**Изучение цитотоксичности N-ацилалкилированных пиразолов**

***Алжаппарова Н.А., Оразбай А.Д., Паньшина С.Ю.***

*Докторант 3 курса образовательной программы 8D05301 «Химия»*

*Карагандинский университет имени Е.А. Букетова,   
химический факультет, Караганда, Казахстан*

*E-mail: nazym285@mail.ru*

В данном исследовании проводили реакции N-ацилалкилирования пиразолов **1а-с** 1-бромпинаколоном **2а** и фенацилбромидами **3a-f** (рис. 1) и изучали их свойства цитотоксичности исследуемых соединений на рачках науплии *Artemia salina* (рис. 1) по общепринятой методике [3].

|  |  |
| --- | --- |
|  |  |

Рис.1. Схема N-ацилалкилирования пиразолов и результаты теста цитотоксичности **4а, 5а-f, 6a, 7a** на *Artemia Salina*

Определено, что наибольшей цитотоксичностью в ряду **4а, 5а-f, 6a, 7a** обладает N-(фенацил)-3,5-дифенилпиразол **7а** (ЛК50 69,76 мкг/мл). В ряду N-фенацилпиразолов **5а, 6а, 7а** цитотоксичность растет в последовательности: N-(фенацил)-3,5-диметилпиразол **6а** (ЛК50 379,00 мкг/мл), незамещенный N-фенацилпиразол **5а** (ЛК50 108,89 мкг/мл), N-(фенацил)-3,5-дифенилпиразол **7а** (ЛК50 69,76 мкг/мл). Данный аспект указывает, что донорные заместители уменьшают значение токсичности, а акцепторные (фенильное кольцо) увеличивают. При сравнении цитотоксичности N-пинаколонпиразола **4а** c N-фенацилпиразолом **5а** показано, что при замене фенацильного заместителя на пиноколоновый цитотоксичность падает почти в 6 раз (с ЛК50 108,89 мкг/мл до 644,00 мкг/мл). В ряду N-фенацилпиразолов **5а-f** цитотоксичность снижается при наличии акцепторной группы в бензольном кольце N-фенацильного заместителя.

*Работа выполнена в рамках грантового проекта ИРН AP19677175 «Разработка нового доступного класса флуоресцентных меток на основе диазапенталенов»*

**Литература**

1. Al-Aizari F.A., Ansar, M.H., Karrouchi K., Mabkhot Y., Ramli Y., Taoufik J. Synthesis and Pharmacological Activities of Pyrazole Derivatives: A Review // Molecules. 2018. Vol. 23. P. 1-86.

2. Ansari A., Ali A., Asif M. Review: biologically active pyrazole derivatives // New Journal of Chemistry. 2017. Vol. 1. P. 16‒41.

3. Suleimenov E.M. Components of Peusedanum morisonii and their antimicrobial and cytotoxic activity. // Chemistry of Natural Compounds. 2009. Vol. P. 45.