

## R-173

## ТРИКАРБОНИЛЬНЫЕ «БИЛДИНГ-БЛОКИ» В СИНТЕЗЕ ТИОСЕМИКАРБАЗОНОВ С ПИРАЗОЛЬНЫМ ФРАГМЕНТОМ

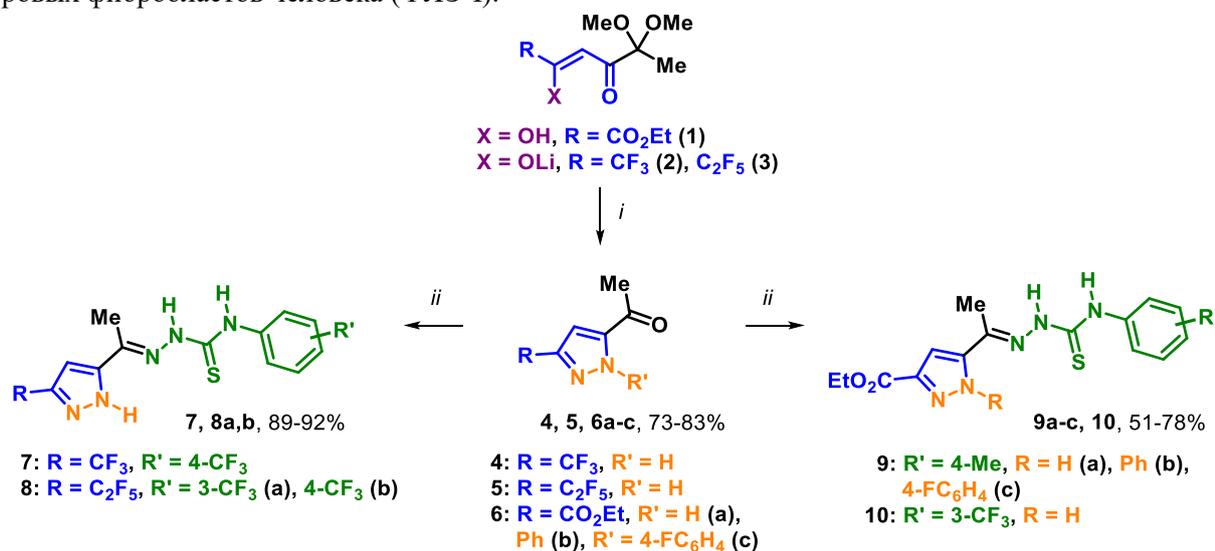
Ю. О. Эдилова, Ю. С. Кудякова, В. И. Салоутин, Д. Н. Бажин

Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского УрО РАН, 620108, Россия,  
г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской/Академическая, 20/22

E-mail: edilova\_yuliya@mail.ru

Тиосемикарбазоны обладают разной биологической активностью, и их гетероциклические производные особенно интересны в качестве противоопухолевых агентов<sup>1,2</sup>. Синтез тиосемикарбазонов, содержащих пиразольный фрагмент, может быть осуществлен с использованием 1,2,4-трикарбонильных «билдинг-блоков» согласно схеме 1.

Ранее показано, что аналоги 1,2,4-трикетонов **1–3** при взаимодействии с гидразинами в кислых условиях образуют ацетилпиразолы **4–6**<sup>3,4</sup>. Введение арилзамещенных тиосемикарбазидов в реакции конденсации с участием ацетильной группы пиразолов служит эффективным подходом к получению целевых соединений. Установлено, что фторсодержащие и нефторированные пиразолилтиосемикарбазоны **7–10** обладают селективным цитопатическим действием в отношении клеток аденокарциномы желудка человека (АКЖ) и низкой цитотоксической активностью в отношении здоровых фибробластов человека (ФЛЭЧ).



*i:*  $R'NHNH_2 \cdot \text{HCl}$ , EtOH, кипячение, 3 ч; *ii:*  $\text{ArNHC(S)NHNH}_2$ ,  $\text{HCl}_{\text{кат.}}$ , EtOH, кипячение, 3 ч.

Схема 1 – Синтез арилсодержащих тиосемикарбазонов

## Библиографический список

1. Novel thiosemicarbazone derivatives and their metal complexes: Recent development / N. P. Prajapati, H. D. Patel // Synth. Commun. – 2019. – Vol. 49. – P. 2767–2804.
2. Фторсодержащие пиразолилтиосемикарбазоны с противоопухолевой активностью : пат. 2772460 С1 Рос. Федерация / Ю. С. Кудякова, Ю. О. Эдилова, А. А. Штро [и др.]; патентообладатель ИОС УрО РАН ; заявл. 10.08.2021 ; опубли. 20.05.2022.
3. Фторсодержащие аналоги 1,2,4-трикетонов, открывающие новые возможности в гетероциклической и координационной химии / Д. Н. Бажин, Ю. С. Кудякова, Ю. О. Эдилова [и др.] // Изв. АН, Сер. хим. – 2022. – № 7. – С. 1321–1341.
4. Exploring three avenues: chemo- and regioselective transformations of 1,2,4-triketone analogs into pyrazoles and pyridazinones / Y. O. Edilova, E. A. Osipova, P. A. Slepukhin, [et al.] // Int. J. Mol. Sci. – 2023. – Vol. 24. – 14234.

Работа выполнена в рамках госзадания (гос. рег. № 124020500023-9).