

СИНТЕЗ И ЦИТОТОКСИЧНОСТЬ 2-АРИЛГИДРАЗНИЛИДЕН-1,3-ДИКЕТОНОВ И 4-АРИЛАЗОПИРАЗОЛОВ

Безбородова П.А.^(1,2), Худина О.Г.⁽²⁾, Бургарт Я.В.⁽²⁾, Салотин В.И.⁽²⁾

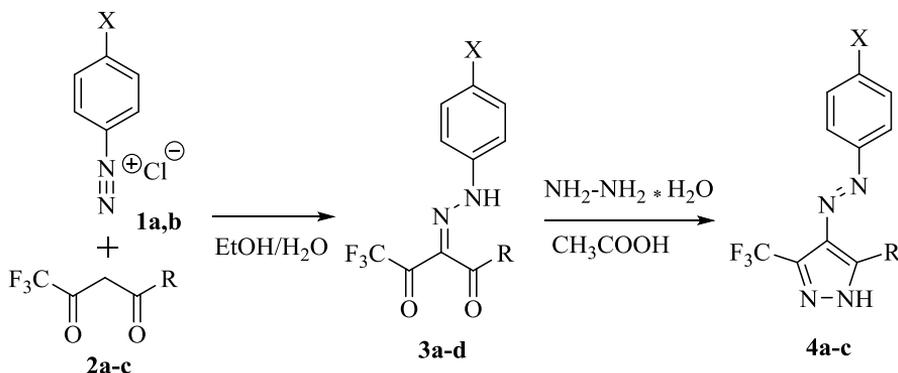
⁽¹⁾ Уральский федеральный университет

620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

⁽²⁾ Институт органического синтеза УрО РАН

620137, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22

Реакцией азосочетания солей арилдиазония **1**, содержащих 4-метилсульфонильный или сульфаниламидный фрагмент, с трифторметил-1,3-дикетонами **2** получены 2-арилгидразинилиден-1,3-дикетоны **3**. Конденсацией арилгидразонов **3** с гидразингидратом синтезированы 4-арилазопиразолы **4**.



X = SO₂Me (**1a**), SO₂NH₂ (**1b**); R = Tol (**2a**), Me (**2b**), Ph (**2c**);

X = SO₂Me, R = Tol (**3a**, **4a**); X = SO₂Me, R = Me (**3b**, **4b**);

X = SO₂Me, R = Ph (**3c**); X = SO₂NH₂, R = Tol (**3d**, **4c**)

Цитотоксичность соединений **3a**, **4a** исследована на культурах клеток A549 (карцинома легкого человека) и Нер-2 (эпидермоидная карцинома гортани человека) в ФГБУ «НИИ гриппа им. А.А. Смородинцева». Соединения **3a**, **4a** оказались высокотоксичными вещества на обеих культурах клеток. Культура клеток Нер-2 более чувствительна к данным соединениям по сравнению с культурой A549 (см. таблицу). Значения дозы препарата, вызывающей гибель половины клеток (ЦТД₅₀), у препарата **4a** на экспериментальных культурах различались почти в два раза.

Цитотоксичность соединений **3**, **4** на культурах клеток A549 и Нер-2

Соединение	ЦТД ₅₀ (мкг/мл) на культуре клеток А-549	ЦТД ₅₀ (мкг/мл) на культуре клеток Нер-2
3a	72	84
4a	102	63

Авторы благодарны Министерству науки и высшего образования Российской Федерации за финансовую поддержку (соглашение № 075-15-2020-777).