

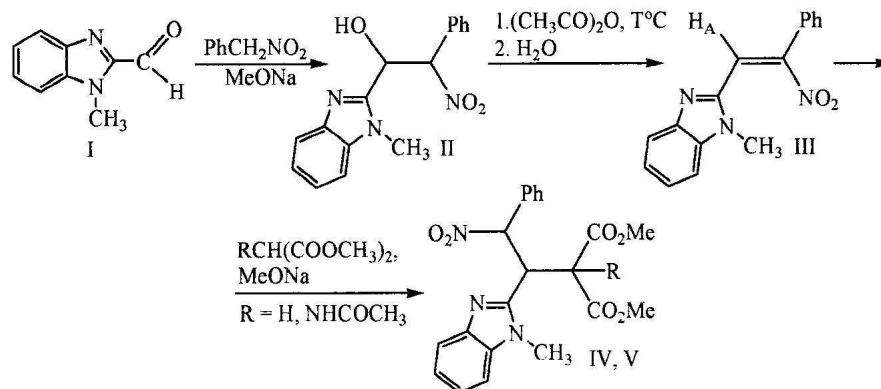
СИНТЕЗ И СТРОЕНИЕ БЕНЗИМИДАЗОЛСОДЕРЖАЩЕГО НИТРОСТИРОЛА

Острогладов Е. С., Никоноров А. А., Васильева О. С., Берестовицкая В. М.

Российский государственный педагогический университет имени А.И.Герцена,
191186, Санкт-Петербург, наб. р. Мойки, д. 48; e-mail: kohrgpu@yandex.ru

Бензимидазольный цикл, как фармакофорная группа, является составной частью молекул многих природных соединений и лекарственных веществ, широко используемых в медицине (дибазол, бендамустин) [1,2] и ветеринарии (мебендазол, фенбендазол) [3]. Перспективными реагентами, способными внедрять в молекулы органических веществ этот гетероцикл, являются бензимидазолсодержащие нитроалкены.

Нами осуществлён двухстадийный синтез 2-(1-метилбензимидазол-2-ил)-1-нитро-1-фенилэтена (III), включающий конденсацию альдегида (I) с фенилнитрометаном и последующую дегидратацию нитро-спирта (II).



Целевой продукт (III) получен с высоким выходом (83 %) и имеет температуру плавления (210–212 °С), не соответствующую приписываемой в работе [4] структуре (III), строение которой авторами не подтверждено.

Вещество (III) легко (в присутствии основного катализатора) присоединяет малоновый и ацетиламино малоновый эфиры, образуя продукты Михаэля с выходами до 60 %.

Строение соединений (III–V) надёжно доказано спектральными методами. Так, спектр ЯМР¹H нитроалкена (III) содержит сигналы протонов бензимидазольного, бензольного колец, а также олефинового (H_A) протона (7.25 м.д.). Сильнопольное проявление последнего по сравнению с таковым в модельном 2-(1-метилбензимидазол-2-ил)-1-нитроэтене (8.15 м.д.) [5] указывает на Z-конфигурацию нитроалкена (III). Этот вывод подтверждают и данные УФ спектра, в котором наблюдается гипсохромное смещение длинноволнового максимума по сравнению со спектром модельного нитроэтена.

Вещества (IV, V) можно рассматривать в качестве первых нитропредшественников γ-аминоасляных кислот, содержащих в молекуле одновременно бензимидазольный и арильный заместители.

[1] Машковский М.Д. Лекарственные средства. М.: «Новая Волна», 2007. 15-е изд., 1206 с.

[2] Регистр лекарственных средств России. Энциклопедия лекарств. ООО «РЛС. 2002». Вып. 9.

[3] Кузьмин А.А. Антигельминтики в ветеринарной медицине. М.: «Аквариум ЛТД», 2000. 144с.

[4] Долгатов Д. Д., Симонов А. М. ЖОХ. 1964. 34. 3052.

[5] Берестовицкая В. М., Ишмаева Э. А., Лятовин И. А., Васильева О. С., Верещагина Я. А., Острогладов Е. С., Фаттахова Г. Р., Бескровный Д. В., Александрова С. М. ЖОХ. 2004. 74. 1198.

SYNTHESIS AND STRUCTURE OF BENZIMIDAZOLE CONTAINING NITROSTYRENE

Ostrogladov E. S., Nikonorov A. A., Berestovitskaya V. M., Vasilieva O. S.

Russian Herzen State Pedagogical University,
Russia, 191186, Saint-Petersburg, Moika emb, 48, e-mail: kohrgpu@yandex.ru