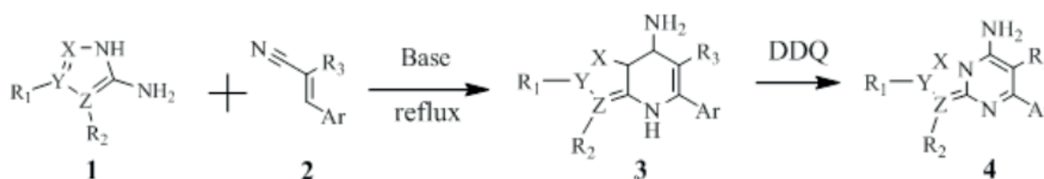


## СИНТЕЗ 5-АРИЛ-АЗОЛО[1,5-а]ПИРИМИДИНОВ – ПЕРСПЕКТИВНЫХ ПРОТИВОВОСПАЛИТЕЛЬНЫХ АГЕНТОВ

Буторин И.И., Уломский Е.Н., Воинков Е.К., Русинов В.Л.

*Химико-технологический институт, Уральский федеральный университет,  
ул. Мира 28, Екатеринбург, 620002, Россия,  
e-mail: iibutorin@urfu.ru*

Разработка эффективных терапевтических агентов в ряду азолоазинов в данный всё ещё является актуальным направлением в органической и медицинской химии. Установлено, что производные азолопиримидинов, могут быть вовлечены в регулирование широкого спектра биохимических процессов, среди которых особое место занимает воспалительный процесс. Ранее был синтезирован ограниченный ряд производных азоло[1,5-а]пиримидинов **4**, полученных в условиях реакции Михаэля из соответствующего аминоазола **1** и бензилиденмалонитрила (**2**, R<sub>3</sub> = CN)<sup>1</sup>



X, Y, Z = N, C

R<sub>1</sub> = -H, -SMe, -CH<sub>3</sub>, -furan-2'-yl, -CF<sub>3</sub>

R<sub>2</sub> = -H, -COOEt

R<sub>3</sub> = -CN, -NO<sub>2</sub>

Ar = -Ph, -Ph(4'-OMe), -Ph(4'-NMe<sub>2</sub>), -furan-2'-yl

В данной работе предлагается расширить ряд производных азоло[1,5-а] пиримидинов. Одним из наиболее привлекательных аспектов работы является использование арилиденнитроацетонитрила<sup>2</sup> (**2**, R<sub>3</sub>=NO<sub>2</sub>) в качестве субстрата для получения прежде неизвестной серии 7-амино-6-нитро-5-арил-азоло[1,5-а]пиримидинов и соответствующих им азоло[5,1-b]пуринов. Методом молекулярного докинга была установлена высокая аффинность исследуемого ряда соединений в отношении аденозинового A<sub>2a</sub> рецептора. Одно из соединений-лидеров – 7-амино-6-циано-3-(2'-фурил)-5-фенил(4'-метокси)- [1,2,4]триазоло[1.5-а]пиримидин имеет свободную энергию связывания -9,71 ккал/моль, что выше, чем у селективного ингибитора ZM241385 (-9,05 ккал/моль). Таким образом, соединения этой серии можно рассматривать как перспективные противовоспалительные средства.

### Литература

1. Wendt M. D., Kunzer A., et al. Tetrahedron Letters 2007, 48 (36), 6360–6363
2. Voinkov E.K., Ulomskiy E.N., et al. Mendeleev Communications 2016, 26 (2), 172-173