ПОЛИФТОРАЛКИЛСОДЕРЖАЩИЕ ПИРАЗОЛЫ КАК УНИВЕРСАЛЬНАЯ ПЛАТФОРМА ДЛЯ СОЗДАНИЯ БИОАКТИВНЫХ СОЕДИНЕНИЙ

**В.И. Салоутин, Е.В. Щегольков, Н.А. Агафонова, О.Г. Худина,
Н.А. Елькина, Я.В. Бургарт**

Институт органического синтеза им. И.Я. Постовского УрО РАН,
620990, Россия, Екатеринбург, ул. С. Ковалевской/Академическая, 22/20.

DOI: 10.19163/MedChemRussia2021-2021-20

E-mail: saloutin@ios.uran.ru

Пиразольный структурный мотив является признанным привилегированным скаффолдом медицинской химии, поскольку на его основе создан большой ряд лекарственных препаратов с различными фармакологическими эффектами.

В докладе обсуждается методология создания биоактивных соединений на основе полифторалкил-содержащих пиразолов с привлечением различных методов химических трансформаций. Показана возможность модификации пиразольного каркаса по всем положениям. Приведены экспериментальные данные по тестированию биологических свойств производных пиразола. Определены соединения-хиты с антибактериальным, антимикотическим, антиоксидантным, противоопухолевым, анальгетическим действием. Установлены закономерности «структура – активность», которые могут быть полезны для дизайна лекарственных препаратов на основе пиразольного скаффолда.

Возможности химической модификации пиразольного остова:

$R^F = \text{Me}, \text{CF}_3, \text{CF}_2\text{H}, \text{C}_2\text{F}_5, \text{C}_2\text{F}_4\text{H}, \text{C}_3\text{F}_7, \text{C}_4\text{F}_9$;
 $R^1 = \text{H}, \text{Ar}, \text{CO}_2\text{X}, \text{N}=\text{NAr}(\text{Het}), \text{N}=\text{O}, \text{NH}_2 \text{ etc}$;
 $R^2 = \text{H}, \text{Alk}, \text{Ar}, \text{Het}, \text{OH}$;
 $R^3, R^4 = \text{H}, \text{Alk}, \text{Ar}, \text{Het}, \text{CSNH}_2, \text{COAr}(\text{Het})$

Биологическое действие:

- анальгезирующее,
- противовоспалительное,
- противовирусное,
- противогрибковое,
- антибактериальное,
- противоопухолевое

Работа выполнена при финансовой поддержке РФФ, грант 21-13-00390.