ИЗУЧЕНИЕ АНТИАГРЕГАНТНОГО ДЕЙСТВИЯ НОВОГО КЛАССА ПРОИЗВОДНЫХ БЕНЗИМИДАЗОЛА, ИМЕЮЩИХ В СВОЕЙ СТРУКТУРЕ ПРОСТРАНСТВЕННО ЗАТРУДНЕННЫЙ ФЕНОЛЬНЫЙ ЗАМЕСТИТЕЛЬ

А.А. Спасов¹, А.Ф. Кучерявенко¹, К.А. Гайдукова¹, О.Н. Жуковская²

¹Волгоградский Государственный Медицинский Университет Минздрава РФ, 400131, Россия, г. Волгоград, пл. Павших Борцов, 1.

²Научно-исследовательский институт физической и органической химии
ФГАОУ ВО «Южный федеральный университет»;
Россия, 344090 Ростов-на-Дону, пр. Стачки, 194/2.

DOI: 10.19163/MedChemRussia2021-2021-478

E-mail: ksenijagajdukva@rambler.ru

Современная антиагрегантная терапия проводится с использованием фармакологических средств, которые, несмотря на их высокую эффективность, обладают рядом побочных явлений, что служит серьезным ограничением при их применении. В ранее проведенных исследованиях была выявлена способность некоторых производных бензимидазола блокировать процессы агрегации тромбоцитов, а также наличие антиоксидантной активности у представителей данного класса, в молекулярном остове которых присутствуют «ловушки» свободных радикалов. Именно поэтому поиск новых соединений с антиагрегантной активностью в ряду производных бензимидазола, имеющих в структуре экранированный фенольный заместитель, является весьма актуальным.

После выявления среди данных производных наиболее активных веществ, синтезированных в НИИ Физической и органической химии Южного Федерального университета, было найдено соединение-лидер под шифром РУ-1144, проявляющее выраженное сочетанное антитромбогенное и антиоксидантное действие [1].

Соединение **2** получали прямым введением в трицикл **1** ацилметильной группы с помощью 3,5-ди-*tert*-бутил-4-гидроксифенил бромида. При восстановлении кетона **2** борогидридом натрия в метаноле получали спирт, РУ-1144. Исходный 2,3,4,10-тетрагидро пиримидо[1,2-*a*]бензимидазол(**1**) образуется при термической внутримолекулярной циклизации 3-(3-хлорпропиламино)бензимидазола. Последний получали действием тионил хлорида на 3-(3-гидроксипропиламино)бензимидазол, синтезированный нагреванием 3-пропаноламина с бензимидазол-2-сульфокислотой.

Литература

- [1] A.A.Spasov, A.F.Kucheryavenko, K.A. Gaidukova, V.A. Kosolapov, O.N.Zhukovskaya Antiplatelet activity of new derivatives of benzimidazole containing sterically hindered phenolic group in their structure. Research Results in Pharmacology.2020, T. 6, № 1, С. 1-9.