

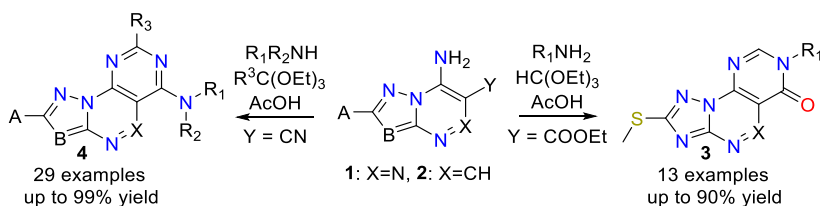
ПИРИМИДО-[5,4-*e*]АЗОЛО[1,5-*a*]ПИРИМИДИНЫ И ПИРИМИДО[4,5-*e*][1,2,4]ТРИАЗОЛО[5,1-*c*][1,2,4]ТРИАЗИНЫ

Берснева Е.В., Саватеев К.В., Мелехин В.В., Тохтуева М.Д., Русинов В.Л.

Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

Злокачественные опухоли являются второй по значимости причиной смерти во всем мире после сердечно-сосудистых заболеваний. В настоящее время поиск новых противоопухолевых препаратов является важнейшей задачей медицинской химии.

В ходе работы нами был разработан *one-pot* метод аннелирования пиримидинового цикла к ранее синтезированным карбонитрильным и этоксикарбонильным производным азолотриазинов **1** и азолопиримидинов **2**. В результате было обнаружено различие в реакционной способности исходных субстратов и структуре образующихся продуктов **3** и **4**. Кроме того, с помощью этих данных и контрольных экспериментов установлен вероятный механизм данного превращения, которое начинается с атаки амина на электронодефицитный атом углерода нитрильной/сложноэфирной группы.



Структура синтезированных соединений подтверждена всеми современными видами физико-химических анализов, в т. ч. и рентгеноструктурным.

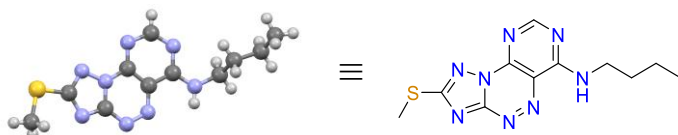


Рисунок 1

Некоторые из полученных гетероциклов были протестированы на цитотоксическую активность в отношении четыре клеточных линий: А-172, НерG2, А-549, НЕК-293. Показано, что для цитотоксического действия в отношении опухолевых клеток необходимо наличие метилсульфанильной группы в С5-положении гетероциклической системы.

Исследование выполнено за счет гранта Российского научного фонда и Правительства Свердловской области № 24-13-20011, <https://rscf.ru/project/24-13-20011/>.