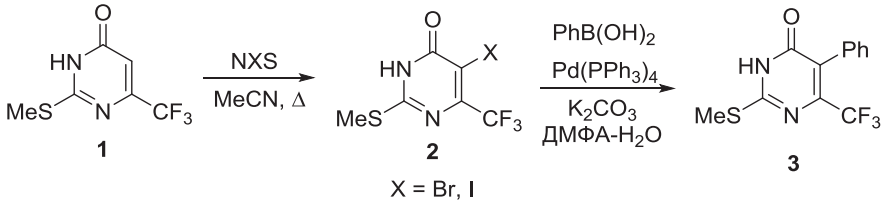
СИНТЕЗ 2-МЕТИЛСУЛЬФАНИЛ-5-ФЕНИЛ-6-ТРИФТОРМЕТИЛ-3*H*-ПИРИМИДИН-4-ОНА ПО РЕАКЦИИ СУЗУКИ

Мельников О.Э.[1,2], *Щегольков Е.В.*[2], *Бургарт Я.В.*[2], *Салоутин В.И.*[2]
[1] Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19
[2] Институт органического синтеза УрО РАН
620137, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22

Пиримидины, в том числе фторсодержащие, являются перспективным гетероциклическим ядром для создания соединений, обладающих различными видами биологической активности. Нами предложен метод синтеза 2-метилисульфанил-5-фенил-6-трифторметил-3*H*-пиримидин-4-она **3** на основе его 5-незамещенного прекрусора **1**. Для начала нами были получены 5-бром(йод)-2-метилтио-6-трифторметил-3*H*-пиримидин-4-оны **2** реакцией галогенирования исходного гетероцикла **1** с помощью N-бром(йод)сукцинимидов (NXS), которые затем были вовлечены в реакцию Сузуки с фенилбороновой кислотой с образованием целевого пиримидинона **3**.

Для поиска оптимальных условий кросс-сочетания по Сузуки нами проведена серия реакций галоген-пиридинов **2** с фенилбороновой кислотой при варьировании типа Pd катализатора и фосфониевого лиганда, растворителя и температуры проведения процесса. Наиболее эффективным оказалось использование 5-бром-2-метилтио-6-трифторметил-3*H*-пиримидин-4-она в качестве исходного соединения и проведение реакции в закрытых виалах в инертной среде при использовании основания K_2CO_3 и готовой каталитической системы $Pd(PPh_3)_4$ в ДМФА–H_2O при температуре 100 °C. Выход продукта **3** после очистки достигает 60%.



Найденные оптимальные условия в дальнейшем позволят ввести различные (гет)арильные заместители в положение С5 пиримидин-4-онового кольца, что позволит значительно расширить ряд этих гетероциклических систем для исследования их биологического потенциала.

Работа выполнена в рамках темы государственного задания АААА-А19-119011790132-7.