

СИНТЕЗ 2-АМІНОАЛКІЛІМІДАЗОЛІВ. МОДИФІКАЦІЯ МЕТОДИК

Журавель І. О.¹, Завада О. О.²¹Харківська медична академія післядипломної освіти, Україна, Харків²Харківський національний медичний університет, Україна, Харків

Природні та синтетичні похідні імідазолу – добре відомий клас біологічно активних сполук, які знайшли застосування в фармації та медичній практиці.

Цілком логічно, на наш погляд, розглянути можливість розширення синтетичних меж відомих методів синтезу біологічно активних похідних імідазолу, а саме синтез 2-аміноалкілімідазолів.

Нами здійснено синтез 2-аміноалкілімідазолів двома способами на основі відомих методик, які в ході роботи було модифіковано та удосконалено.

Перший з них полягає в постадійному перетворенні N1-заміщеного імідазолу за реакціями гідроксиметилування та заміщення гідроксильної групи на 2-хлорометилпохідне, на основі якого далі одержували 2-амінометилімідазол (обробкою амоніаком) та 2-аміноетилімідазол (взаємодією з натрій ціанідом з наступним відновленням).

Більші препаративні можливості побудови 2-(N-заміщених амінометил)імідазолів надає метод з використанням імідазол-2-карбальдегіду 5, який одержували за реакцією димеризації імідазолу 1 карбенним методом. Реакція перебігає через стадію утворення N1-бензоїл-2-(1,3-добензоїл-4-імідазолін-2-іл)імідазолу 2, який переводили у гідрохлорид 3 та відновлювали. Кип'ятінням сполуки 4 в розчині HCl здійснювали руйнування імідазолідинового циклу та дебензоїлювання за положенням 1 імідазолу. Далі в реакції відновного амінування 2-формілпохідного 5 алкіламінами з високими виходами отримували цільові 2-(N-заміщені амінометил)імідазоли 7{1-3} (Схема 1).

Схема 1

