

Синтез N^1 -арил/бензил-3-гідразінопіразин-2(1H)-онів
Нетьосова К.Ю., Завада О.А., Журавель І.О., Полуян С.М.

*Кафедра лікарської та аналітичної токсикології,
Національний фармацевтичний університет,
м. Харків, Україна*

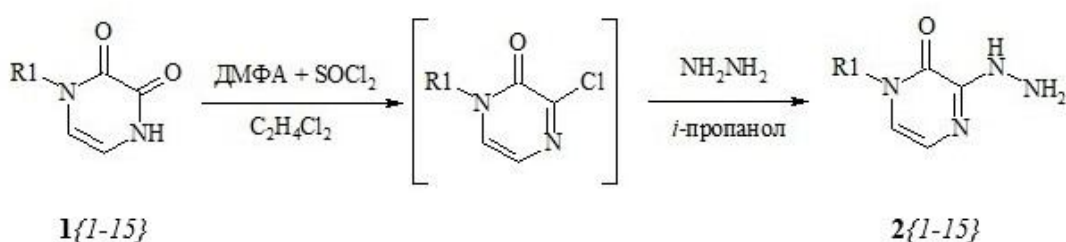
kulikovskaja.k@gmail.com

Вступ: згідно аналізу баз даних лікарських та біологічно активних речовин, що знаходяться на різних стадіях випробувань в Україні та світі, конденсовані системи гетероциклів становлять більшу їх частину. При цьому на долю нітрогеновмісних азолазинових систем припадає значний відсоток загальної кількості біологічно активних субстанцій.

З літературних джерел відомо, що похідні [1,2,4]триазоло[4,3-*a*]піразину проявляють значний спектр біологічної дії: антигістамінну, протимікробну, протигрибкову, протівірусну тощо. Більш системне вивчення та аналіз літературних даних щодо способів синтезу та фармакологічних характеристик похідних на основі зазначеної системи сприяє пошуку принципово нових підходів до їх синтезу, а також може стати поштовхом для розширення спектру дослідження фармакологічної активності.

Матеріали і методи: методи органічного синтезу; фізичні та фізико-хімічні методи аналізу органічних сполук (ЯМР-спектроскопія ^1H та ^{13}C); аналіз одержаних результатів та їх узагальнення, статистичні методи обробки експериментальних даних.

Результати та їх обговорення: як напівпродукти для синтезу похідних [1,2,4]триазоло[4,3-*a*]піразину використовують відповідні N^1 -арил/бензил-3-гідразінопіразин-2(1H)-они. Синтез N^1 -арил/бензил-3-гідразінопіразин-2(1H)-онів **2{1-15}** здійснювали за реакцією гідразінолізу проміжного 3-хлоропохідного:



R1 = Ph; 3,4-diMePh; 3,5-diMePh; 4-*i*-PrPh; 4-OMePh; 4-OEtPh; 4-BrPh;
4-ClPh; 3-FPh; 4-FPh; 3,4-diFPh; 3-Cl-2MePh; PhCH₂; 4-ClPhCH₂; 4-FPhCH₂.

В даній роботі запропоновано метод з використанням диметилформамідинію хлориду, який отримували змішуванням ДМФА і SOCl_2 у співвідношенні 1:1.1 та додавали до суспензії піразин-2,3-діонів **1{1-15}** в дихлороетані. Слід зазначити, що 3-хлоропіразин-2-они досить активно вступають в реакції з нуклеофільними реагентами, навіть з водою, що міститься у повітрі. Тому одержані сполуки одразу після вилучення із реакційного середовища вводили в подальші перетворення: у вигляді суспензії в пропанолі-2 обробляли надлишком гідразингідрату. Проходження реакції заміщення підтверджено елементним аналізом та даними ^1H ЯМР спектроскопії