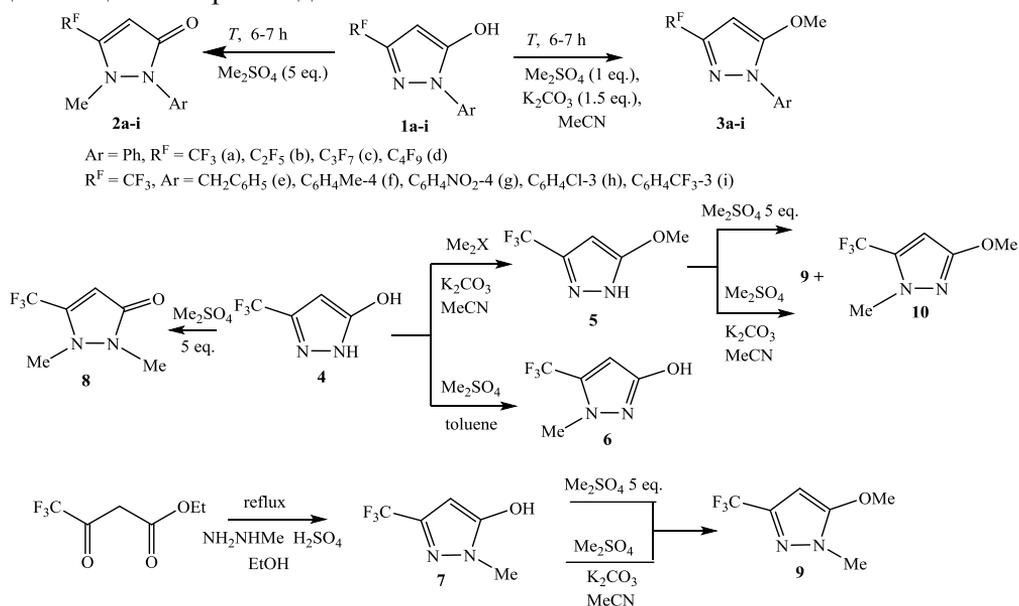


### МЕТИЛИРОВАНИЕ АМБИДЕНТНЫХ 3-ПОЛИФТОРАЛКИЛПИРАЗОЛ-5-ОЛОВ

Немытова Н.А., Щегольков Е.В., Бургарт Я.В., Салоутин В.И.

Институт органического синтеза УрО РАН  
620137, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22

Пиразолы являются привилегированными структурами, модификация которых приводит к созданию биоактивных молекул [1]. При исследовании метилирования 1-арил-5-гидрокси-3-полифторалкилпиразолов **1a-i**, имеющих конкурентные N- и O-нуклеофильные центры, найдены условия для селективного получения MeN-производных **2a-i** и MeO-изомеров **3a-i**. Полученные данные позволили нам подобрать условия для хемоселективного метилирования 3-трифторметил-5-гидроксипиразола **4**, имеющего три альтернативных нуклеофильных N<sup>1</sup>, N<sup>2</sup> и O-центра. В результате выполненных экспериментов предложены пути для получения трех изомерных N<sup>1</sup>-, N<sup>2</sup>- и O-монозамещенных продуктов **5-7** и трех изомерных N<sup>1</sup>,N<sup>2</sup>-, N<sup>1</sup>,O- и N<sup>2</sup>,O-дизамещенных производных **8-10**.



Среди синтезированных соединений обнаружены вещества с высокой анальгетической и противовоспалительной активностью, а также хорошей способностью проникать через искусственные мембраны путем пассивной диффузии.

1. Akhtar J. et al. // Eur. J. Med. Chem. 2017. V. 125. P. 143.

Работа выполнена при финансовой поддержке РФФ (грант 16-13-10255).