

СИНТЕЗ И ПРЕВРАЩЕНИЯ ПИРАЗОЛОПИРИМИДИНКАРБОГИДРАЗИДОВ

*А.С. Чувашилев, аспирант, *Х.С. Шихалиев, профессор, **Д.В. Крыльский, ведущий научный сотрудник, **М.И. Закиров, аспирант, Л.А. Бельдинский, младший научный сотрудник, А.И. Несмелов, старший научный сотрудник

кафедра Химии и технологии высокомолекулярных соединений им. С.С. Медведева
МИТХТ им. М.В. Ломоносова

* кафедра Органической химии Воронежского государственного университета

**НИИ прикладной акустики, Дубна

e-mail: nesmelov56@gmail.com

Путем гидразиолиза сложноэфирной группы в карбэтоксипиразолопиримидинах получены пиразолопиримидинкарбогидразиды. Функционализация гидразидной группы полученных соединений привела к образованию как аннелированных пиразолопиримидотриазепиновых систем, так и линейных пиразолопиримидинзамещенных пиразолондионов, диметилпиразолинов.

Pyrazolopyrimidincarbohydrazides were synthesised by hydrazinolysis of the ester group in carbethoxypyrazolopyrimidines. Functionalisation of the hydrazide group in the obtained compounds resulted in the formation of both annulated systems and of linear pyrazolopyrimidotriazepinones, pyrazolindiones, dimethylpyrazolines.

Ключевые слова: аминопиразол, пиразолопиримидины, пиразолопиримидинкарбогидразиды, пиразолопиримидотриазепины, синтез.

Key words: aminopyrazole, pyrazolopyrimidines, pyrazolopyrimidincarbohydrazides, pyrazolopyrimidotriazepines, synthesis.

3(5)-Аминопиразолы широко используются в органическом синтезе в качестве строительных блоков при получении конденсированных гетероциклов [1–5]. В частности, они служат исходными соединениями для пиразоло[1,5-*a*]пиримидинов, обладающих широким спектром биологической активности [6–13].

Так, среди производных пиразоло[1,5-*a*]пиримидина найдены вещества с антиэпилептической, антиконвульсивной, седативной и анксиолитической активностью [6, 7]. Среди пиразолопиримидинов и пиразолотриазининов найдены лиганды 5НТ-6-рецепторов, перспективные при лечении заболеваний ЦНС, мышечные релаксанты. Обнаружены соединения с антивирусной, антишистоматозной и противогрибковой активностью [9, 10], ингибиторы тирозинкиназы (противоопухолевые, противовоспалительные и антиатеросклеротические препараты), эффективные лиганды бензодиазепинового сайта ГАМК-рецепторов [11], антагонисты эстрогеновых рецепторов [12] и т.д.

В настоящей работе функционализация карбэтоксипиразоло[1,5-*a*]пиримидинов **2а-в**, полученных из 5-амино-3-метил-4-фенилпиразола (**1**), осуществлялась по введенной в структуру молекулы гидразидной группе согласно схеме 1.

Гидразиды **3а-в** получены путем воздействия на сложноэфирную группу соединений **2а-в** гидразином. В целях оптимизации условий процесса проведения реакций осуществляли в различных растворителях: метиловый, этиловый, изопропиловый, бутиловый спирты, диоксан, толуол, ксилол. Количество гидразингидрата варьировалось от 1 до 4 моль на 1 моль

исходного эфира. Оптимальным оказалось проведение реакции в бутиловом спирте с 4-кратным избытком гидразингидрата. Продолжительность реакции варьируется в пределах 2–4 ч в зависимости от исходного соединения.

В рамках данной работы полученные гидразиды вводились в реакции с различными моно- и биелектрофилами. Взаимодействие гидразидов **3а-в** с бензальдегидом в условиях азеотропной отгонки воды приводит к образованию оснований Шиффа **4а-в** (схема 2). Для соединения **4а**, как следует из спектра ¹Н-ЯМР, преобладающей является аминформа. В результате взаимодействия соединений **3а-в** с фенилизотиоцианатом получены замещенные тиомочевины **5а-в**, перспективные для последующей гетероциклизации (схема 2).

Взаимодействие 7-имино-2-метил-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-*a*]пиримидин-6-карбогидразида (**3а**) с ортоэфиром проходит через образование промежуточного соединения **6** и приводит к получению триазепинона **7**, существование которого возможно в таутомерных формах (схема 3).

Квантово-химическое обоснование существования той или иной таутомерных форм **7а-в** будет представлено позднее.

Анализ ¹Н-ЯМР-спектра продукта взаимодействия гидразида **3а** с триэтилортоформиатом подтверждает образование семичленного триазепинового цикла, о чем свидетельствует присутствие сигналов двух протонов эндоциклических аминогрупп триазепинового цикла наряду с двумя синглетами метиновых протонов и остальными характеристическими сигналами. Причем отсутствие в спектре продукта уширен-

Схема 1

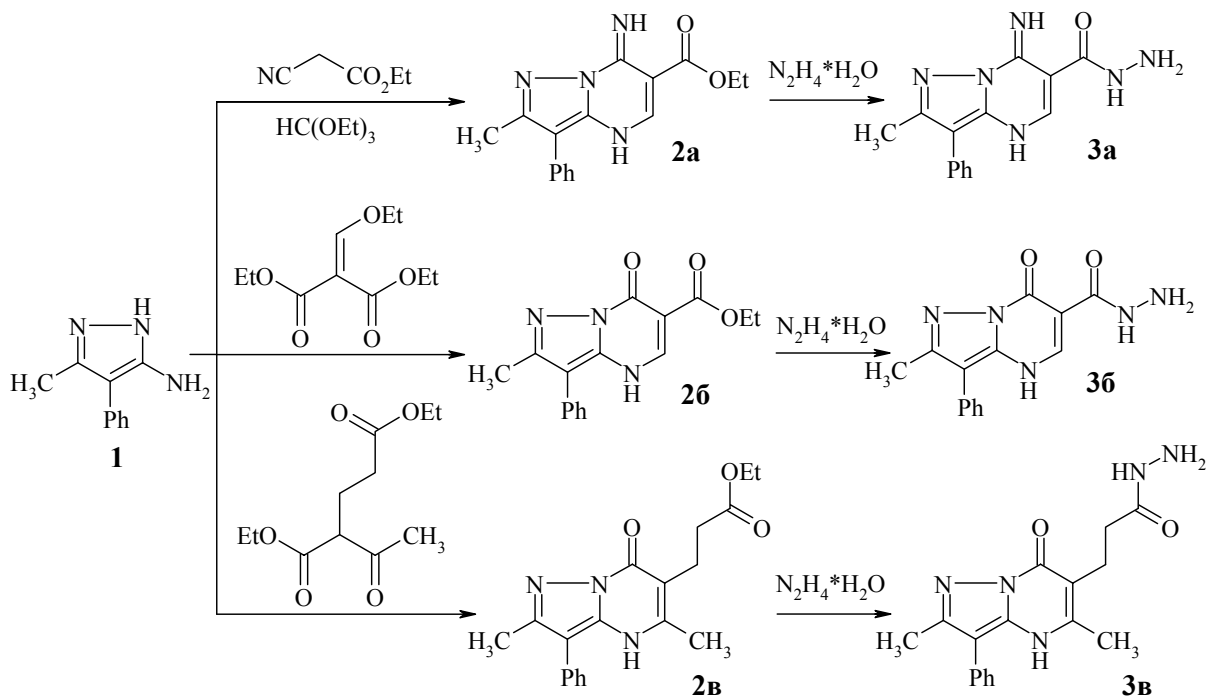


Схема 2

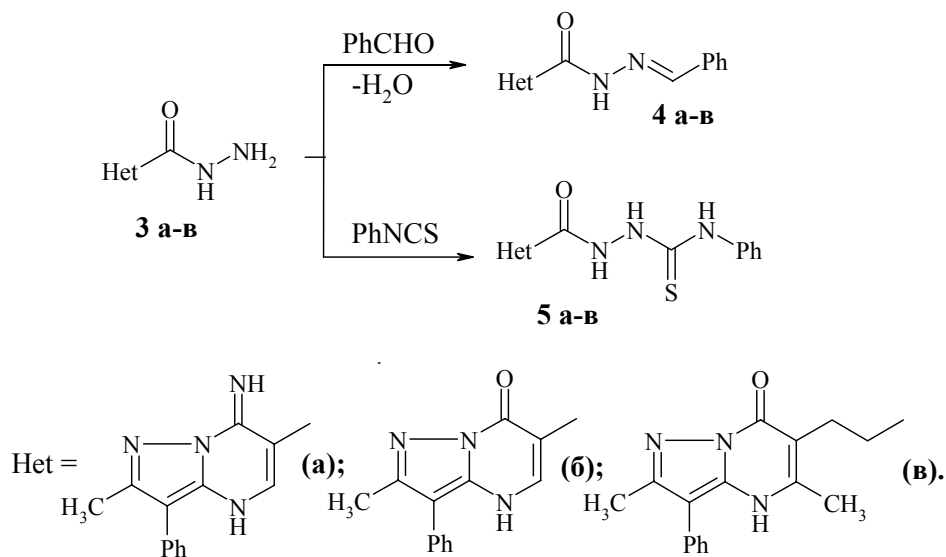
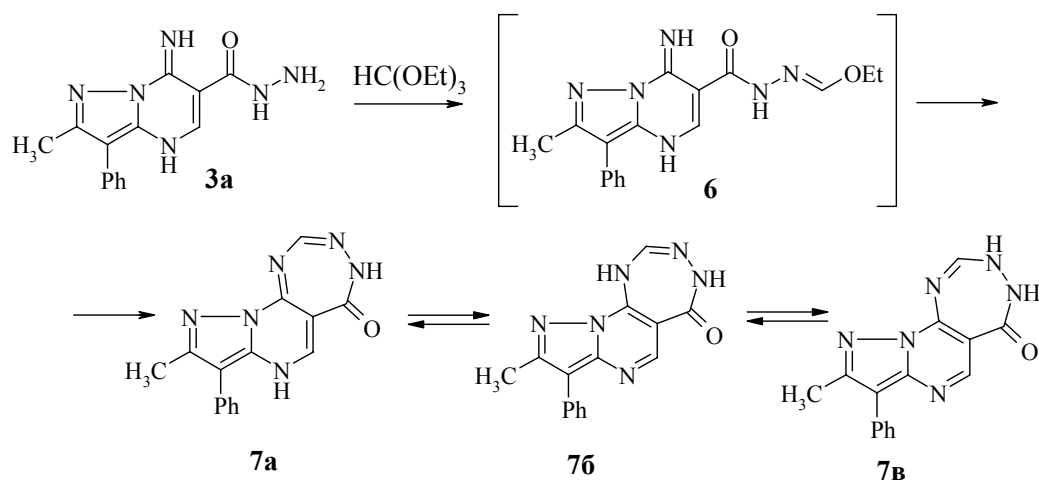


Схема 3



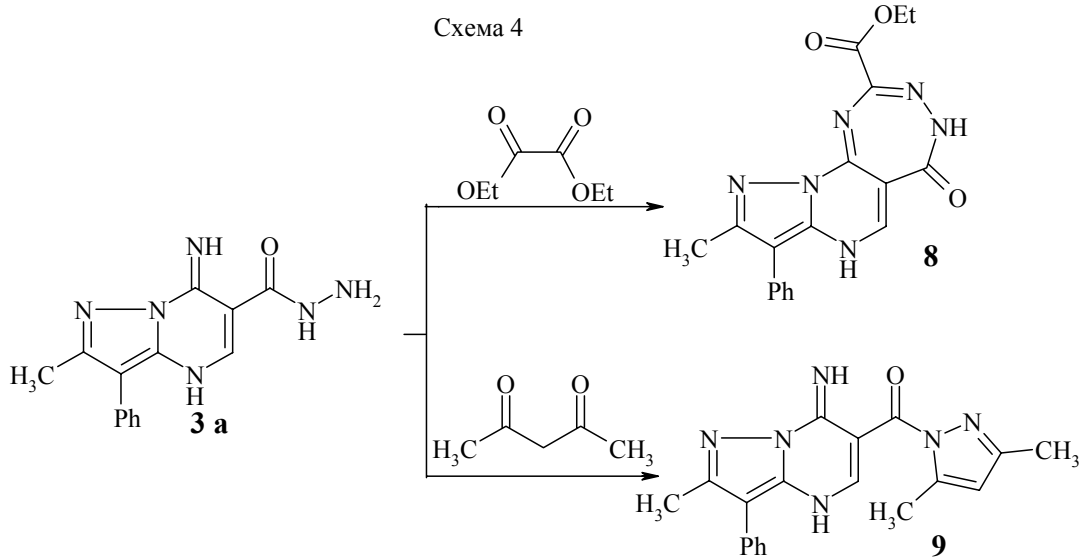
ного синглета NH-протона дигидропиримидинового цикла в области 8.6 м.д., наблюдающегося у предшественника **3a**, также говорит о существовании соединения **7** в ароматизированном виде.

Взаимодействие 7-имино-2-метил-3-фенил-4H-пиразоло[1,5-*a*]пиримидин-6-карбогидразида (**3a**) с диэтилоксалатом приводит, как и в случае с ортоэфиром, к образованию дигидротриазе-

пинонового цикла **8** (схема 4). Согласно данным ¹H-ЯМР, соединение **8** содержит дигидропиримидиновый цикл, о чем говорит наличие уширенного синглета одного NH-протона при 8.6 м.д.

Взаимодействие гидразида **3a** с ацетил-ацетоном протекает по ожидаемому пути [14] с образованием линейно связанного диметилпиразольного цикла **9**.

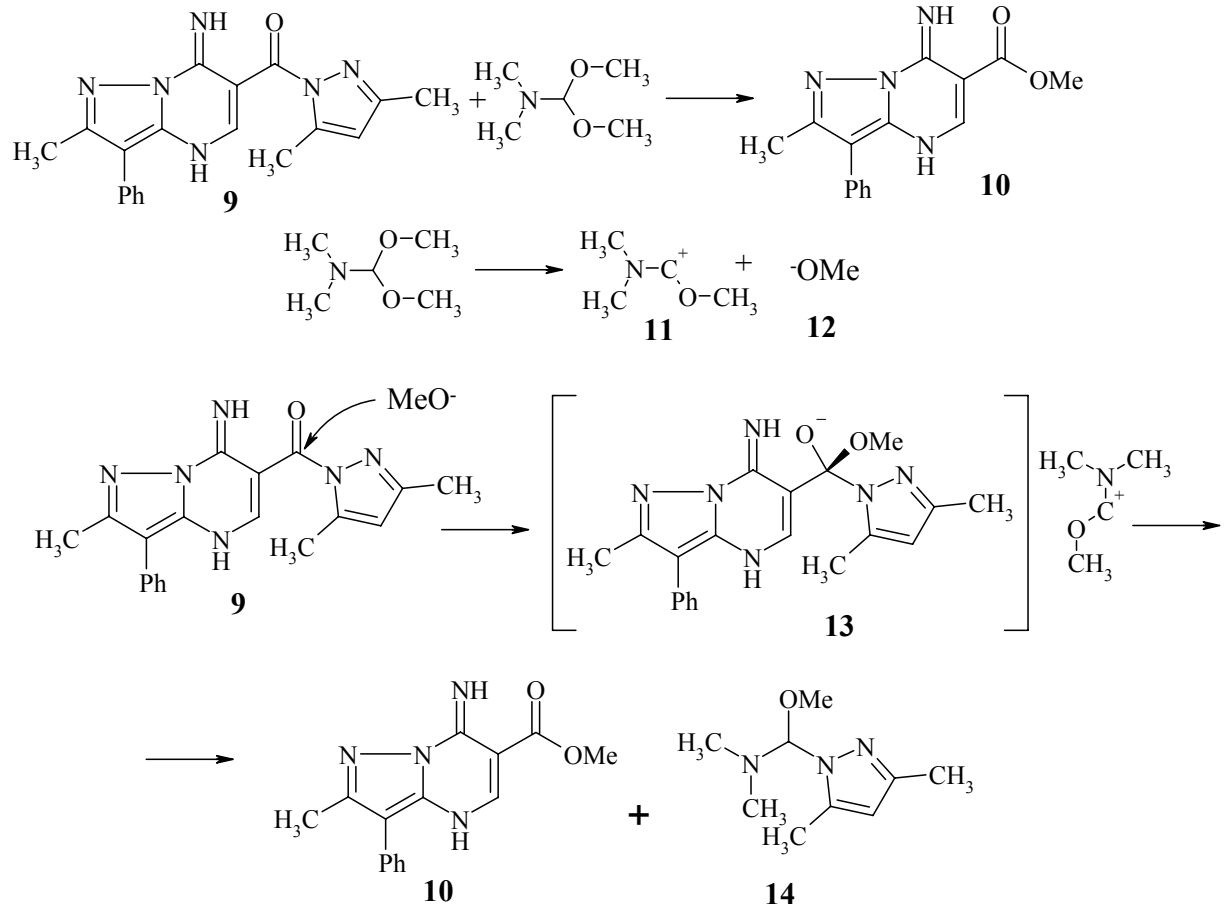
Схема 4



При попытке осуществить введение диметиламинотметиленовой группы в молекулу соединения **9** был получен метил 7-имино-2-

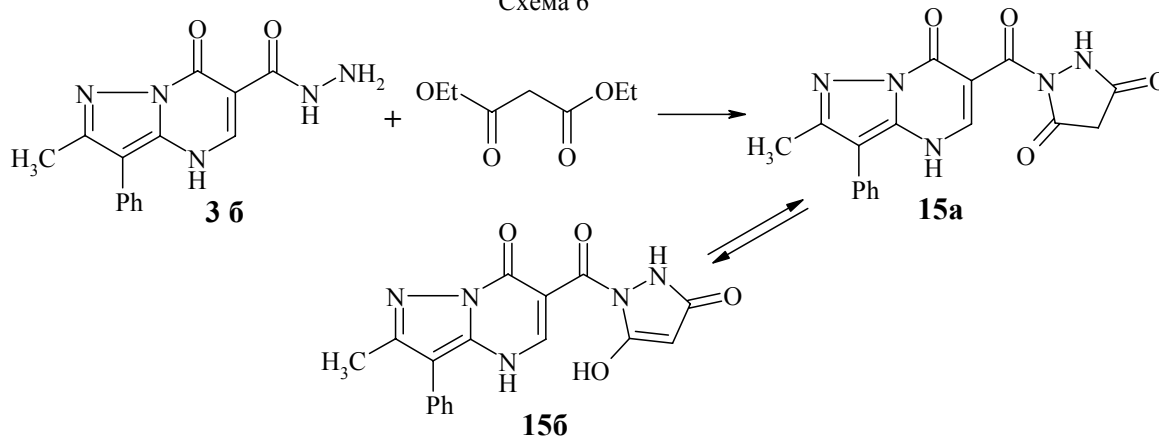
метил-3-фенил-4H-пиразоло[1,5-*a*]пиримидин-6-карбоксилат **10** (схема 5), спектрально идентичный ранее полученному этил 7-имино-

Схема 5



2-метил-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-карбоксилату (**2а**), за исключением разницы в сигналах эфирных групп. Предполагаемая схема реакции следующая: в полярном растворителе ДМАДМФ диссоциирует с образованием нуклеофильного карбаниона **12** [15]. Последний атакует электрофильный атом углерода карбонильной группы с образованием промежуточного комплекса **13**. В дальнейшем происходит отщепление карбаниона диметилпиразола и его взаимодействие с карбокатионом **11**, в

Схема 6



Экспериментальная часть

Контроль за ходом реакций и индивидуальностью синтезированных веществ осуществляли методом ТСХ на пластинках Silufol UV-254. Спектры ^1H -ЯМР регистрировали на приборе Bruker AC-300 (300 МГц) в $\text{DMSO-}d_6$, внутренний стандарт – Me_4Si . Исходный 5-амино-3-метил-4-фенилпиразол получен по методике [13].

Этил 7-имино-2-метил-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-карбоксилат (2а). Смесь 1.73 г (0.01 моль) аминопиразола **1**, 1.13 г (0.01 моль) цианукусного эфира и 1.49 г (0.01 моль) ортоэфира кипятили 3 ч в 5 мл ледяной уксусной кислоты. Охлаждали, осадок отфильтровывали, перекристаллизовывали из диоксана или ДМФА. Выход 2.5 г (84%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 1.40 (3H, т, OCH_2CH_3 , $J = 7.0$ Гц), 2.62 (3H, с, CH_3), 4.36 (2H, кв, OCH_2CH_3), 7.20-7.71 (5H, м, аром.), 8.42 (1H, с, имино-NH), 8.53 (1H, с, пиримид. NH), 8.62 (1H, с, HC^5). Найдено, %: C 64.73; H 5.51; N 18.50. $\text{C}_{16}\text{H}_{16}\text{N}_4\text{O}_2$. Вычислено, %: C 64.85; H 5.44; N 18.91.

Этил 2-метил-7-оксо-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-карбоксилат (2б). Смесь 1.73 г (0.01 моль) аминопиразола **1** и 2.16 г (0.01 моль) этоксиметилмалоната кипятили 1 ч с добавлением 1 мл уксусной кислоты. Осадок отфильтровывали, перекристаллизовывали из ледяной уксусной кислоты. Выход 1.9 г (64%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 1.36 (3H, т, OCH_2CH_3 , $J = 7.0$ Гц), 2.56 (3H, с, CH_3), 4.30 (2H, кв, OCH_2CH_3), 7.12-7.57 (5H, м, аром.), 8.50 (1H, с, пиримид. NH), 8.44 (1H, с, HC^5). Найдено, %: C

результате чего образуется побочный продукт **14** и соединение **10** (схема 5).

Взаимодействием 2-метил-7-оксо-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-карбогидрида (**3б**) с диэтилмалонатом получен 1-(2-метил-7-оксо-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-карбонил)пиразолидин-3,5-дион (**15**), существующий в таутомерной форме **15б** (схема 6).

Структура синтезированных соединений подтверждена методами ^1H -ЯМР-спектроскопии и элементного анализа.

64.70; H 5.11; N 14.15. $\text{C}_{16}\text{H}_{15}\text{N}_3\text{O}_3$. Вычислено, %: C 64.64; H 5.09; N 14.13.

Этил 3-(2,5-диметил-7-оксо-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-ил)пропаноат (2в). Смесь 1.73 г (0.01 моль) аминопиразола **1** и 2.60 г (0.01 моль) ацетилглутарата кипятили 1 ч с добавлением 1 мл уксусной кислоты. Осадок отфильтровывали, перекристаллизовывали из ледяной уксусной кислоты. Выход 2.8 г (83%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 1.36 (3H, т, OCH_2CH_3 , $J = 7.0$ Гц), 2.23 (2H, т, CH_2CH_2 , $J = 7.5$ Гц), 2.38 (3H, с, CH_3), 2.48 (3H, с, CH_3), 2.72 (2H, т, CH_2CH_2 , $J = 7.5$ Гц), 4.30 (2H, кв, OCH_2CH_3), 7.12-7.57 (5H, м, аром.), 8.50 (1H, с, пиримид. NH), 8.44 (1H, с, HC^5). Найдено, %: C 67.10; H 6.21; N 12.35. $\text{C}_{19}\text{H}_{21}\text{N}_3\text{O}_3$. Вычислено, %: C 67.24; H 6.24; N 12.38.

7-Имино-2-метил-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-карбогидрид (3а). Смесь 1 г (3.4 ммоль) эфира **2а** и 0.67 г (13.5 ммоль) гидразингидрата кипятили в 5 мл бутилового спирта в течение 3 ч. Выпавшие белые кристаллы отфильтровывали, промывали изопропиловым спиртом, перекристаллизовывали из смеси толуол-ДМФА. Выход 0.6 г (63%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 2.56 (3H, с, CH_3), 4.33 (2H, уш. с, NH_2), 7.2-7.75 (5H, м, аром.), 8.42 (1H, с, имино-NH), 8.55 (1H, с, пиримид. NH), 8.61 (1H, с, HC^5), 9.73 (1H, с, NH). Найдено, %: C 59.50; H 5.02; N 29.65. $\text{C}_{14}\text{H}_{14}\text{N}_6\text{O}$. Вычислено, %: C 59.56; H 5.00; N 29.77.

2-Метил-7-оксо-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-карбогидрид (3б). Получен аналогично соединению **3а** из 2.97 г (0.01 моль) эфира **2б** и 2 г (0.04 моль) гидразингидрата.

Выход 1.8 г (64%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 2.45 (3H, с, CH_3), 6.43 (2H, уш. с, NH_2), 7.15-7.72 (5H, м, аром.), 8.5 (1H, с, HC^5), 10.08 (1H, с, NH). Найдено, %: C 59.30; H 4.61; N 24.65. $\text{C}_{14}\text{H}_{13}\text{N}_5\text{O}_2$. Вычислено, %: C 59.36; H 4.63; N 24.72.

3-(2,5-Диметил-7-оксо-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-ил)пропангидразид (3в). Получен аналогично соединению **3а** из 3.39 г (0.01 моль) эфира **2в** и 2 г (0.04 моль) гидразингидрата. Выход 2.8 г (86%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 2.23 (2H, т, CH_2CH_2 , $J = 7.5$ Гц), 2.35 (3H, с, CH_3), 2.42 (3H, с, CH_3), 2.72 (2H, т, CH_2CH_2 , $J = 7.5$ Гц), 4.31 (2H, уш. с, NH_2), 7.11-7.70 (5H, м, аром.), 9.05 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: C 62.70; H 5.91; N 21.55. $\text{C}_{17}\text{H}_{19}\text{N}_5\text{O}_2$. Вычислено, %: C 62.76; H 5.89; N 21.52.

N-(Бензилиденамино)-7-имино-2-метил-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-карбоксамид (4а). Получен взаимодействием 2.82 г (0.01 моль) гидразида **3а** с 1.06 г (0.01 моль) бензальдегида в ксилоле с азеотропной отгонкой воды. Продукт не требует перекристаллизации. Выход 3.1 г (84%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 2.58 (3H, с, CH_3), 7.25-7.82 (10H, м, аром.), 8.41 (1H, с, $-\text{CH}=\text{N}-$), 8.72 (2H, уш. с, NH_2), 8.78 (1H, с, HC^5), 11.75 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: C 68.10; H 4.81; N 22.65. $\text{C}_{21}\text{H}_{18}\text{N}_6\text{O}$. Вычислено, %: C 68.09; H 4.90; N 22.69.

N-(Бензилиденамино)-2-метил-7-оксо-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-карбоксамид (4б). Получен аналогично соединению **4а** из 2.83 г (0.01 моль) гидразида **3б** и 1.06 г (0.01 моль) бензальдегида. Выход 2.9 г (78%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 2.54 (3H, с, CH_3), 7.22-7.78 (10H, м, аром.), 8.34 (1H, с, $-\text{CH}=\text{N}-$), 8.72 (1H, с, HC^5), 8.85 (1H, с, NH дигидропиримид.), 11.85 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: C 67.90; H 4.66; N 18.88. $\text{C}_{21}\text{H}_{17}\text{N}_5\text{O}_2$. Вычислено, %: C 67.91; H 4.61; N 18.86.

N-(Бензилиденамино)-3-(2,5-диметил-7-оксо-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-ил)пропанамид (4в). Получен аналогично соединению **4а** из 3.25 г (0.01 моль) гидразида **3в** и 1.06 г (0.01 моль) бензальдегида. Выход 3.62 г (88%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 2.20 (2H, т, CH_2CH_2 , $J = 7.5$ Гц), 2.35 (3H, с, CH_3), 2.52 (3H, с, CH_3), 2.70 (2H, т, CH_2CH_2 , $J = 7.5$ Гц), 7.22-7.78 (10H, м, аром.), 8.34 (1H, с, $-\text{CH}=\text{N}-$), 8.67 (1H, с, HC^5), 8.80 (1H, с, NH дигидропиримид.), 11.66 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: C 69.77; H 5.61; N 17.03. $\text{C}_{24}\text{H}_{23}\text{N}_5\text{O}_2$. Вычислено, %: C 69.72; H 5.61; N 16.94.

1-[(7-Имино-2-метил-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-карбонил)амино]-3-фенилтиомочевина (5а). Продукт получен кипячением 2.82 г (0.01 моль) гидразида **3а** с 1.35 г (0.01 моль) фенилизотиоцианата в этиловом спирте в течение 15 ч. Осадок отфильтровывали, промывали изопропиловым спиртом. Выход 3.0 г (72%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 2.58 (3H, с, CH_3), 6.25 (1H, с, NH), 7.20-7.90 (11H, м, аром. +

NH), 8.72 (2H, уш. с, NH_2), 8.78 (1H, с, HC^5), 11.75 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: C 60.40; H 4.62; N 23.55. $\text{C}_{21}\text{H}_{19}\text{N}_7\text{OS}$. Вычислено, %: C 60.42; H 4.59; N 23.48.

1-[(2-Метил-7-оксо-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-карбонил)амино]-3-фенилтиомочевина (5б). Продукт получен аналогично соединению **5а** из 2.83 г (0.01 моль) гидразида **3б** и 1.35 г (0.01 моль) фенилизотиоцианата. Выход 3.6 г (86%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 2.54 (3H, с, CH_3), 6.34 (1H, с, NH), 7.25-7.81 (11H, м, аром. + NH), 8.72 (1H, с, HC^5), 8.85 (1H, с, NH дигидропиримид.), 11.85 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: C 60.31; H 4.42; N 20.03. $\text{C}_{21}\text{H}_{18}\text{N}_6\text{O}_2\text{S}$. Вычислено, %: C 60.27; H 4.34; N 20.08.

1-[3-(2,5-Диметил-7-оксо-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-ил)пропаноиламино]-3-фенилтиомочевина (5в). Продукт получен аналогично соединению **5а** из 3.25 г (0.01 моль) гидразида **3в** и 1.35 г (0.01 моль) фенилизотиоцианата. Выход 3.9 г (85%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 2.20 (2H, т, CH_2CH_2 , $J = 7.5$ Гц), 2.35 (3H, с, CH_3), 2.52 (3H, с, CH_3), 2.70 (2H, т, CH_2CH_2 , $J = 7.5$ Гц), 6.18 (1H, с, NH), 7.15-7.69 (11H, м, аром.+ NH), 8.67 (1H, с, HC^5), 8.80 (1H, с, NH дигидропиримид.), 11.66 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: C 62.60; H 5.21; N 18.35. $\text{C}_{24}\text{H}_{24}\text{N}_6\text{O}_2\text{S}$. Вычислено, %: C 62.59; H 5.25; N 18.25.

9-Метил-8-фенил-1,4-дигидро-5Н-пиразоло[5',1':2,3]пиримидо[4,5-е][1,2,4]триазепин-5-он (7). Получен кипячением 2.82 г (0.01 моль) гидразида **3а** в ортоэфире с добавлением каталитического количества уксусной кислоты. Перекристаллизовывали из уксусной кислоты. Выход 2.2 г (75%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 2.62 (3H, с, CH_3), 7.3-7.75 (5H, м, аром.), 8.35 (1H, уш. с, NH триазепин.), 8.65 (1H, с, HC^5), 9.05 (1H, уш. с, NH триазепин.), 9.42 (1H, с, CH триазепин.). Найдено, %: C 61.71; H 4.12; N 28.65. $\text{C}_{15}\text{H}_{12}\text{N}_6\text{O}$. Вычислено, %: C 61.64; H 4.14; N 28.75.

Этил 9-метил-5-оксо-8-фенил-5,7-дигидро-4Н-пиразоло[5',1':2,3]пиримидо[4,5-е][1,2,4]триазепин-2-карбоксилат (8). Получен кипячением смеси 2.82 г (0.01 моль) гидразида **3а** с 2.19 г (0.015 моль) диэтилоксалата в ДМФА в течение 30 ч. Выпавшие кристаллы отфильтровывали, промывали изопропиловым спиртом. Выход 1.8 г (52%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 1.42 (3H, т, OCH_2CH_3 , $J = 7.0$ Гц), 2.55 (3H, с, CH_3), 4.33 (2H, кв, OCH_2CH_3), 7.35-7.70 (5H, м, аром.), 8.32 (1H, уш. с, NH триазепин.), 8.60 (1H, уш. с, NH пиримид.), 8.62 (1H, с, HC^5). Найдено, %: C 59.41; H 4.41; N 23.15. $\text{C}_{18}\text{H}_{16}\text{N}_6\text{O}_3$. Вычислено, %: C 59.34; H 4.43; N 23.06.

(3,5-Диметилпиразол-1-ил)-(7-имино-2-метил-3-фенил-4Н-пиразоло[1,5-а]пиримидин-6-ил)метанон (9). Смесь 2.82 г (0.01 моль) гидразида **3а** и 1 г (0.01 моль) ацетилацетона кипятили в этиловом спирте в течение 5 ч. Выпавший осадок отфильтровывали, промывали изопропиловым спиртом, перекристаллизовывали

вали из толуола. Выход 3.2 г (92%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 2.18 (3H, с, CH_3), 2.52 (3H, с, CH_3), 2.58 (3H, с, CH_3), 6.35 (1H, с, СН диметилпиразол), 7.35-7.70 (5H, м, аром.), 8.7 (1H, уш. с, имино-NH), 8.74 (1H, уш. с, NH пиримид.), 8.78 (1H, с, HC^5). Найдено, %: С 65.90; Н 5.21; N 24.45. $\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{N}_6\text{O}$. Вычислено, %: С 65.88; Н 5.24; N 24.26.

Метил 7-имино-2-метил-3-фенил-4H-пиразоло[1,5-*a*]пиримидин-6-карбоксилат (10). Смесь 3.46 г (0.01 моль) соединения **9** кипятили с 1.19 г (0.01 моль) ДМАДМФ в ДМА в течение 15 ч. Реакционную смесь разбавляли диэтиловым эфиром, осадок отфильтровывали и очищали на хроматографической колонке, заполненной окисью алюминия, элюент – хлороформ. Выход 2.15 г (76%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 2.61 (3H, с, CH_3), 3.82 (3H, с, OCH_3), 7.35-7.68

(5H, м, аром.), 8.33 (1H, уш. с, имино-NH), 8.43 (1H, уш. с, NH пиримид.), 8.60 (1H, с, HC^5). Найдено, %: С 63.70; Н 5.01; N 20.05. $\text{C}_{15}\text{H}_{14}\text{N}_4\text{O}_2$. Вычислено, %: С 63.82; Н 5.00; N 19.85.

1-(2-Метил-7-оксо-3-фенил-4H-пиразоло[1,5-*a*]пиримидин-6-карбонил)пиразолидин-3,5-дион (15). Получен кипячением смеси 2.83 г (0.01 моль) гидразида **36** с 1.6 г (0.01 моль) диэтилмалоната в 4 мл ДМФА. Реакционную смесь разбавляли изопропиловым спиртом, осадок отфильтровывали, перекристаллизовывали из смеси толуол-ДМФА. Выход 2.95 г (84%). Спектр ^1H -ЯМР (δ , м.д.): 2.61 (3H, с, CH_3), 7.30-7.62 (6H, м, аром.+ СН пиразолидин.), 8.42 (1H, с, HC^5), 10.41 (1H, с, NH пиримид.), 10.63 (1H, с, NH пиразолидин.), 13.10 (1H, уш. с, OH). Найдено, %: С 58.10; Н 3.71; N 19.75. $\text{C}_{17}\text{H}_{13}\text{N}_5\text{O}_4$. Вычислено, %: С 58.12; Н 3.73; N 19.93.

ЛИТЕРАТУРА:

1. Реакции α -аминоазолов с диэтилбензилиденмалонатом / В. В. Липсон, Т. М. Карножницкая, С. М. Десенко, С. В. Шишкина, О. В. Шишкин, В. И. Мусатов // Журн. орг. химии. – 2007. – Т. 43. – Вып. 2. – С. 257–262.
2. Синтез частично гидрированных пиразоло [3,4-*b*]хинолинонов конденсацией 3-амино-5-метилпиразола с ароматическими альдегидами и димедоном / В. В. Липсон, М. Г. Широкова, О. В. Шишкин, С. В. Шишкина // Журн. орг. химии. – 2006. – Т. 42. – Вып. 7. – С. 470–474.
3. Synthesis of novel hydropyrazolopyridine derivatives in solvent-free conditions via benzotriazole methodology / R. Abonia, E. Rengifo, J. Quiroga, B. Insuasty, J. Cobob, M. Noguerasb // Tetrahedron. – 2004. – Vol. 60. – P. 8839–8843.
4. Development of new fungicides against *Magnaporthe grisea*: Synthesis and biological activity of pyrazolo[3,4-*d*][1,3]thiazine, pyrazolo[1,5-*c*][1,3,5]thiadiazine, and pyrazolo[3,4-*d*]pyrimidine derivatives / C. B. Vicentini, G. Forlani, M. Manfrini, C. Romagnoli, D. Mares // J. Agric. Food Chem. – 2002. – Vol. 50. – P. 4839–4845.
5. Dang, Q. 5-Aminopyrazoles as dienophiles in the inverse electron demand Diels-Alder reactions of 2,4,6-tris(ethoxycarbonyl)-1,3,5-triazine: Syntheses of pyrazolopyrimidines / Q. Dang, B. S. Brown, M. D. Erion // J. Org. Chem. – 1996. – Vol. 61. – P. 5204–5205.
6. Synthesis of pyrazolo[1,5- α]pyrimidinone regioisomers / L. K. Gavrinn, A. Lee, B. A. Provencher, W. W. Massefski, S. D. Huhn, G. M. Ciszewski, D. C. Cole, J. C. McKew // J. Org. Chem. – 2007. – Vol. 72. – P. 1043–1046.
7. Dalinger, I. L. Liquid-phase synthesis of combinatorial libraries based on trifluoromethyl-substituted pyrazolo[1,5- α]pyrimidine scaffold / I. L. Dalinger, I. A. Vatsadse, S. A. Shevelev // J. Comb. Chem. – 2005. – Vol. 7. – P. 236–245.
8. Sadek, K. U. Reactions with heterocyclic amidines: Synthesis of several new pyrazolo[1,5- α]pyrimidines and pyrazolo[1,5-*c*]triazines / K. U. Sadek, M. A. Selim, M. A. El-Maghraby // J. Chem. Eng. Data. – 1985. – Vol. 30. – P. 514–515.
9. Senga, K. Synthesis and antischistosomal activity of certain pyrazolo[1,5- α]pyrimidines / K. Senga, T. Novinson, H. R. Wilson // J. Med. Chem. – 1981. – Vol. 24. – P. 610–613.
10. Novinson, T. Synthesis and antifungal properties of certain 7-alkylaminopyrazolo[1,5- α] pyrimidines / T. Novinson, R. K. Robins, T. R. Matthews // J. Med. Chem. – 1977. – Vol. 20. – P. 296–299.
11. Lager E. 4-Quinolone derivatives: High-affinity ligands at the benzodiazepine site of brain GABA receptors. Synthesis, pharmacology, and pharmacophore modeling / P. Andersson, J. Nilsson, I. Pettersson, E.O. Nielsen, M. Nielsen, O. Sterner, T. Liljefors // J. Med. Chem. – 2006. – Vol. 49. – P. 2526–2533.
12. Structure-guided optimization of estrogen receptor binding affinity and antagonist potency of pyrazolopyrimidines with basic side chains / H. B. Zhou, S. Sheng, D. R. Compton, Y. Kim, A. Joachimiak, S. Sharma, K. E. Carlson, B. S. Katzenellenbogen, K. W. Nettles, G. L. Greene, J. A. Katzenellenbogen // J. Med. Chem. – 2007. – Vol. 50. – P. 399–403.
13. The discovery of 4-(3-pentylamino)-2,7-dimethyl-8-(2-methyl-4-methoxyphenyl)-pyrazolo-[1,5-*a*]pyrimidine: A corticotropin-releasing factor (hCRF₁) antagonist / P. J. Gilligan, C. Baldauf, A. Cocuzza, D. Chidester, R. Zaczek, L. W. Fitzgerald, J. McElroy, M. F. Smith, H.-S. L. Shen, J. A. Saye, D. Christ, G. Trainor, D. W. Robertson, P. Hartig // Bioorg. Med. Chem. – 2000. – Vol. 8. – P. 181–184.
14. Вейганд-Хильгетаг. Методы эксперимента в органической химии (пер. с нем.) / Вейганд-Хильгетаг. – М. : Химия, 1968. – 454 с.
15. Граник, В. Г. Ацетали амидов и лактамов / В. Г. Граник. – М. : Вузовская книга, 2008. – 584 с.