

C-H/C-X СОЧЕТАНИЯ АЗОЛОАЗИНОВ С АРОМАТИЧЕСКИМИ АМИНАМИ В ДИЗАЙНЕ ПЕРСПЕКТИВНЫХ ПРОТИВОВИРУСНЫХ ПРЕПАРАТОВ

Е. С. Кузнецов¹, Е. А. Никифоров¹, Т. Д. Мосеев¹, М. В. Вараксин^{1,2}, В. В. Федотов¹, Р. А. Дрокин¹, И. И. Буторин¹, В. Л. Русинов^{1,2}, В. Н. Чарушин^{1,2}, О. Н. Чупахин^{1,2}

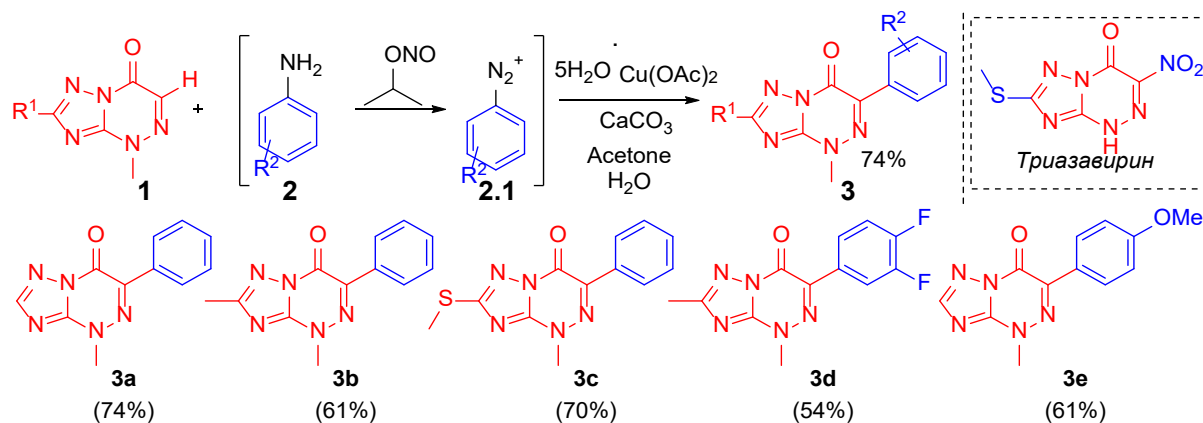
¹ Уральский федеральный университет им. первого президента России Б.Н. Ельцина, 620002 Россия, Екатеринбург, ул. Мира, 19

² Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского, 620041 Россия, Екатеринбург, ул. Софьи Ковалевской, 22
E-mail: m.v.varaksin@urfu.ru

Разработка новых этиотропных препаратов, обладающих противовирусным действием, в частности в отношении SARS-CoV-2, остается и будет одной из главных задач 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 изопронитрита на ароматический амин **2** в присутствии ацетата меди (II) в качестве окислителя и карбоната кальция в качестве основания. На данный момент удалось выделить 6 новых арилированных азолотриазинов **3** с выходами до 74%.

Исследование выполнено при финансовой поддержке Министерства науки и высшего образования Российской Федерации в рамках Программы развития Уральского федерального университета имени первого Президента России Б. Н. Ельцина в соответствии с программой стратегического академического лидерства «Приоритет – 2030».