#  Me2P(O)CHN2 – НОВА ПЕРСПЕКТИВНА ПОХІДНА ДІАЗОМЕТАНУ В СИНТЕЗІ ЗАМІЩЕНИХ ПІРАЗОЛІВ

Пасічник Т.О., 1,2 Слободянюк Є.Ю.,2,3Григоренко О.О. 1,2

1 Київський національний університет імені Тараса Шевченка

01601, Київ, вул. Володимирська, 64/13;

2 ТОВ НВП "Єнамін", 02094, м.Київ, вул. Червоноткацька, 67

3 Інститут органічної хімії НАН України 02660, Київ, вул. Мурманська, 5

e-mail: pasichnyk4ok@ukr.net

Органічні молекули, що містять фосфор у своєму складі, відіграють значну роль в сучасній органічній та медичній хімії включаючи в себе широкий ряд представників від біомолекул, які виконують важливі функції в живих організмах до численних промислових агрохімічних та фармацевтичних сполук. Незважаючи на цей факт, присутність фосфіноксидного мотиву в такому типі речовин була досить обмеженою донедавна, поки не був затверджений перший фармацевтичний препарат, що містить P(O)Me2 групу [1].

З іншої сторони, нітрогеновмісні гетероциклічні сполуки, в тому числі піразоли, є одними з найпоширеніших фрагментів, що входять до складу лікарських препаратів, які проявляють широкий спектр фармакологічної дії [2]. Враховуючи наведені факти, а також нещодавні дослідження із впливу P(O)Me2 групи на фізикохімічні властивості сполук [3], можна дійти висновку, що пошук зручних, препаративних підходів до синтезу речовин з фосфіноксидною групою та піразольним кільцем і подальше дослідження їх властивостей є перспективним та актуальним завданням на сьогодні.

В даній роботі було досліджено синтез та властивості нового представника діазометанових похідних (сполука **2**) та його застосування в реакції [3+2] циклоприєднання із серією електронодифіцитних комерційно доступних алкінів. Нами була успішно розроблена зручна та ефективна методика проведення реакції із генеруванням діазосполуки in situ, яка дозволяє отримувати продукти в мультиграмових кількостях та з високими виходами за наступною схемою:



Даний метод дозволяє синтезувати широкий спектр похідних пірозолу з фосфіноксидною групою та бажаними замісниками, які можуть бути модифіковані та використані як перспективні білдинг блоки для потреб медичної хімії.

 [1] UCHIBORI, Ken, et al. Brigatinib combined with anti-EGFR antibody overcomes osimertinib resistance in EGFR-mutated non-small-cell lung cancer. *Nature communications*, 2017, 8.1: 1-16.

[2] KÜÇÜKGÜZEL, Ş. Güniz; ŞENKARDEŞ, Sevil. Recent advances in bioactive pyrazoles. *European Journal of Medicinal Chemistry*, 2015, 97: 786-815.

[3] FEDYK, Andrii, et al. Heteroaliphatic Dimethylphosphine Oxide Building Blocks: Synthesis and Physico‐Chemical Properties. *European Journal of Organic Chemistry*, 2021, 2021.47: 6591-6603.