

PR-30

СИНТЕЗ 4-АРИЛАЗО-3,5-ДИМЕТИЛПИРАЗОЛОВ КАК ЭФФЕКТИВНЫХ МИКОСТАТИКОВ

**О. Г. Худина¹, А. Е. Иванова¹, Я. В. Бургарт¹, Н. А. Герасимова²,
Н. П. Евстигнеева², В. И. Салоутин¹**

¹Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского УрО РАН,
620108, Россия, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской/Академическая, 20/22;

²Уральский научно-исследовательский институт дерматовенерологии и иммунопатологии,
620076, Россия, г. Екатеринбург, ул. Щербакова, 8

E-mail: kog@ios.uran.ru

Конденсацией 3-арилгидразилиденпентан-2,4-диона **1** с 2-гидроксиэтилгидразином, 4-нитрофенилгидразином, солянокислыми бензилгидразином и 4-гидразинилбензолсульфон-амидом, гидразингидратом получены 4-арилазопиразолы **2-4**. Пиразолы **5** синтезированы алкилированием незамещенных по азоту пиразолов **4** галогеналканами. Полученные соединения были исследованы на противогрибковую активность в отношении 9 видов патогенных дерматофитов *T. rubrum*, *T. gypsum*, *T. tonsurans*, *T. violaceum*, *T. interdigitale*, *T. schonlein*, *E. floccosum*, *M. canis*, а также дрожжеподобного грибка *C. albicans*. Проведенный анализ «структура-активность» показал, что высокую активность на уровне МИК <0.098-7,8 мкг/мл в отношении некоторых видов грибов проявили пиразолы **2, 4, 5** (X = Me, OMe), имеющие H, (CH₂)₄OAc, C₆H₄-NO₂ заместители при атоме азота в цикле. Умеренную активность (МИК 12.5-25 мкг/мл) показали пиразолы **5** с Et-N фрагментом (X = OMe, H). Низкая активность на уровне МИК 50-100 мкг/мл была обусловлена присутствием (CH₂)₂OH, (CH₂)₃CF₃ заместителей в гетероциклах **2** и **5** (X = OMe, H).

