

УДК 547.789.1:547.785.5:547.279.1

СИНТЕЗ 3-АРИЛ-5-R- СУЛЬФАНІЛ[1,3]ТІАЗОЛО[4',5':4,5]-ПІРИМІДО[1,6-А]БЕНЗІМІДАЗОЛ-2(3Н)-ТІОНІВ З МЕТОЮ ПОШУКУ НОВИХ ФУНГІЦИДНИХ ПРЕПАРАТІВ

О.О.Пархоменко, С.М.Коваленко, В.П.Черних

Національна фармацевтична академія України

Як відомо, похідні піримідинотіазолу проявили себе як речовини, які несуть у собі великий фармакологічний потенціал. Відомо про їх протизапальну, антимікробну, антибластомну, противірусну активність. Особливо багато повідомлень про те, що похідні цієї групи виявляють фунгіцидну активність. З метою пошуку речовин саме з такою активністю нами було синтезовано нову групу гетероциклічних структур, які містять в собі фрагмент піримідинотіазолу, а саме 3-арил-5-R-сульфаніл[1,3]тіазоло[4',5':4,5]піримідо[1,6-а]бензімідазол-2(3Н)-тіонів.

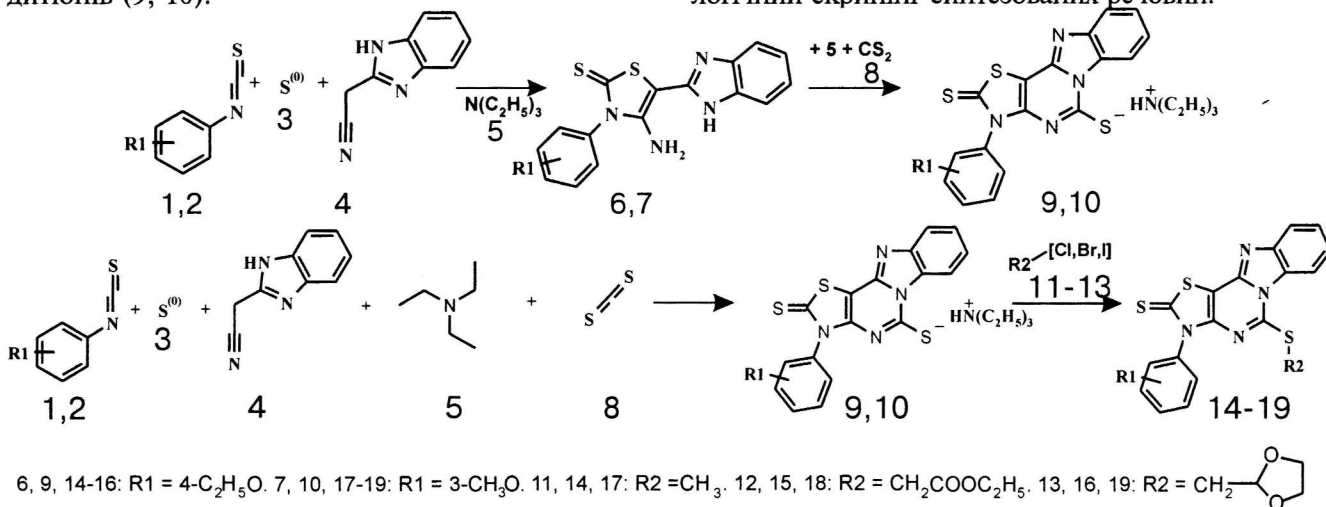
Конденсацією відповідних ізотіоціанатів з сіркою та 2-ціанометилбензімідазолом в середовищі диметилформаміду в присутності триетиламіну (за Гевальдом) був отриманий ряд 4-аміно-5-(1Н-бензімідазол-2-іл)-3-арил-1,3-тіазол-2(3Н)-тіонів (6, 7). Нагрівання отриманих сполук в середовищі сірковуглецю з триетиламіном приводило до отримання триетиламонієвої солі 3-арил-[1,3]тіазоло[4',5':4,5]піримідо[1,6-а]бензімідазол-2,5(3Н,4Н)-дитіонів (9, 10).

Ці сполуки були також з успіхом виділені з реакційного середовища при проведенні п'ятикомпонентної конденсації відповідних ізотіоціанатів 1, 2, 2-ціанометилбензімідазолу 4, сірки 3, сірковуглецю 8 та триетиламіну 5.

Сполуки 6, 7, в свою чергу, при взаємодії з алкілгалогенідами в середовищі диметилформаміду давали S-заміщені продукти (3-арил-5-R-сульфаніл[1,3]тіазоло[4',5':4,5]піримідо[1,6-а]бензімідазол-2(3Н)-тіони 14-19).

Структури вищенаведених сполук доведені за допомогою ^1H ЯМР-, ІЧ- та УФ- спектроскопій.

Таким чином, знайдена нова реакція п'ятикомпонентної конденсації відповідних ізотіоціанатів, сірки, 2-ціанометилбензімідазолу, триетиламіну та сірковуглецю, яка приводить до 3-арил-[1,3]тіазоло[4',5':4,5]піримідо[1,6-а]бензімідазол-2(3Н)-тіон-5-тіолатів триетиламонію. Алкілуванням цих сполук алкілгалогенідами синтезовано ряд нових гетероциклічних структур, які містять у собі потенціал фунгіцидної активності. Проводиться біологічний скринінг синтезованих речовин.



ЛІТЕРАТУРА

1. El-Bendary, E. R.; El-Sherbeny, M. A.; Badria, F. A. // *Boll. Chim. Farm.* — 1998. — Vol. 137. — P. 115-119.
2. Habib, N. S.; Rida, S. M.; Badawey, E.A. M.; Fahmy, H. T. Y. // *Monatsh. Chem.* — 1996. — Vol. 127. — P. 1209-1214.
3. El-Sherbeny, M. A., Badria, F. A.; Kheira, S. // *Med. Chem. Res.* — 1996. — №6. — P. 28-39.
4. Devani, M. B., Shishoo, C. J., Pathak, U. S., Parikh, S. H. et al. // *Arzneim. Forsch.* — 1977. — Vol. 27. — P. 1652-1655.
5. Von Karl Gewald V. K. // *Journal fuer praktische Chemie.* — 1966. — №32. — S. 26-30.