

**АНТИМІКРОБНІ ВЛАСТИВОСТІ
2-АРИЛ-2,3-ДИГІДРО-4Н-[1,3]ТІАЗИНО[3,2-*a*]БЕНЗІМІДАЗОЛ-4-ОНІВ
ТА ЇХ ПОХІДНИХ**

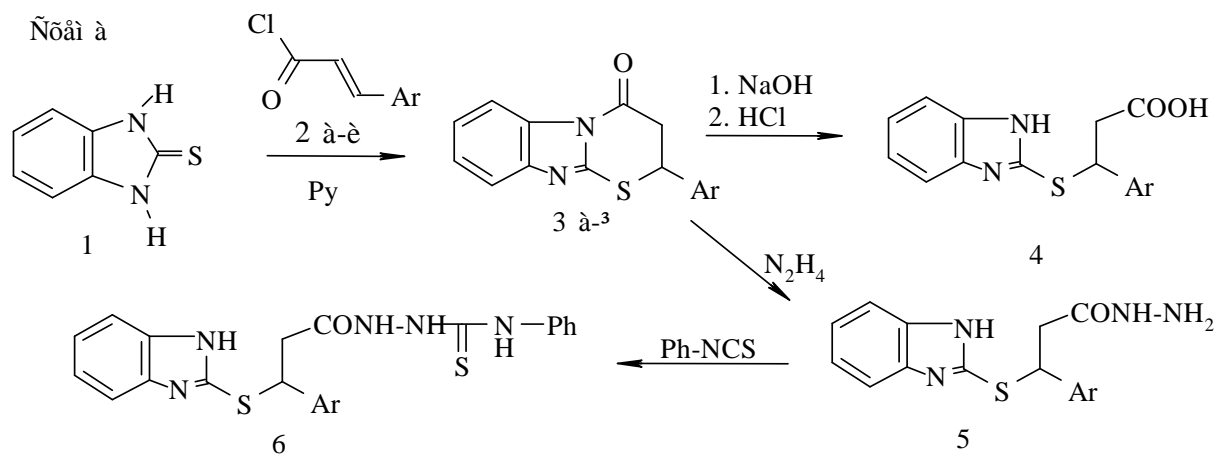
БРИЦУН В.М., МАЙБОРОДА О.І. *

Інститут органічної хімії НАН України

*Київський національний університет технологій та дизайну

Похідним 1,3-тіазину притаманні різноманітні види біологічної активності. Вони можуть використовуватися як пестицидні препарати і лікарські (протисудомні, анальгетичні, протипухлинні та антибактеріальні) засоби. В зв'язку з цим пошук нових методів синтезу і дослідження фізіологічної активності конденсованих гетероциклів, які містять 1,3-тіазинове кільце, є перспективним напрямком в сучасній органічній хімії та фармації.

Розроблено загальний метод синтезу 2-арил-2,3-дигідро-4Н-[1,3]тіазино[3,2-*a*]бензімідазол-4-онів **3а-і**, який полягає у взаємодії 2,3-дигідро-1Н-бензімідазол-2-тіону **1** з 3-арил-(гетерил)-2-пропеніолхлоридами (**2а-і**) в суміші бензол-піридин:



2, 3 Ar = C₆H₅ (а); 4-CH₃OC₆H₄ (б); 4-O₂NC₆H₄ (в); 3-O₂NC₆H₄ (г); 3,4-(CH₃O)₂C₆H₃ (д); 3,4,5-(CH₃O)₃C₆H₂ (е); 4-ClC₆H₄ (є); 4-FC₆H₄ (ж); 3,4-ClC₆H₃ (з); 2-тієніл (і);

4,5,6 Ar = C₆H₅

Досліджені антимікробні та антигрибкові властивості синтезованих сполук **3а-і** (схема). Антимікробна дія вивчалась по відношенню до грамположитивних і грамнегативних бактерій: стафілокока золотистого (*S.aureus* ATCC 25923), кишкової та синьогнійної паличок (*E. coli* ATCC 25922, *Ps. aeruginosa* ATCC 27853), а також по відношенню до дріжджеподібного гриба (*C. albicans* NTCC 885/653).

Отримані дані свідчать, що з 12 сполук 3 виявили значну антимікробну активність – **3з** і **3і** по відношенню до стафілококу (МПК = 2.5 мкг/мл), **3д** – по відношенню до кишкової палички (МПК = 5 мкг/мл).

Активність речовин **3з** і **3і** по відношенню до *S. aureus* за рівнем МПК близька до цефтазидиму і цефоперазону (відповідно 8 і 4 мкг/мл), а активність **3д** щодо *E.coli* - до МПК ампіциліну (2-8 мкг/мл). Жодна сполука в досліджуваних концентраціях не показала інгібуючої дії на ріст та розмноження *Ps. aeruginosa* та гриба *C. albicans*.