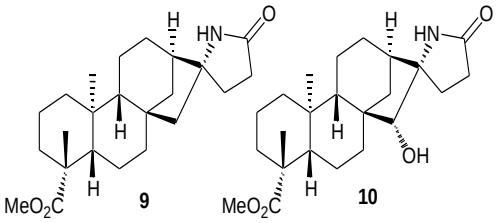
а 2020 0026

Изобретение относится к производным соединениям из природных продуктов, которые содержат дополнительную спиро-γ-лактамную функциональную группу в дитерпеновом углеродном скелете *энт*-кауреновой кислоты (1) – компонент экстракта из отходов подсолнечника (*Helianthus annuus*).
Изобретение относится к новым производным природных *энт*-каурановых продуктов, которые содержат спиро-сочленённый лактамный фрагмент, обладают селективными цитотоксическими свойствами по отношению к некоторым линиям раковых клеток человека и могут быть использованы в качестве химиотерапевтических агентов для лечения онкологических заболеваний.
Структуры заявленых соединений включают углеродный скелет *энт*-каурана, функционализированый селективно в цикле D спиро-γ-лактамным фрагментом (9) или комбинацией спиро-γ-лактамной и свободной гидроксильной группой (10):



Цитотоксическая активность этих соединений подтверждается при микромолярных и более низких концентрациях ингибированием размножения не менее 50% клеток линий Capan-1 (панкреатическая аденокарцинома), Hap-1 (хроническая миелоидная лейкемия), HCT-116 (колоректальный карцином), NCI-H460 (карцином лёгких), DND-41 (острая лимфобластная лейкемия). Селективное действие предложенных соединений подтверждается высокими значениями индекса селективности, данного как соотношение IC_{50} для нормальных клеток/IC_{50} для соответствующих раковых клеток.

П. формулы: 3
Фиг.: 7