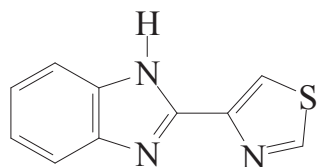


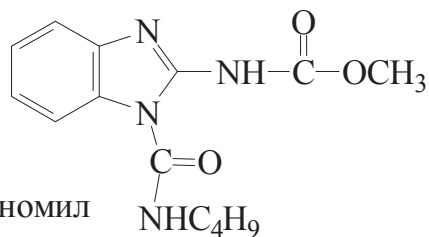
СИНТЕЗ ПРОИЗВОДНЫХ БЕНЗИМИДАЗОЛА НА ОСНОВЕ О-ФЕНИЛЕНДИАМИНА И АРОМАТИЧЕСКИХ АЛЬДЕГИДОВ

Бензимидазол и его производные по литературным данным обладают различными видами фармакологической активности: противовирусная, противоопухолевая, противомикробная, а также известны соединения, которые проявляют антиВИЧ-действие [1, 2].

Впервые исследованием производных бензимидазола заинтересовались в 1960 году, и на его основе было изготовлено фунгицидное средство под названием «Тиабендазол», через 8 лет американская фирма «Дюпон» разработала препарат «Беномил» – фунгицид широкого спектра действия, для борьбы с различными грибковыми инфекциями.

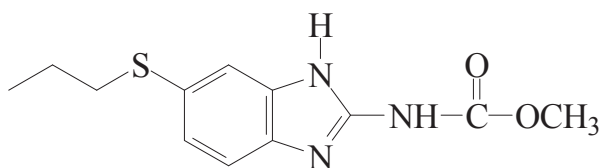


Тиабендазол

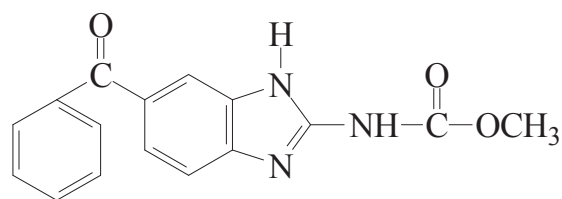


Беномил

Дальнейшие исследования подтвердили, что бензимидазолы имеют выраженный противогельминтный эффект: препараты на основе альбендазола (Вормил, Зентел, Немозол) и на основе мебендазола (Вермакар, Вермокс, Вормин).



Альбендазол



Мебендазол

Действие бензимидазолов основано на том, что они нарушают процесс утилизации питательных веществ в теле паразита или грибка. Вследствие этого с течением времени микроорганизм погибает.

Целью данной работы было осуществить синтез производных бензимидазола, содержащих различные заместители, связанные с имидазольным циклом и изучить реакционную способность субстратов, содержащих электронодонорные, электроноакцепторные заместители и ароматический конденсированный цикл.

Взаимодействие *o*-фенилендиамина и ряда ароматических альдегидов: салициловый альдегид (схема 1), ванилин (схема 2), 3-нитробензальдегид (схема 3) и 2-гидроксинафтойный альдегид (схема 4) проводили при нагревании в диметилформамиде и в присутствии каталитического количества метабисульфита натрия в течении 8 часов [3]. В результате реакции были получены соединения 1-4. В ходе экспериментальных исследований было установлено, что на выход целевых продуктов влияет как электронный фактор (соединение 3), так и пространственный (соединение 4).

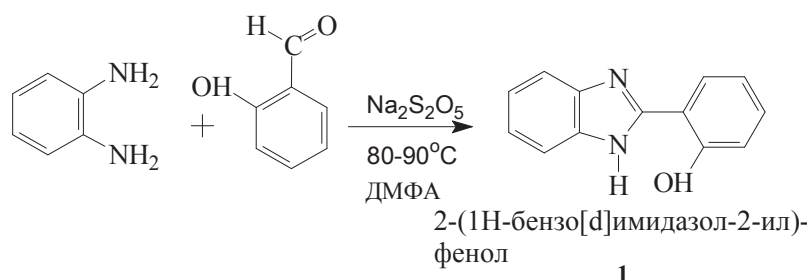


Схема 1

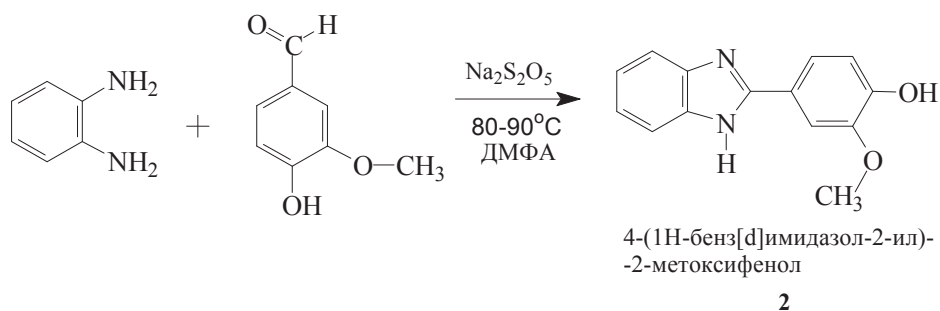


Схема 2

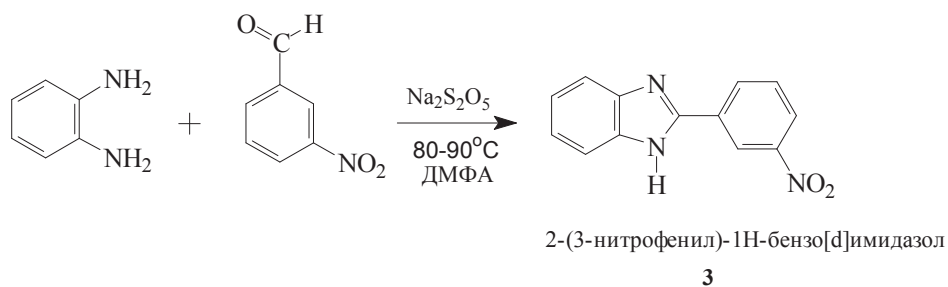


Схема 3

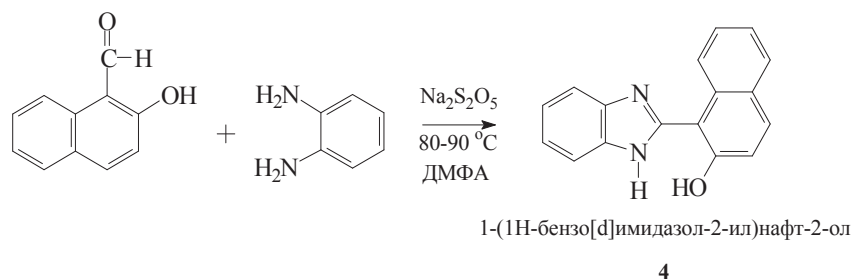


Схема 4

Структура синтезированных соединений доказана современными физико-химическими методами анализа: ИК и ЯМР спектрами. Выходы и температуры плавления представлены в таблице.

Таблица

Субстраты	Название продуктов реакции	Выход, %	T _{пл} , °C
Салициловый альдегид	2-(1H-бензо[d]имидазол-2-ил)фенол (1)	70	240-242,0
Ванилин	4-(1H-бензо[d]имидазол-2-ил)2-метоксифенол (2)	90	213,0-215,2
3-Нитробензальдегид	2-(3-нитрофенил)-1H-бензо[d]имидазол	50	137-138
2-Гидрокси-нафталальдегид	1-(1H-бензо[d]имидазол-2-ил)нафт-2-ол (3)	50	145,0-147,0

Полученные производные бензимидазола 1-4 представляют интерес как возможные потенциальные биологические вещества и с другой стороны могут быть модифицированы с целью получения новых соединений на их основе.

ЛИТЕРАТУРА

1. Чупахин, О. Н.; Чарушин, В. Н.; Русинов, В. Л.; Уломский, Е. Н.; Котовская, С. К.; Киселев, О. И.; Деева, Э. Г.; Саватеев, К. В.; Борисов, С. С. Патент РФ 2529487, 2014.
2. Rohini R., Shanker K., Reddy P.M., Ravinder V. Synthesis and Antimicrobial Activities of a New Class of 6-Arylbenzimidazo[1,2-c]quinazolines // J. Braz. Chem. Soc. 2010. V. 21. P. 49-57.
3. Han X., Ma H., Wang Y. Простой и эффективный метод синтеза 2-арилзамещенных бензимидазолов // ЖОрХ. 2008. Т. 44. Вып. 6. С. 872-874.