

DOI: 10.15643/vnpm-2023-28

## СИНТЕЗ И ПРОТИВОВИРУСНАЯ АКТИВНОСТЬ 1,2,3-ТРИАЗОЛИЛПРОИЗВОДНОГО 2,3-ИНДОЛО-ОЛЕАНОЛОВОЙ КИСЛОТЫ

*Ахметкириева В.Р.<sup>1</sup>, Петрова А.В.<sup>2</sup>*

<sup>1</sup>Башкирский государственный университет, Уфа, Россия

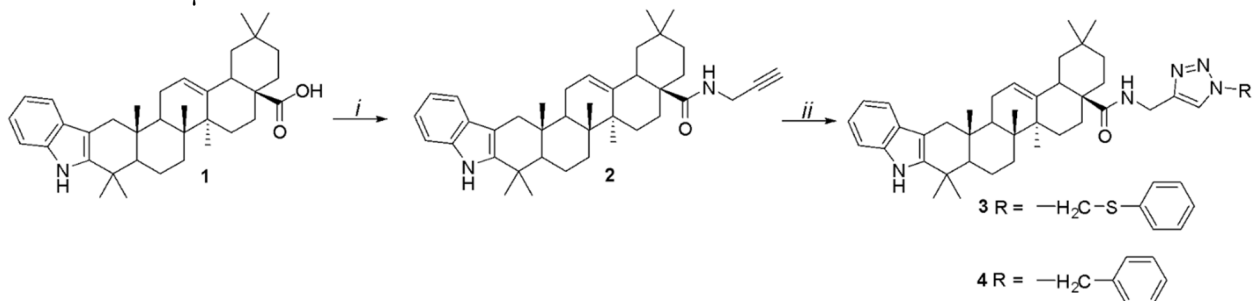
<sup>2</sup>Уфимский Институт химии Российской академии наук, Уфа, Россия

e-mail: [Vaxmetkirieva@bk.ru](mailto:Vaxmetkirieva@bk.ru)

Алкинилтритерпеноиды представляют собой класс биологически активных соединений, обладающих противовоспалительной, противовирусной, антигипергликемической, противоопухолевой активностью. Их модификация путем введения триазольного кольца может улучшить их фармакологические свойства, благодаря увеличению гидрофобности и улучшению фармакокинетического профиля [1].

В данной работе представлен синтез двух новых триазольных производных олеаноловой кислоты. В качестве исходного соединения использовали 2,3-индоло-олеаноловую кислоту **1**, полученную из 3-оксо по реакции Фишера. Реакцией **1** с пропаргиламином через промежуточное образование ацилхлорида, был получен алкиниламид **2** с выходом 86%. Далее, Cu-катализируемым 1,3-диполярным циклоприсоединением полученного алкина **2** с азидометилфенилсульфидом или бензилазидом в присутствии  $\text{CuSO}_4 \cdot 5\text{H}_2\text{O}$  и аскорбата натрия были получены целевые 1,2,3-триазолилпроизводные **3** и **4** с выходом 56-62%. Спектры ЯМР полученных соединений содержали сигналы в области  $\delta$  7 м.д. ( $^1\text{H}$ ),  $\delta$  122 и  $\delta$  128 м.д. ( $^{13}\text{C}$ ), соответствующие атомам водорода или углерода триазольного цикла.

Исследования противовирусной активности полученных триазолов выявило олеанан С28-1,2,3-триазол с бензильным заместителем **4** активным в отношении цитомегаловируса с  $\text{EC}_{50} < 0.05 \mu\text{M}$  и  $\text{SI} > 81$ .



**Реагенты и условия:** (а) 1.  $(\text{COCl})_2$ ,  $\text{Et}_3\text{N}$ ,  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , к.т., 2 ч. 2. Пропаргиламин гидрохлорид,  $\text{Et}_3\text{N}$ ,  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ ,  $40^\circ\text{C}$ , 2 ч; (б) Азидометилфенилсульфид или бензилазид,  $\text{CuSO}_4 \cdot 5\text{H}_2\text{O}$ , аскорбат натрия,  $\text{CH}_2\text{Cl}_2\text{-H}_2\text{O}$ ,  $60^\circ\text{C}$ , 5ч.

### Литература

- Chen J.; Chen Y.; Wang C.; Wang J.; Feng Y.; Tadesse S.; Zhou B.; Zhang Y.; Wu X. Synthesis and biological evaluation of novel ursolic acid derivatives with a 1,2,3-triazole moiety in the treatment of diabetic nephropathy. *Eur. J. Med. Chem.* 2018. Vol. 151. P. 707-717.