

СИНТЕЗ БИОАКТИВНЫХ ПИРАЗОЛОВ И ИЗОКСАЗОЛОВ НА ОСНОВЕ 2-АРИЛГИДРАЗИНИЛИДЕН-1,3-ДИКЕТОНОВ

Безбородова П.А.^(1,2), Худина О.Г.⁽²⁾, Елькина Н.А.⁽²⁾,

Бургарт Я.В.⁽²⁾, Салоутин В.И.⁽²⁾

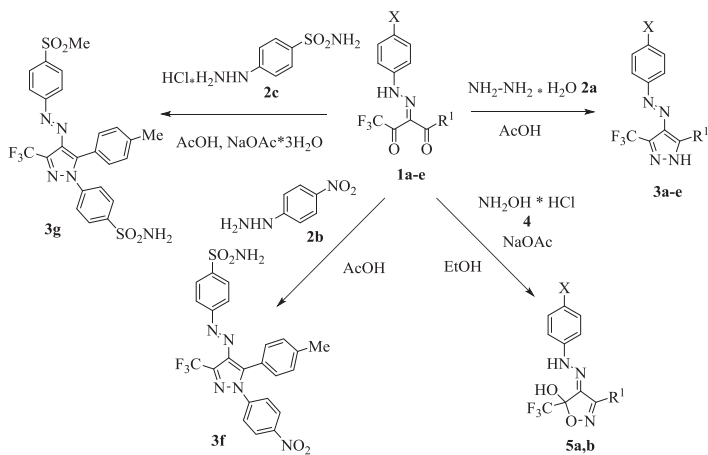
⁽¹⁾ Уральский федеральный университет

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

⁽²⁾ Институт органического синтеза УрО РАН

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

Региоселективной конденсацией трифторметилзамещенных 2-арилгидразинилиден-1,3-дикетонов **1a-e**, содержащих 4-метилсульфонильный или сульфаниламидный фрагмент, с гидразинами **2a-c** получены пиразолы **3a-g**. Реакцией арилгидразонов **1c,d** с гидрохлоридом гидроксиламина **4** синтезированы 2-изоксазолины **5a,b**.



X = SO₂Me, R¹ = Me (**1a, 3a**), Ph (**1b, 3b**), C₆H₄-4-Me (**1c, 3c, 5a**), C₆H₄-4-NO₂ (**1d, 3d, 5b**);

X = SO₂NH₂, R¹ = C₆H₄-4-Me (**1e, 3e**)

CF₃-Замещенные пиразолы **3c,e,f** протестированы на цитотоксичность на культурах клеток A549 (карцинома легкого человека), Нер-2 (эпидермоидная карцинома гортани человека) и HeLa (опухоль шейки матки) в ФГБУ «НИИ гриппа им. А.А. Смородинцева» г. Санкт-Петербург. Соединение **3e** проявило противораковую активность на культуре клеток HeLa, а пиразолы **3c,f** показали высокую цитотоксичность на всех испытанных культурах клеток.

В ФБУН НИИ эпидемиологии и микробиологии имени Пастера г. Санкт-Петербурга проведены испытания противовирусной активности соединений **3a,b,d** в отношении вируса гриппа A/Puerto Rico/8/34 (H1N1). Пиразол **3d** показал высокую противогриппозную активность и низкую цитотоксичность.

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