

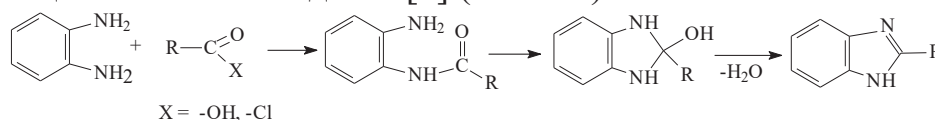
ФУБЕРИДАЗОЛ: СИНТЕЗ И ПРИМЕНЕНИЕ

Среди многообразия гетероциклических соединений, исследования которых развиваются и находят широкое практическое применение, важное место занимает бензимидазол и его производные. Органические соединения, содержащие в своей основе бензимидазольный цикл, известны в настоящее время в качестве лекарственных препаратов, красителей, фунгицидов.

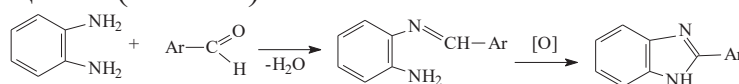
Исследования по фунгицидной активности замещенных бензимидазола позволили получить на их основе препараты для борьбы с различными грибковыми инфекциями растений: «Тиабендазол», «Беномил», «Фуберидазол» и др.

Целью настоящей работы было осуществить синтез 2-фурилзамещенного бензимидазола (фуберидазол) и изучить его физико-химические характеристики.

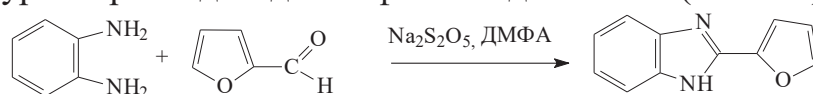
2-Замещенные бензимидазолы можно получить реакцией *o*-фенилендиамина с карбоновыми кислотами или галогенангидридами кислот. В ходе данной реакции на первой стадии образуются *N*-ацилпроизводные *o*-фенилендиамина. Затем внутримолекулярный аминолиз карбонильного соединения сопровождается образованием циклического дигидробензимидазола, который подвергаясь дегидратации переходит в целевой бензимидазол [1] (схема 1):

**Схема 1**

Взаимодействие *o*-фенилендиамина можно осуществить также с ароматическими или алифатическими альдегидами [2]. Реакция идет через образование промежуточного основания Шиффа с последующим замыканием цикла (схема 2).

**Схема 2**

Синтез 2-фурилбензимидазола проводили реакцией взаимодействия 2-фуранкарбальдегида с *o*-фенилендиамином (схема 3).

**Схема 3**

Повышенная электронная плотность фуранового цикла (π -избыток электронов) уменьшает реакционную способность карбонильного атома углерода в субстрате за счет отрицательного мезомерного эффекта карбонила. Применение кислотного катализа позволило бы активировать реакционный центр. Однако, известно, что фурановый и пиррольный циклы присоединяют электрофил (протон) по α -углеродному атому гетероцикла и стабилизируют промежуточный аддукт образованием диеновой структуры. Диены легко полимеризуются, что и приводит к образованию смолоподобных продуктов. С другой стороны, 2-фуранкарбальдегид легко окисляется и при действии повышенных температур, что необходимо для протекания реакции, с образованием реакционной массы темного цвета.

С учетом этого, реакцию проводили, контролируя температуру реакционной смеси нагреванием до 70°C . Для увеличения выхода продукта время реакции увеличили до 8ч. Реакцию окислительного циклодегидрирования полученного промежуточного основания Шиффа активировали применением катализатора метабисульфита натрия. Контроль за ходом реакции осуществляли методом аналитической тонкослойной хроматографии (ТСХ).

Очистка достигалась с помощью дробной перекристаллизации из этанола с последующим высаждением кристаллов водой. В результате 2-фурилбензимидазол был получен с выходом 82%. $T_{\text{пл}} 278\text{--}280^{\circ}\text{C}$.

Индивидуальность синтезированного соединения подтверждена данными ИК спектра: полоса поглощения $\text{C}=\text{N}$ связи имидазольного цикла проявляется при 1632 см^{-1} . Валентные колебания связи $\text{N}-\text{H}$ находятся в области 3439 см^{-1} .

Таким образом, полученный 2-(фуран-2-ил)-1*H*-бензо [*d*] имидазол представляет интерес как фунгицид, который применяется в качестве протравителя семян злаков против фузариоза проса, снежной плесени ржи. Модификацией молекулы можно получить и другие аналоги фунгицидов.

ЛИТЕРАТУРА

1. Grimmett, M. R. Best synthetic methods. Imidazole and Benzimidazole. Synthesis / M.R. Grimmett // San Diego: Academic Press Inc. 1997. – P. 265.
2. James, G.S. Organic redox reactions during the interaction of *o*-phenylenediamine with benzaldehyde / G.S. James, H. Isaac // Tetrahedron Letters. – 1971. – Vol. 12, № 38. – P. 351–3544.