

PR-68

СТРАТЕГИЯ С-Н АРИЛИРОВАНИЯ АЗОЛОАЗИНОВ АРОМАТИЧЕСКИМИ АМИНАМИ В ДИЗАЙНЕ ПЕРСПЕКТИВНЫХ ПРОТИВОВИРУСНЫХ ПРЕПАРАТОВ

Никифоров Е.А.¹, Васькина Н. В.¹, Мосеев Т. Д.¹, Вараксин М. В.^{1,2}, Федотов В. В.¹, Дрокин Р. А.¹, Буторин И. И.¹, Русинов В. Л.^{1,2}, Чарушин В. Н.^{1,2}, Чупахин О. Н.^{1,2}

¹ Уральский федеральный университет им. первого президента России Б.Н. Ельцина, 620002 Россия, Екатеринбург, ул. Мира, 19

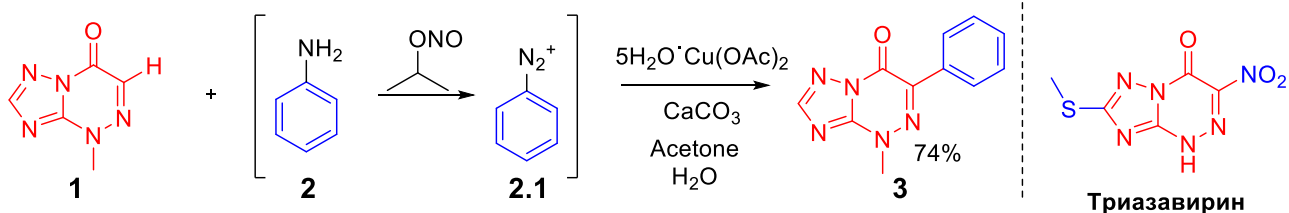
² Институт органического синтеза им. И.Я. Постовского, 620041 Россия, Екатеринбург, ул. Софьи Ковалевской, 22

E-mail: m.v.varaksin@urfu.ru

В настоящее время в связи с широким распространением новой коронавирусной инфекции SARS-CoV-2, а также постоянной мутацией штаммов вируса COVID-19 дизайн новых этиотропных препаратов, обладающих прямым противовирусным действием, является актуальной задачей фармацевтической и медицинской химии. Одним из подходов конструирования перспективных активных молекул и лекарственных препаратов на их основе является синтетическая стратегия направленной модификации известных скаффолдов, входящих в состав лекарственных средств, применяемых для профилактики и терапии инфекционных заболеваний.

Азолазины представляют собой семейство конденсированных азогетероциклических соединений, обладающих широким спектром биологической активности, в частности, противовирусной. Представителем данного класса соединений является препарат Триазавирин® – синтетический аналог оснований пуриновых нуклеозидов, который широко применяется для профилактики и терапии вирусов гриппа, клещевого энцефалита, ОРВИ, а также COVID-19.

Настоящая работа заключается в разработке нового синтетического приема для направленной химической модификации азолазиновых субстратов с целью получить новые функциональные производные азолазинов, представляющие интерес в дизайне перспективных противовирусных препаратов, в частности в отношении новой коронавирусной инфекции SARS-CoV-2.



Данный прием заключается во взаимодействии азолазина **1** с солями диазония, генерируемыми *in situ* при действии изопропилнитрита на ароматический амин **2** в присутствии ацетата меди (II) в качестве окислителя и карбоната кальция – в качестве основания. В результате удалось выделить производное азолазина, функционализированного фенильным фрагментом с выходом 74%.

В дальнейшем разработанную стратегию планируется расширить для модификации других производных азолазинового ряда при использовании разнообразных арилирующих агентов.

Исследование проводилось при финансовой поддержке Российского фонда фундаментальных исследований в рамках проекта № 20-53-55003.