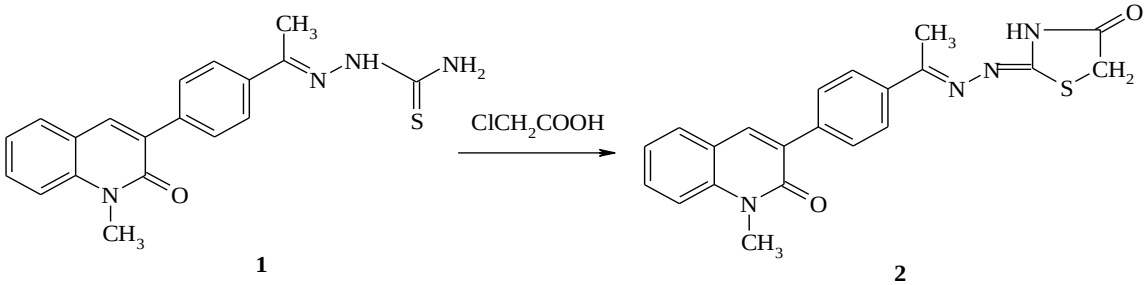
СИНТЕЗ ГЕТЕРОЦИКЛІЧНИХ ПОХІДНИХ НА ОСНОВІ ТІОСЕМІКАРБАЗОНУ 3-(4-АЦЕТИЛФЕНІЛ)-1-МЕТИЛ-2(1*H*)-ХІНОЛОНУ

Руснак О. В., Булига О. І., Скрипська О. В., Ягодинець П. І.
Чернівецький національний університет імені Юрія Федьковича
olha_skrypska@mail.ru

Останнім часом увагу дослідників привертають бігетероциклічні системи, що містять хінолоновий та тіазольний цикли. Такі сполуки виявляють виражену бактерицидну активність. Фрагмент 2-хінолону входить до складу багатьох алкалоїдів і біологічно активних сполук.

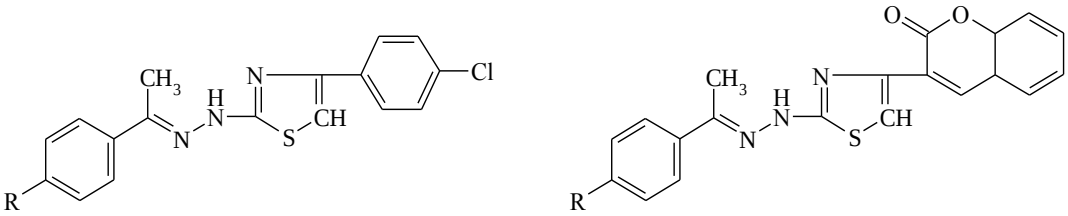
Привабливим об’єктом для хімічних досліджень є 3-феніл-2-хінолон, який містить у четвертому положенні фенільного радикала ацетильну групу. Він є перспективним реагентом для органічного синтезу, так як наявність ацетильної групи дає можливість її функціоналізації з метою одержання різних гетероциклічних похідних як потенційних біологічно активних речовин.

Завданням даної роботи було проведення досліджень щодо синтезу нових похідних тіазолу на основі 3-(4-ацетилфеніл)-1-метил-2(1*H*)-хінолону. Синтез якого здійснено реакцією арилювання 1-метилхінолін-2(1*H*)-ону діазотованим 4-аміно-ацетофеноном в умовах купрокаталізу. Взаємодією вихідної сполуки з тіосемікарбазидом в оцтовій кислоті синтезовано тіосемікарбазон **1**, який використано в циклоконденсації з монохлороцтовою кислотою. Реакція протікає при нагріванні реагентів в ацетонітрилі з утворенням сполуки **2**, яка містить тіазолідиноновий цикл.



1 **2**

Нами показана можливість формування тіазольного циклу на основі трикомпонентних реакцій. Для одержання похідних тіазолу використана реакція 3-(4-ацетилфеніл)-1-метилхінолін-2(1*H*)-ону з тіосемікарбазидом і 4-хлорофенацил-бромідом (або 3-(2-бромоацетил)кумарином), яка протікає за наявності ацетатної кислоти у етиловому спирті з утворенням 2,4-дизаміщених тіазолів **3, 4**.



3 **4**

де R = 1-метил-2-хінолон-3-іл.

Індивідуальність одержаних сполук підтверджено методом тонкошарової хроматографії, склад – результатами кількісного елементного аналізу, а будова – даними вимірів ІЧ та ЯМР ^{1}Н спектрів.

Дослідження антимікробної та фунгіцидної дії на штамах бактерій *S.typhimurium* 4414, *P.mirabilis* 410, *S.aureus* ATCC 25923, *P.aeruginosa* ATCC 27853, *B.subtilis* ATCC 6633, *C.albicans* та *S.cerevisiae* 61 показали, що деякі із синтезованих речовин виявляють помірну активність.