

СИНТЕЗ МЕТИЛ 4-ПИПЕРИДИНИЛ-(ДИ)ФТОРСАЛИЦИЛАТОВ*Барановский А.Д.^(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

Ранее показано, что эфиры полифторсалициловых кислот под действием насыщенных гетероциклических аминов подвергаются нуклеофильному ароматическому замещению атома фтора в активированном положении С4 с образованием 4-циклоаминозамещенных полифторсалициловых кислот, их эфиров и амидов [1]. При этом 4-(N-метилпиперазинил)содержащие производные обладали хорошей анальгетической активностью, а 4-морфонилсодержащие аналоги - умеренным противовоспалительным действием.

В данной работе нами исследовано взаимодействие метил полифторсалицилатов **1a,b** с пиперидином. Найдено, что для трифтор-содержащего производного **1b** реакция проходит в более мягких условиях в ацетонитриле при комнатной температуре, когда как для дифторсалицилата **1a** для полной конверсии потребовалось добавление основания DIPEA и нагревание реакционной массы до 50 °С (см. рисунок).

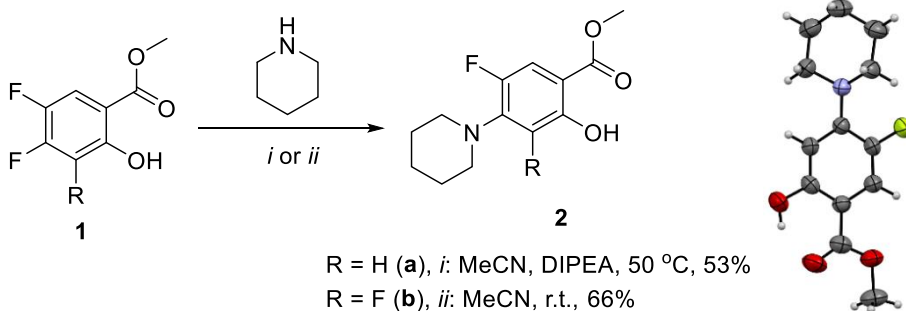


Схема синтеза метил 4-пиперидинил(ди)фторсалицилатов **2**

Строение полученных метил 4-пиперидинил-(ди)фторсалицилатов **2a,b** было подтверждено методами ИК и ЯМР спектроскопии. РСА, выполненный для монокристаллов соединения **2a** (см. рисунок), позволил однозначно установить строение полученных соединений. Найдена высокая ингибирующая антибактериальная активность соединения **2b** (МИК 7.8 мкг/мл) в отношении контрольного штамма *Neisseria gonorrhoeae* ATCC 49226/NCTC 12700.

1. Shchur I. V., Shchegolkov E. V., Burgart Y. V. et al. // ChemistrySelect. 2019. V. 4. P. 1483.

Работа выполнена в рамках темы государственного задания ИОС УрО РАН (проект АААА-А19-119011790130-3).