

СИНТЕЗ АЗОЛО[5,1-С][1,2,4]ТРИАЗИНОВ В КАЧЕСТВЕ ИНГИБИТОРОВ АДЕНОЗИНОВЫХ А2а-РЕЦЕПТОРОВ

Воинков Е.К.¹, Горбунов Е.Б.², Уломский Е.Н.^{1,2}, Русинов В.Л.^{1,2}

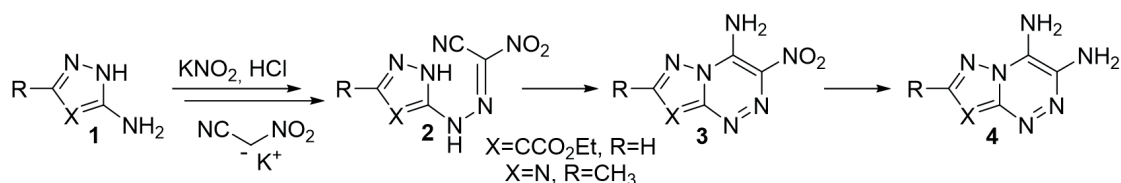
¹Уральский федеральный университет имени первого Президента Б. Н. Ельцина,
620002, Россия, г. Екатеринбург, ул. Мира, 19

²Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского УрО РАН,
620990, Россия, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, 22 / Академическая, 20
E-mail: voinkov-egor@mail.ru

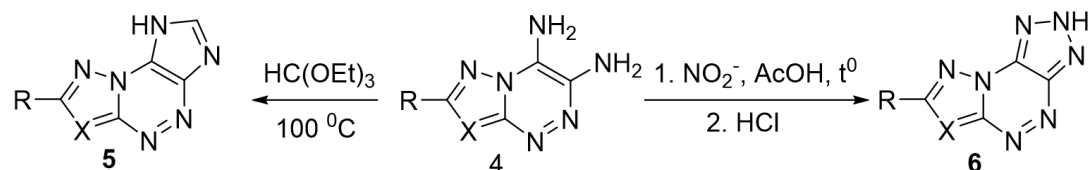
Аденозиновые А2а-рецепторы играют важнейшую роль в регуляции клеточных функций. Нарушение пуриnergической передачи сигнала между клетками приводит к развитию разнообразных нейродегенеративных патологий, в частности связанных с работой аденозиновых А2а-рецепторов: болезнь Паркинсона, болезнь Альцгеймера, а также сепсис.

Структурное сходство разрабатываемых азоло[5,1-с][1,2,4]триазинов с эталонным соединением ZM-241385 позволяет предположить об эффективном ингибировании рецепторов. Квантово-химические расчеты показали ингибирующую активность разрабатываемых азоло[5,1-с][1,2,4]триазинов в отношении аденозиновых А2а-рецепторов.

Синтез азоло[5,1-с][1,2,4]триазинов заключается в диазотировании аминоазолов **1** и азасочетанием диазоазолов с калиевой солью нитроацетонитрила с последующим замыканием азоло[5,1-с][1,2,4]триазиновой системы.



Восстановление нитроаминов **3** приводит к образованию диаминов **4**, циклизацией которых получают трициклические аналоги природных пуринов - имидазо[4,5-е]азоло[5,1-с][1,2,4]триазинов (**5**) и 1,2,3-триазоло[4,5-е]азоло[5,1-с][1,2,4]триазинов (**6**).



Таким образом, были разработаны методы синтеза нитроазоло[5,1-с][1,2,4]триазинов и их производных в качестве перспективных ингибиторов аденозиновых А2а-рецепторов.

Результаты получены в рамках выполнения Государственного задания Минобрнауки России (4.6351.2017/8.9)