

置換ヒドラジンとエナミノジケトン類の反応による 4-アロイル-5-アリルピラゾール類と 4-アロイル-3-アリルピラゾール類の合成研究

小峠里佳、西山卓志、山内明*、小野加奈子、波多江典之**、及川勉***、日比野俐、町支臣成

Heterocycles, **100**, 25-45 (2020).

SYNTHESIS OF 4-AROYL-5-ARYLPYRAZOLES AND 4-AROYL-3-ARYLPYRAZOLES VIA THE REACTION OF ENAMINODIKETONES WITH SUBSTITUTED HYDRAZINES

Rika Kotouge, Takashi Nishiyama, Akira Yamauchi, Kanako Ono, Noriyuki Hatae, Tsutomu Oikawa, Satoshi Hibino, and Tominari Choshi

ABSTRACT Pyrazole is a five-membered heterocyclic compound and is one of the important heterocycles in the fields of medicine and pharmacology. Here, we demonstrate the reactivity of symmetrical enaminodiketones **8–14** with substituted hydrazines. When using alkylhydrazines, if the substituent size of the alkyl group is small, it is possible to selectively synthesize 1-substituted 4-aryl-5-arylpyrazoles and their regioisomers, 1-substituted 4-aryl-3-arylpyrazoles, by choosing the solvent (EtOH or toluene). When they react with bulky substituted hydrazines (e.g., cyclohexyl, phenyl, or pyridyl), only 1-substituted 4-aryl- 5-arylpyrazoles are selectively obtained.

抄録 ピラゾールは 5 員環の複素環式化合物であり、医学および薬理学の分野における重要な複素環の 1 つである。そのピラゾール誘導体の合成において、以下に述べる現象を確認できたので報告する。この論文では、対称的なエナミノジケトン **8–14** と置換ヒドラジンとの反応性を検討した。アルキルヒドラジンを使用する場合、アルキル基の置換基サイズが小さい場合、溶媒を選択することにより、1-置換 4-アロイル-5-アリールピラゾールとその位置異性体である 1-置換 4-アロイル-3-アリールピラゾールを選択的に作り分けることができた (EtOH またはトルエン)。一方

でかさ高い置換ヒドラジン（例えば、シクロヘキシル、フェニル、またはピリジル）との反応では、1-置換 4-アロイル-5-アリールピラゾールのみが選択的に得られる現象を見出した内容である。

*Kawasaki Medical School

川崎医科大学

**Faculty of Pharmaceutical Sciences, Yokohama University of Pharmacy

横浜薬科大学薬学部

***Faculty of Pharmaceutical Sciences, Yokohama University of Pharmacy

神奈川県立保健福祉大学保健福祉学部

Faculty of Health & Social Services, Kanagawa University of Human Services