

Синтез и биологическая активность сульфамидных производных 4-(5-амино-1-метил-1*H*-бензо[*d*]имидазол-2-ил)-*N*-пропилбензамида

© Власова*⁺ Юлия Николаевна, Бойкова Ольга Ивановна,
Мухторов Лоик Гургович и Атрощенко Юрий Михайлович

Кафедра химии. Тульский государственный педагогический университет им. Л.Н. Толстого.
пр. Ленина, 125. г. Тула, 300026. Тульская область, Россия. Тел.: 89207446264.

E-mail: reaktiv@tspu.tula.ru

*Ведущий направление; ⁺Поддерживающий переписку

Ключевые слова: сульфамидные производные бензимидазола, ЯМР спектроскопия, бактериостатическая активность, фунгицидная активность, хроническая и острая токсичность.

Аннотация

Соединения, содержащие бензимидазольный фрагмент известны широким спектром проявляемой ими биологической активности. А также характеризуется высокой терапевтической эффективностью и фармакологической устойчивостью при сравнительно низкой токсичности. В ходе шестистадийного процесса были получены сульфамиды на основе 4-(5-амино-1-метил-1*H*-бензо[*d*]имидазол-2-ил)-*N*-пропилбензамида. В качестве исходного соединения был взят *N*'-метил-1,2-диамино-4-нитробензол, который подвергался ацилированию, затем конденсации в среде разбавленной соляной кислоты. Амидирование проводилось в присутствии карбдиимидазола (КДИ) при нагревании. Одна из нитрогрупп восстанавливалась селективно водородом на последней стадии. Строение целевых продуктов установлено посредством ЯМР-спектроскопии. Методом серийных разведений изучена бактериостатическая активность на культурах *Escherichia coli* и *Staphylococcus aureus* и фунгицидная активность на грибах рода *Candida*. Для выявления действующей концентрации полученные вещества были взяты в интервале от 50 мг/мл до 1.56 мг/мл. Исследования показали, что часть соединений замедляет рост микроорганизмов, а некоторые полностью его подавляют. Причем концентрации сопоставимы с известными препаратами, таким как ампициллин. За действующую концентрацию было принято содержание вещества 12.5 мг/мл. Исследования на установление острой и хронической токсичности были проведены на инфузориях вида *Tetrahymena pyriformis*, которые обладают изменчивостью и большим набором хромосом, что позволяет выявить за короткий промежуток времени токсическое действие. Полученные соединения вводились в действующей антибактериальной дозе. По истечении 3 часов (острая токсичность) и 48 часов (хроническая токсичность) отклонений в жизнедеятельности организмов обнаружено не было. Что позволяет заключить о нетоксичности исследуемых сульфохлоридов.