

Синтез и исследование антимикотической активности 1,1-бис(азол-1-ил)метаниминов

© Глотов⁺ Александр Андреевич, Зарубин Юрий Павлович, Пурыгин* Пётр Петрович

Кафедра неорганической химии. Самарский национальный исследовательский университет
имени академика С.П. Королева. ул. Московское шоссе, 34. г. Самара, 443086.
Самарская область. Россия. Тел.: +7 (927) 264-78-38. E-mail: morgen97@mail.ru

*Ведущий направление; ⁺Поддерживающий переписку

Ключевые слова: 1,1-бис(азол-1-ил)метанимины, имидазол, производные, симметричные, несимметричные, антимикотическая активность.

Аннотация

Для поиска новых соединений, имеющих перспективу в качестве антимикотических средств был синтезирован ряд симметричных и несимметричных 1,1-бис(азол-1-ил)метаниминов – производных 2-метилимидазола и 4(5)-метилимидазола. Синтез симметричных метаниминов осуществлялся одностадийно на основе двухступенчатого взаимодействия исходных азолов с бромцианом в среде апротонного растворителя (абсолютный бензол) при нагреве до температуры кипения растворителя. Синтез несимметричного метанимина происходил в два этапа: на первом этапе осуществлён синтез 4-метил-1-циан-1*H*-имидазола с последующим выделением этого вещества. Выход 78%. На втором этапе в раствор 2-метилимидазола в эквимольном количестве добавлялся 4-метил-1-циан-1*H*-имидазол. Выход несимметричного метанимина составил 73%. Структура синтезированных 1,1-бис(азол-1-ил)метаниминов подтверждена инфракрасной спектроскопией и ЯМР ¹H спектроскопией. Индивидуальность соединений подтверждена методом тонкослойной хроматографии. Проведено исследование антимикотической активности симметричных 1,1-бис(азолил-1)метаниминов диско-диффузионным методом. Предварительно с помощью программы PASS online были спрогнозированы спектры возможной биологической активности 1,1-бис(азолил-1)метаниминов и на их основе была выдвинута теория о противогрибковом эффекте, которая подтверждена экспериментально. Для этого из почвы был выделен и определён плесневый грибок вида *Aspergillus flavus*. Данный вид является одним из распространённых и повсеместно присутствующих в окружающей среде видов плесневого грибка. Также был использован штамм плесневого грибка *Penicillium adametzioides*. В качестве растворителя был использован диметилсульфоксид, который широко используется в фармацевтике и в биологии и не продемонстрировал своего влияния на рост плесневых грибов. Антимикотическая активность соединений сравнивалась с противогрибковым средством Клотримазолом. В результате исследования было установлено, что в эксперименте с производным 4(5)-метилимидазола средние диаметры зон лизиса на 11.4% превысили показатели Клотримазола.

Выходные данные для цитирования русскоязычной версии статьи:

Глотов А.А., Зарубин Ю.П., Пурыгин П.П. Синтез и исследование антимикотической активности 1,1-бис(азол-1-ил)метаниминов. *Бутлеровские сообщения*. 2022. Т.70. №5. С.128-133. DOI: 10.37952/ROI-jbc-01/22-70-5-128.

или

Alexander A. Glotov, Yury P. Zarubin, Pyotr P. Purygin. Synthesis and study of the antimycotic activity of 1,1-bis(azol-1-yl)methanimines. *Butlerov Communications*. 2022. Vol.70. No.5. P.128-133. DOI: 10.37952/ROI-jbc-01/22-70-5-128. (Russian)