

## البحث الاول (بحث رقم 1 في قائمة الأبحاث محل تقييم اللجنة الموقرة )

|                            |  |
|----------------------------|--|
| <b>Title</b>               | A strategy for the synthesis of 2-aryl-3-dimethylaminopyrazolo-[3,4-c]pyridines that utilizes [4+1] cycloaddition reactions of 5-arylaazo-2,3,6-trisubstituted pyridines |
| <b>Authors</b>             | Haider Behbehani, Hamada Mohamed Ibrahim   |
| <b>Journal Information</b> | <i>Tetrahedron</i> , <b>69</b> , 10535-10543(2013)   |
| <b>ISSN</b>                | 0040-4020  |
| <b>Impact factor</b>       | 2.645(2015)  |

### الملخص العربي

الهدف من هذا البحث هو استطلاع إمكانية وعمومية ميكانيكة الاضافة الحلقية [4+1] والتي اكتشفت مؤخرا كأساس لتحضير فئات جديدة من مركبات البيرازولو[3,4-c]بيريدين. في هذا البحث تم اجراء التفاعل بين مركبات 3-اوكسو-2-اريل هيدرازونوبروبانال وبين 3-اوكسو-3-فينيل بروبانونتريل ووجد انه يعطي فئتين من المركبات طبقا للاستبدلات الموجودة في وحدة الاريل في مجموعة الهيدرازون وتلك المركبات هي

- 1- 6-اريل-2-فينيل-5-اريل ازونيكوتينونتريل وتلك المركبات تتكون عندما تكون وحدة الاريل في مجموعة الهيدرازون هي فينيل او فينيل محتوية على مستبدل معطى للالكترونات.
- 2- 2-امينو-6-اريل-5-اريل ازو-3-بنزويل بيردين وتلك المركبات تتكون عندما تكون وحدة الاريل في مجموعة الهيدرازون هي فينيل محتوية على مستبدل ساحبة للالكترونات.

وعلى نفس الطريقة المتوقعة تفاعلت مركبات 6-اريل-2-فينيل-5-اريل ازونيكوتينونتريل معثنائي ميثيل أسيتال ثنائي ميثيل الفورماميدفوجود الطولين ليعطى مركبات جديدة من فئة 6-اريل-2-داى ميثيل امينوبيرازولو[3,4-c]بيريدين محتوية على استبدلات جديدة وفريدة من نوعها وقد اثبتت تلك النتائجعموميةالميكانيكة المقترحة وهي الاضافة الحلقية [4+1] والتي تتضمن اضافة ثنائي الميثيل ميثوكسى كاربين المتكون منثنائي ميثيل أسيتال ثنائي ميثيل الفورماميد اثناء التفاعل وازضافة الى مركبات النيكوتينونتريل(الازادايين) ثم حلقة المركب الوسطى الغير مفصول ليعطى مركباتالبيرازولوبيريدين المرجو تحضيرها. وعند اجراء التفاعل بينمركبات2-امينو-6-اريل-5-اريل ازو-3-بنزويل بيردين وبينثنائي ميثيل أسيتال ثنائي ميثيل الفورماميد في نفس ظروف التفاعل لم يتكونالبيرازولوبيريدين ولكن تكون الاميدين المقابل لتلك المركبات والذي بغليانة في حمض الخليك في وجود خلاص الامونيوم اعطى مركبات البيردو[2,3-b]بيريميدين. تم إثبات التراكيب الكيميائية لهذه المركبات عن طريق طيف الكتلة وأشعة الرنين المغناطيسي وكذلكاستخدام تقنية الاشعة السينية للبلورة الواحدة لثمانية مركبات وذلك لتحديد التراكيب البنائية للمركبات المخلقة بصورة دقيقة.

## **Abstract:**

In order to explore the viability and generality of a recently uncovered [4+1] cycloaddition based strategy for the preparation of pyrazolo[3,4-*c*]pyridine derivatives, members of a series of 5-arylo-2,3,6-trisubstituted pyridines were prepared by reactions of 3-oxo-2-arylohydrazonopropanals with 3-oxo-3-phenylpropionitrile. The results show that 3-oxo-3-phenylpropionitrile reacts with hydrazone substrates, which do not contain electron withdrawing substituents on the *N*-aryl ring of the arylohydrazone moieties, to efficiently produce 6-aryl-2-phenyl-5-arylozonicotinonitriles. In contrast, 2-amino-6-aryl-5-arylo-3-benzoylpyridines are generated in reactions of 3-oxo-2-arylohydrazonopropanals which contain electron withdrawing substituents on the *N*-aryl moiety. In the forecasted manner, the 6-aryl-2-phenyl-5-arylozonicotinonitriles undergo smooth reactions with dimethylformamide dimethylacetal (DMF-DMA) that led to formation of a new class of 2-aryl-3-dimethylaminopyrazolo[3,4-*c*]pyridines. The mechanism for this process involves a [4+1] cycloaddition reaction that takes place through initial nucleophilic addition of (dimethylamino)methoxycarbene, generated from DMF-DMA, to the azadiene moiety of the arylozopyridines followed by cyclization of the formed zwitterionic intermediate.

قائم بعمل عميد الكلية

رئيس قسم الكيمياء

أ.د. خالد حسين حسن زغول