

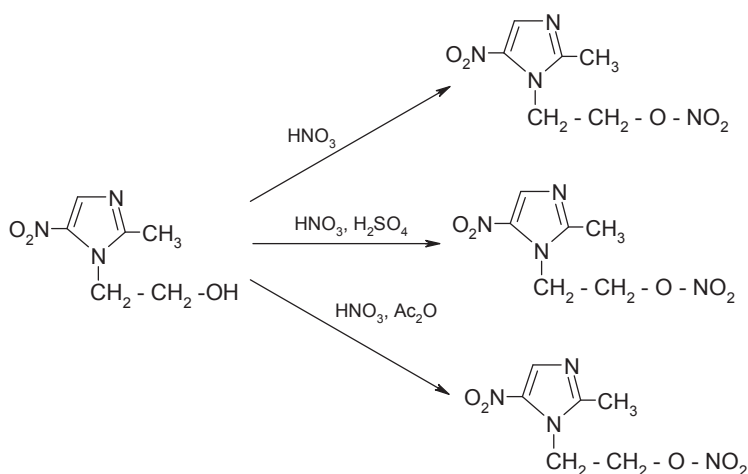
О.А. Нагорнова, асп.; Л.Ф. Нуруллина, асп.;
 З.Г. Ахтямова, доц., канд. хим. наук;
 Р.З. Гильманов, проф., д-р хим. наук (КНИТУ, г. Казань)

СИНТЕЗ НОВЫХ НИТРОПРОИЗВОДНЫХ ИМИДАЗОЛА

Химики, занимающиеся поиском новых лекарственных веществ, скептически относились к наличию нитрогруппы в потенциальных лекарственных средствах. В 1948 году было обнаружено, что антибактериальный хлорамфеникол имеет нитрофенильную связь. С тех пор были найдены и использованы другие нитрогетероциклы.

С целью поиска новых биологически активных производных нитроимидазолов на основе метронидазола на кафедре ХТОСА КНИТУ нами синтезирован N-нитрооксиэтил-2-метил-5-нитроимидазол.

Синтеза данной структуры добивались путем нитрования боковой цепи N-оксиэтил-2-метил-5-нитроимидазола в одну стадию. Для проявления оптимальных условий, в качестве нитрующих агентов использовали азотную кислоту, серно-азотную кислотную смесь и азотную кислоту в среде уксусного ангидрида. Реакции протекали по следующим схемам:



Продукт хорошо выпадает при нейтрализации реакционной массы с аммиачной водой. Получаем продукт белого цвета с зеленоватым оттенком, с температурой плавления 60–62 °С, хорошо растворимых в ацетоне, спиртах, умеренно в воде. Наибольший выход наблюдается при нитровании метронидазола с серно-азотной кислотой смесью.

Первые исследования на бактериостатическую активность показали, что нами полученный продукт проявляет активность в концентрации 0,0625 %.