

**МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
ВИЩИЙ ДЕРЖАВНИЙ НАВЧАЛЬНИЙ ЗАКЛАД УКРАЇНИ
«БУКОВИНСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ»**



МАТЕРІАЛИ

101 – ї

підсумкової наукової конференції

професорсько-викладацького персоналу

Вищого державного навчального закладу України

«БУКОВИНСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ»

10, 12, 17 лютого 2020 року

Чернівці – 2020

УДК 001:378.12(477.85)
ББК 72:74.58
М 34

Матеріали 101 – ї підсумкової наукової конференції професорсько-викладацького персоналу вищого державного навчального закладу України «Буковинський державний медичний університет» (м. Чернівці, 10, 12, 17 лютого 2020 р.) – Чернівці: Медуніверситет, 2020. – 488 с. іл.

ББК 72:74.58

У збірнику представлені матеріали 101 – ї підсумкової наукової конференції професорсько-викладацького персоналу вищого державного навчального закладу України «Буковинський державний медичний університет» (м.Чернівці, 10, 12, 17 лютого 2020 р.) із стилістикою та орфографією у авторській редакції. Публікації присвячені актуальним проблемам фундаментальної, теоретичної та клінічної медицини.

Загальна редакція: професор Бойчук Т.М., професор Іващук О.І.,
доцент Безрук В.В.

Наукові рецензенти:

професор Братенко М.К.
професор Булик Р.Є.
професор Гринчук Ф.В.
професор Давиденко І.С.
професор Дейнека С.Є.
професор Денисенко О.І.
професор Заморський І.І.
професор Колоскова О.К.
професор Коновчук В.М.
професор Пенішкевич Я.І.
професор Сидорчук Л.П.
професор Слободян О.М.
професор Ткачук С.С.
професор Тодоріко Л.Д.
професор Юзько О.М.
професор Годованець О.І.

ISBN 978-966-697-843-4

© Буковинський державний медичний
університет, 2020



Чорноус В.О.

ВИКОРИСТАННЯ РЕАКЦІЇ ГІДРАЗОНІВ МЕТИЛЦИКЛОАЛКІЛКЕТОНІВ З РЕАГЕНТОМ ВІЛЬСМАЙЄРА-ХААКА ДЛЯ СИНТЕЗУ НОВИХ ТИПІВ БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ ПОХІДНИХ ПІРАЗОЛУ

*Кафедра медичної та фармацевтичної хімії
Вищий державний навчальний заклад України
«Буковинський державний медичний університет»*

Реакція гідрозонів метилкетонів з комплексом «диметилформаїд – фосфору хлор оксид» (ДМФА- POCl_3), відомого як комплекс Вільсмейєра-Хаака, знайшов широке застосування у синтезі лікарських препаратів завдяки можливості приєднання формільного фрагменту до активованого атома Карбону, а також як дієвий спосіб синтезів гетероциклічних систем з альдегідною групою: 4-формілпіразолів, 4- та 5-формілімідазолів, 5-формілтіазолів, 3-формілхінолінів, тощо.

Широке коло лікарських препаратів гетероциклічного ряду передбачає використання в одній із стадій синтезу саме цієї реакції, як найбільш економічно доцільної та ефективної, що не потребує дорого вартісних каталізаторів та спеціальних умов для її проведення.

У деяких випадках, зважаючи на достатньо жорсткі умови проведення та агресивні реагенти, ця реакція супроводжується побічними процесами, які приводять до утворення оригінальних систем з цікавими для подальшої модифікації групами. Тому важливим є дослідження поведінки деяких об'єктів із лабільними фрагментами з метою розширення меж їх застосування у синтезах нових біологічно активних сполук.

Об'єктом дослідження нами обрано гідрозони метилциклопропілкетонів, які, завдяки особливостям будови молекули, ліофільності циклічного фрагменту досить часто використовуються у синтезах гетероциклічних систем з вираженою біологічною активністю.

Виявлено, що гідрозони циклогексил-, циклопентил- і циклобутилметилкетонів **1** при взаємодії з подвійною кількістю комплексу Вільсмейєра з високими виходами утворюють відповідні 1-метил(феніл)-3-циклоалкіл-4-формілпіразоли **2**. У випадку гідрозонів метилциклопропілкетону спостерігається розкриття циклопропанового фрагменту з утворенням суміші 1-метил(феніл)-3-циклопропіл-4-формілпіразолів **2a** та 1-метил(феніл)-3-(3-хлоропропіл)-4-формілпіразолів **3** у співвідношенні 2:3. Нами оптимізовано умови реакції, які забезпечують 100% конверсію гідрозонів метилциклопропілкетону у сполуки **3**.

Модифікацією альдегідної групи отримано ряд невідомих раніше похідних піразолу, які є перспективними прекурсорами у синтезі нових лікарських засобів.

Таким чином, нами розроблено ефективний шлях нових похідних піразолу, який передбачає взаємодію гідрозонів метилциклопропілкетонів з реагентом Вільсмейєра-Хаака і дозволяє отримати біоперспективні гетероциклічні системи.

