub>2</sub> = 4-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>O (г); R<sub>1</sub> = 4-F, R<sub>2</sub> = 4-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>O (д).

Полученные соединения (2а-д) представляют собой кристаллические вещества белого или желтого цвета, растворимые в ДМФА, ДМСО, при нагревании в ледяной уксусной кислоте, этаноле и нерастворимые в воде.

В спектрах ЯМР  $^1\text{H}$  3,4-диарил-5-(4-ацетиламиносульфонилфенил)-4,6-дигидропирроло[3,4-с]пиразол-6-онов (2а-д) наблюдается синглет трех протонов метильной группы ( $\text{CH}_3\text{CO}$ ) при 1,88-1,90 м. д., синглет метинового протона в положении 4 гетероцикла при 6,86-6,98 м. д., мультиплет ароматических протонов в области 6,98-8,02 м. д., синглет протона аминогруппы боковой цепи при 11,88-11,92 м. д., синглет протона аминогруппы гетероцикла  $\text{N}_{(1)}\text{H}$  при 13,93-14,17 м.д.

В ИК-спектрах соединений (2а-д) присутствуют полосы поглощения аминогруппы в двух интервалах от 3360 до 3260  $\text{cm}^{-1}$  и от 3280 до 3210  $\text{cm}^{-1}$ , полоса поглощения лактамного карбонила при 1730-1696  $\text{cm}^{-1}$ , амидного карбонила при 1692-1604  $\text{cm}^{-1}$ , полосы поглощения сульфонильной группы в двух интервалах от 1376 до 1344  $\text{cm}^{-1}$  и от 1164 до 1156  $\text{cm}^{-1}$ .

Синтезированные соединения (2а-д) в реакции со спиртовым раствором железа (III) хлорида не дают вишневого окрашивания, характерного для исходных 5-арил-4-ароил-1-(4-ацетиламиносульфонилфенил)-3-гидрокси-3-пирролин-2-онов (1а-д), что также подтверждает их структуру.

#### **Список литературы**

1. Синтез 5-арил-4-ароил-1-(4-ацетиламиносульфонилфенил)-3-гидрокси-3-пирролин-2-онов / Гейн В.Л., Бобровская О.В., Васильева В.С. // Актуальные вопросы образования и науки: сб. науч. трудов по материалам Междунар. научно-практ. конф. 30 декабря 2013 г.: в 14 частях. Часть 14. – Тамбов: Изд-во ТРОО «Бизнес-Наука-Общество», 2014. – С. 29 - 30.

2. Машковский М.Д. Лекарственные средства. - 15-е изд., перераб., испр. и доп. - М.: РИА Новая волна, 2008. - С. 828-829.

#### **ДАнные об авторах**

**Бобровская Ольга Васильевна** докторант кафедры общей и органической химии, к.ф.н., ГБОУ ВПО Пермская государственная фармацевтическая академия, ул. Полевая, 2, Пермь, 614990, Россия. E-mail: [bobban@mail.ru](mailto:bobban@mail.ru)

**Гейн Владимир Леонидович** зав. кафедрой общей и органической химии, д.х.н., проф., ГБОУ ВПО Пермская государственная фармацевтическая академия, ул. Полевая, 2, Пермь, 614990, Россия. E-mail: [geinvl48@mail.ru](mailto:geinvl48@mail.ru)