

СИНТЕЗ БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫХ СОЕДИНЕНИЙ НА ОСНОВЕ 3-ФТОРАРИЛПИРАЗОЛОНОВ

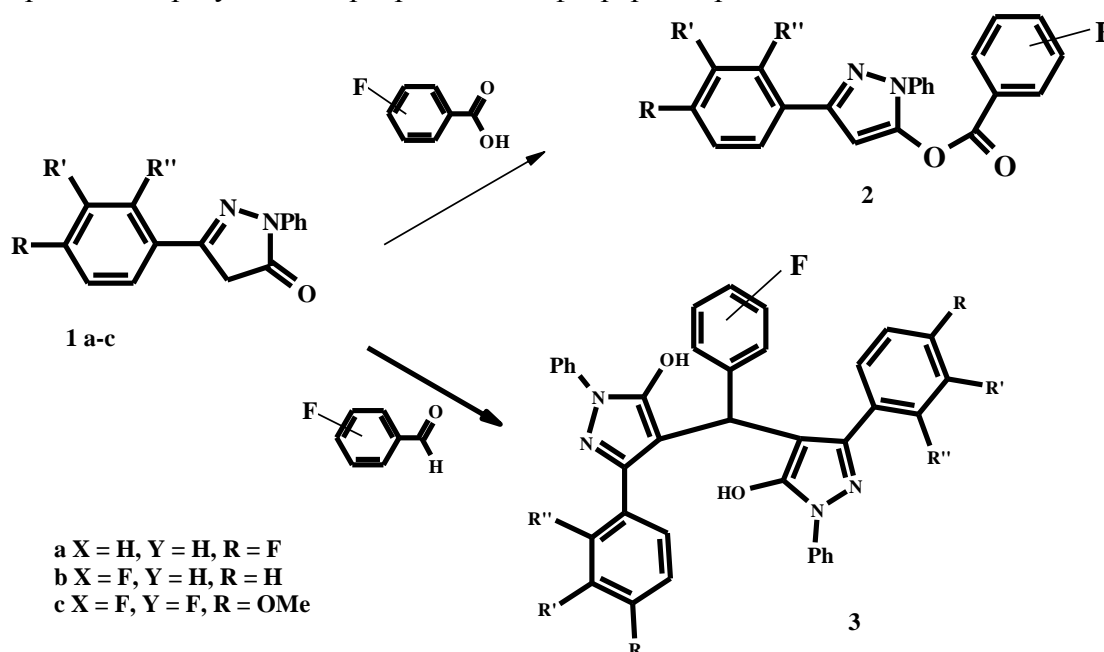
И.Н.Слабко¹, В.Н.Ковганко², Н.Н.Ковганко¹

¹Белорусский государственный медицинский университет, Беларусь,
labsuper@yandex.ru

²Белорусский государственный технологический университет, Беларусь.

Ранее нами сообщалось о синтезе на основе 3-фторарил-3-кетозэфиров гетероциклических соединений различных классов: замещенных 3-фторарилизоксазолонов и 3-фторарилпиразолонов [1, 2]. При этом для некоторых соединений обнаружена высокая микобактерицидная активность [1].

В развитие исследований по синтезу фторсодержащих гетероциклических соединений с антимикобактериальной активностью представлялось логичным использовать возможности химических трансформаций полученных ранее соединений. В данном сообщении приводятся результаты превращений 3-фторарилпиразолонов **1**.



Из соединений **1a-c** нами синтезированы 4- и 3-фторбензоаты 5-гидроксипиразолов **2** и фторсодержащие бис-(4-пиразолил-5-он)-фторарилметаны **3**.

Эфиры **2** получены в результате этерификации гидроксильной группы енольной формы соединений **1**. Превращение осуществляли взаимодействием фторбензойных кислот в присутствии дициклогексилкарбодиимида и каталитических количеств диметиламинопиридина. Для увеличения содержания енольной формы веществ **1a-c** реакцию проводили в смеси пиридина с метиленхлоридом.

Соответствующие бис-(4-пиразолил-5-он)-фторарилметаны **3** получают в результате последовательной конденсации пиразолонов **1** с 4-или 3-фторбензальдегидами по типу реакции Кневенагеля и дальнейшим присоединением по Михаэлю второй молекулы пиразолона. Превращение осуществляли при кипячении раствора пиразолонов **1** с фторбензальдегидами в этаноле (в соотношении 2:1) в присутствии соляной кислоты.

По нашему мнению для синтезированных соединений следует ожидать существенной биологической активности, в частности, микобактерицидной. Известно, что фторсодержащие азолы проявляют такую активность [3].

О результатах микробиологических исследований будет сообщено дополнительно.

ЛИТЕРАТУРА

- [1] Ковганко В.Н., Ковганко Н.Н., Симоненко Л.И., Слабко И.Н., Зинькова Т.Н., Креч А.В. *Весці Нацыянальнай акадэміі навук Беларусі. Сер. хім. навук.* 2013, № 3, 94.
- [2] Ковганко В.Н., Ковганко Н.Н. *Доклады НАН Беларусі.* 2013, **57**, 59.
- [2] Castagnolo D., De Logu A., Radi M., Vecchi B., Manetti F., Magnani M., Supino S., Meleddu R., Chisu L., Botta M. *Bioorg. Med. Chem.* 2008, **16**, 8587.