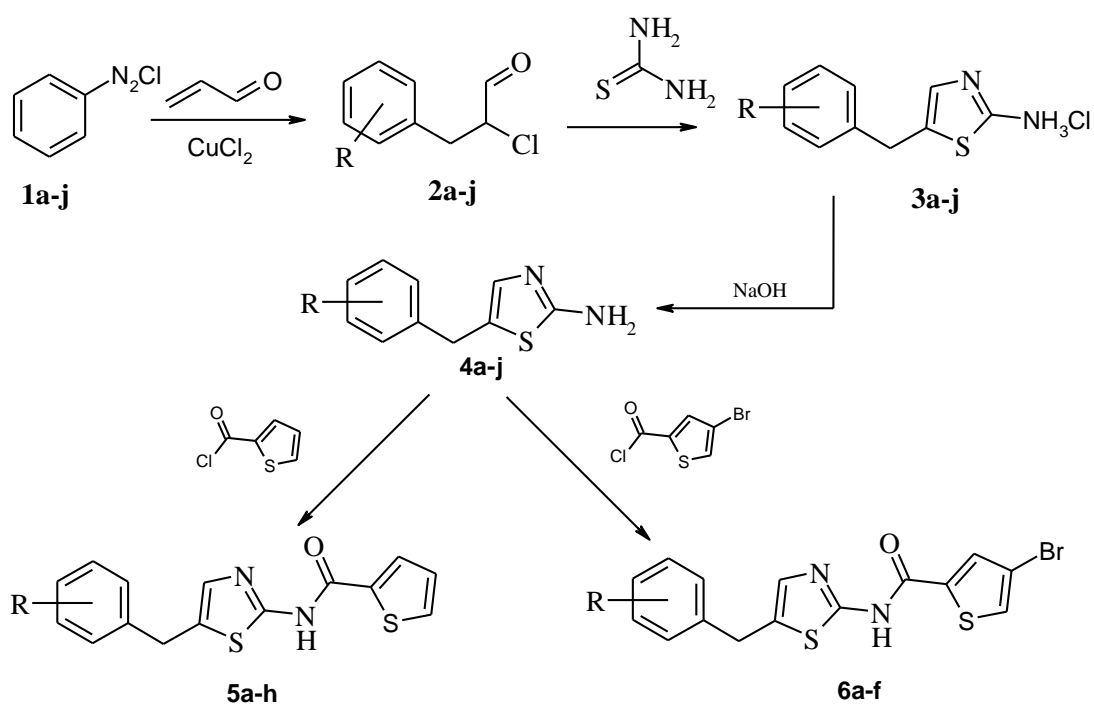


СИНТЕЗ ТА ПРОТИПУХЛИННА АКТИВНІСТЬ *N*-(5-*R*-БЕНЗИЛ-1,3-ТІАЗОЛ-2-ІЛ)ТІОФЕН-2- ТА *N*-(5-*R*-БЕНЗИЛ-1,3-ТІАЗОЛ-2-ІЛ)-4-БРОМОТІОФЕН-2-КАРБОКСАМІДІВ

Фролов Д. А., Матійчук В. С.

Львівський національний університет імені Івана Франка
dimaf@i.ua

Досліджено протипухлинну активність похідних *N*-(5-*R*-бензил-1,3-тіазол-2-іл)тіофен-2-карбоксамідів **5a–h** та *N*-(5-*R*-бензил-1,3-тіазол-2-іл)-4-бромотіофен-2-карбоксамідів **6a–f**. Вихідними речовинами для їх синтезу слугували 5-(*R*-бензил)-1,3-тіазол-2-аміни **4a–j**. Їх синтезували взаємодією 3-арил-2-хлоропропаналів **2a–j** з тіосечовиною. 3-Арил-2-хлоропропаналі в свою чергу отримано арилюванням акролеїну арендіазонієвими солями. Ацилювання 5-(*R*-бензил)-1,3-тіазол-2-амінів здійснювали класичним методом за допомогою хлорангідридів тіофен-2- та 4-бромотіофен-2-карбонових кислот.



1-4 a-g 3-CH₃(a), 4-CH₃(b), 4-(CH₃)₂CH(c), 2-F(d), 4-F(e), 2-Cl(f), 3-Cl(g), 2,4-Cl₂(h), 2,5-Cl₂(i)
2-Cl,5-CF₃(j)

5 a-h R = 3-CH₃(a), 2-F(b), 4-F(c), 2-Cl(d), 3-Cl(e), 2,4-Cl₂(f), 2,5-Cl₂(g), 2-Cl,5-CF₃(h)

6 a-f R = 4-CH₃(a), 4-(CH₃)₂CH(b), 3-Cl(c), 2,4-Cl₂(d), 3,4-Cl₂(e), 2-Cl,5-CF₃(f)

Протиракову активність синтезованих сполук вивчали методом вискоєфективного біологічного скринінгу згідно міжнародної наукової програми Національного інституту здоров'я США – DTP (Developmental Therapeutic Program) Національного інституту раку (Бетезда, Меріленд, США).

За результатами досліджень протиракової активності ідентифіковано сполуку-лідер – *N*-[5-(2,4-дихлоробензил)-1,3-тіазол-2-іл]тіофен-2-карбоксамід **5f**. Встановлено, що він є вискоєфективним щодо лінії меланоми MDA-MB-435: GP = -29.41 % та лінії лейкемії SR: GP = -5.59. Варті уваги й інші результати прескринінгу **5f**: MDA-MB-468 (рак молочної залози) GP = 4.08 %; K-562 (лейкемія): GP = 10.18 %; HT29 (рак товстої кишки): GP = 12.26 %.