

2H-4-GIDRAZINIL5,6-DIMETIL TIENO[2,3-D]PIRIMIDINNING AROMATIK ALDEGIDLAR BILAN REAKSIYASI.

O.J.Meliqulov, E.S.Baymuradov

Samarqand davlat tibbiyot instituti Farmakognoziya va farmasevtik texnologiya kafedrası.

Annotatsiya: 4–gidrazinil-5,6dimetiltieno[2,3-d]pirimidinning optimal sintez qilish usullari yaratildi. Ularning aldegidlar bilan reaksiyasi o'rganilib, reaksiyaga ta'sir etuvchi omillar topildi va yuqori unum bilan maxsulot sintez qilib olindi. Ishining ilmiy – amaliy ahamiyati shundan iboratki sintez qilib olingan mahsulotlar orasida mikroblar va bakteryalarga qarshi faollikga ega bo'lgan moddalar borligi aniqlangan.

Kalit so'zlar: pirimidin, aldegid, reaksiya, 4 – gidrazinil- 5,6 dimetiltieno[2,3-d]-pirimidin, salitsil aldegid, 3,4-dimetsibenzaldegid, 5-bromsalitsil aldegid, DNK, RNK, geterosiklik birikma

Реакция 2H-4-гидразинил 5,6-диметилтиено[2,3-d]пиримидина с ароматическими альдегидами.

О.Ж.Меликулов, Э.С.Баймурадов

Самаркандский государственный медицинский институт, кафедра фармакогнозии и фармацевтической технологии.

Аннотация: Разработаны оптимальные методы синтеза 4-гидразинил-5,6-диметилтиено[2,3-d]пиримидина. Изучена их реакция с альдегидами, найдены факторы, влияющие на реакцию, и синтезирован продукт с высокими выходами. Научно-практическая значимость его работы заключается в том, что среди синтезированных продуктов были обнаружены вещества, обладающие антимикробной и антибактериальной активностью.

Ключевые слова: пиримидин, альдегид, реакция, 4-гидразинил-5,6-диметилтиено[2,3-d]-пиримидин, салициловый альдегид, 3,4-диметилбензолальдегид, 5-бромсалициловый альдегид, ДНК, РНК, гетероциклическое соединение.

Reaction of 2H-4-hydrazinyl 5,6-dimethylthieno[2,3-d]pyrimidine with aromatic aldehydes.

O.Zh.Melikulov, E.S.Baymuradov

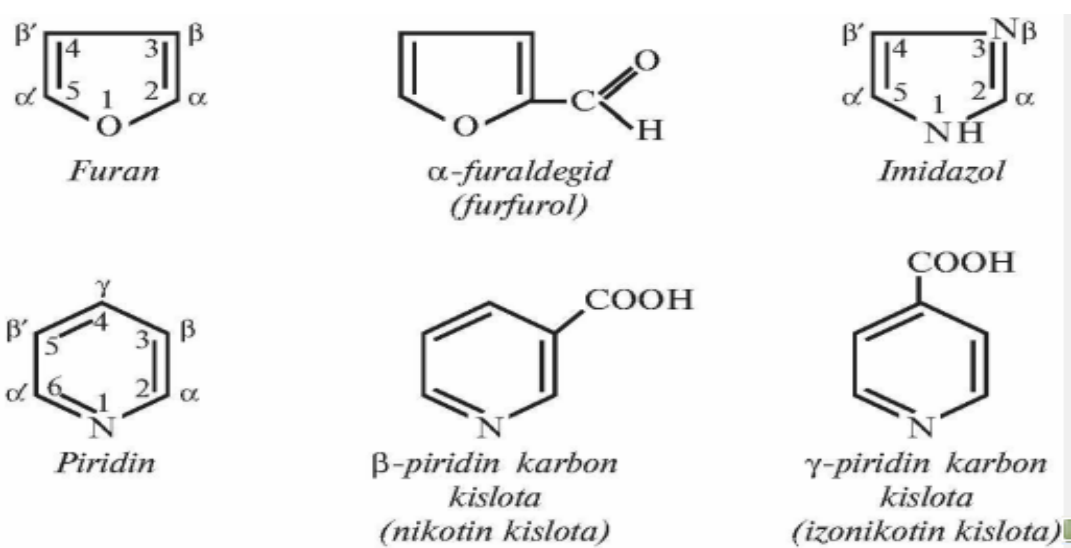
Samarkand State Medical Institute, Department of Pharmacognosy and Pharmaceutical Technology.

Abstract: Optimal methods for the synthesis of 4-hydrazinyl-5,6-dimethylthieno[2,3-d]pyrimidine have been developed. Their reaction with

aldehydes was studied, the factors influencing the reaction were found, and the product was synthesized in high yields. The scientific and practical significance of his work lies in the fact that among the synthesized products, substances with antimicrobial and antibacterial activity were found.

Keywords: pyrimidine, aldehyde, reaction, 4-hydrazinyl-5,6-dimethylthieno[2,3-d]-pyrimidine, salicylaldehyde, 3,4-dimethylbenzenealdehyde, 5-bromosalicylic aldehyde, DNA, RNA, heterocyclic compound.

Geterosiklik birikmalar o'simlik va hayvon organizmida muhim ahamiyatga ega bo'lgan birikmalar qatoriga kiradi. Geterosiklik birikmalar tarkibida uglerod atomlaridan tashqari boshqa geteroatom- azot, oltingugurt, fosfor, kislorod kabi muhim elementlar uchraydi. Masalan furan, tiofen, pirrol, pirimidin, piridin, ko'plab alkaloidlar, vitaminlar, shular jumlasiga kiradi. Geterosiklik birikmalar ko'plab o'simliklarni tarkibida itaminlar, alakaloidlar, glikozodlar ko'rinishida, nuklein kislotalar DNK va RNK larni tarkibida uchraydi.



Furan, tarkibida kislorod geteroatomi saqlagan besh a'zoli siklik birikma, bo'lib, u ko'pgina dori moddalarning molekula tuzilishida ishtirok etadi. Ayniqsa, furan halqasining beshinchi holatidagi uglerod atomida nitroguruh saqlagan hosilalari tibbiyotda turli yuqumli kasalliklarni davolashda antimikrob modda sifatida alohida o'rinni egallaydi.

Geterosiklik birikmalar orasida izoxinolin, xinolin, pirimidin, purin asoslari saqlagan alkaloidlar katta ahamiyatga ega va tibbiyotda keng miqyosda qo'llaniladi. Bundan tashqari DNK va RNK tarkibidagi azot asoslari ham ikki purin va pirimidin hosilalari hisoblanadi. Adenin va guanin purin hosilasi bo'lsa, uratsil, timin, sitozin esa pirimidin hosilasi hisoblanadi. Getersiklik birikmalarning

uglevodlar bilan hosil qilgan birikmalari ya'ni glikozidlari tibbiyotda yurak kasalliklarida, turli xil yuqumli kasalliklarda va o'sma kasalliklarida ko'plab dori vositasi sifatida qo'llaniladi.

So'ngi yillarda chop etilayotga ko'plab maqola va tezislar tahlili natijalari shundan dalolat beradiki tarkibida geteroatom saqlagan birikmlar ustida turli xil tadqiqot olib borish ishlari jadal sur'atlar bilan rivojlanib bormoqda. Hozirgi kunda geterosiksik birikmalar ustida O'zbekiston Respublikasi fanlar akademiyasi qoshidagi o'simlik moddalari kimyosi instituti olimlari tomonidan turli xil tadqiqot ishlari olib borilib, turli biologik faollikga ega bo'lgan birikmalar sintez qilib olinmoqda.

O'zbekiston Respublikasi fanlar akademiyasi qoshidagi o'simlik moddalari kimyosi instituti organik sintez bo'limida aynan geterosiklik birikmalar ustida jumladan, piridin, pirrol, tiofen, furan kabi birikmalar ustidagi tajribalar marhum professor M.H.Shohdayatov boshchiligida institut olimlari tomonidan amalga oshirilgan.

Geterosiklik birikmalarning e'tiborli tomoni shundaki ular orasida qishloq xo'jaligi zararkunandalariga qarshi faollikga ega bo'lish bilan bir qatorda, turli xil viruslarga, bakteriyalarga qarshi hamda turli-xil ferment ingibitorlari xususan siklinga bog'liq kinaza, endoplazmatik redikulum kinazaga o'xshash protium kinazaga qarshi moddalar topilganligi ularga bo'lgan qiziqishni yanada orttirib yubordi.

Rejalashtirgan tadqiqot ishimizni olib borish uchun biz dastlabki moddalarni sintezini keltirilga adabiyotlarga ozroq o'zgartirish kiritish orqali sintez qilib oldik. Buning uchun bizga metiletil keton, siansirka kislota va oltin-gugurtlarning 1;1;1; nisbatdagi aralashmasidan foydalandik. Jarayon yumshoq sharoitda 35-40 gradusda olib borildi. Erituvchi sifatida dietilamin ishlatildi va mahsulotlar yaxshi unumlar bilan sintez qilib olindi.

Olingan mahsulotdan yana 3 bosqichda 2H-4-gidrazinil tieno[2,3-d] pirimidin-ning sintezi amalga oshirildi.

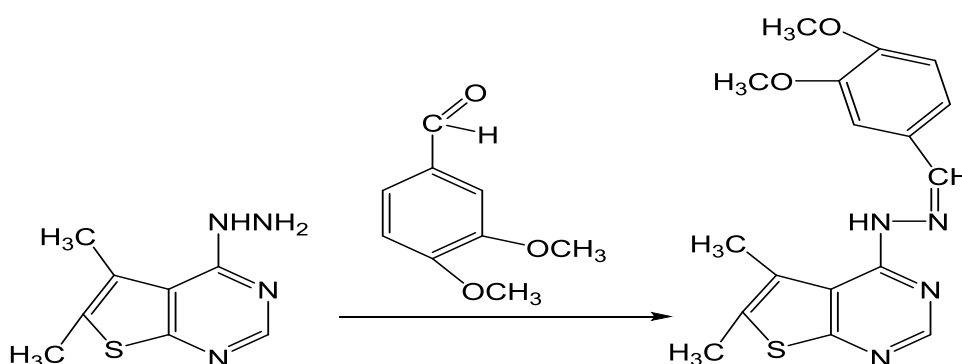
2H-4-gidrazinil tieno[2,3-d] pirimidinning aromatik aldegidlar bilan reaksiyasi O'zRFA qoshidagi o'simlik moddalari kimyosi instituti olimlari bilan birgalikda amalga oshirildi. Reaksiya uchun 3,4-dimetoksibenzaldegid, meta nitrobenzaldegid, 5-bromsalitsil aldegid kabi moddalar olindi.

2H-4-gidraziniltieno[2,3-d] pirimidinning meta nitrobenzaldegid bilan reaksiyasi.

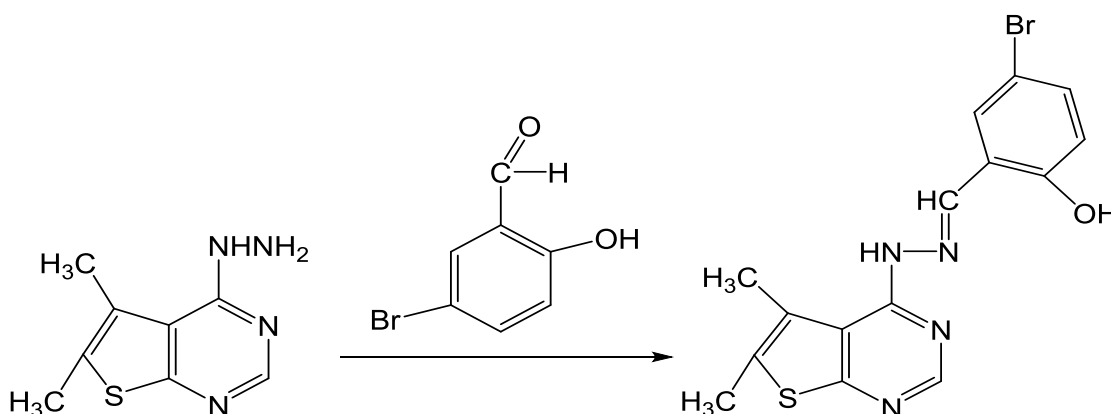
O'zBRFA qoshidagi o'simlik moddalari kimyosi institutining organik sintez bo'limi olimlari tomonidan 2H-4-gidrazinil-5,6-dimetiltieno[2,3d] pirimidin-

ning bir qancha karbonil birikmalar bilan reaksiyasi ham o'rganib chiqildi. Jumladan 3,4- dimetoksibenzaldegid , 5 - brom salitsilaldegid va 3,4-dimetoksibenzaldegid bilan reaksiyasi o'rganilib, tegishli mahsulotlar olindi. Bunda reaksiya xona haroratida magnetli meshalkada aralashtirib turilgan holda 3 soat mobaynida olib boriladi. Reaksiyada katalizator sifatida suyultirilga xlorid kislota ishlatiladi.

2H-4-gidrazinil-5,6-dimetiltieno[2,3d] pirimidinning 3,4-dimetoksibenzaldegid bilan reaksiyasi.



Quyida keltirilgan reaksiya orqali 78 % unum bilan reaksiya mahsuloti 5,6-Dimetil-4-(2-(3, 4-di metoksibenziliden)gidrazinil)tieno[2,3-d]pirimidin olindi. 2H-4-gidrazinil-5,6-dimetiltieno[2,3-d]pirimidinning 5-bromsalitsil aldegid bilan reaksiyasi xona haroratida 3 soat mobaynida konsentrlangan xlorid kislota ishtirokida olib borildi.



2H-4-gidrazinil-5,6-dimetiltieno[2,3-d]pirimidinning 4- oksibenzaldegid bilan reaksiyasi.

Xulosa

Yuqorida qayd etilganidek, tarkibida binukleofil [gidrazin] fragmenti saqlagan 2H-4-gidrazinil-5,6-dimetiltieno[2,3-d]pirimidin sintetik organik va bioorganik kimyo uchun zarur sinton hisoblanadi. Chunki, ularni turli elektrofil reagentlar bilan modifikatsiyasini olib borish nafaqat yangi hosilalar, *E*-, *Z*-izomer gidrazonlar, balki tarkibida N-atomi saqlagan yangi geterotsiklik birikmalar hosil bo'lishiga olib kelishi mumkin. Bunday reaksiyalarni borishida, ya'ni elektrofil birikish yoki geterotsiklizatsiya reaksiyalarining borishida muhim omillarni o'rganish juda muhimdir.

Reaksiya natijasida olingan 5,6-dimetil-4-(2-(5-brom-2-oksibenziliden)gidrazinil)tieno[2,3-d]pirimidinning suyuqlanish temperaturasi 238–240C ga, Rf qiymati esa 0.8ga, 5,6-dimetil-4-(2-(3,4-dimetoksibenziliden)gidrazinil)tieno[2,3-d]pirimidinning suyuqlanish temperaturasi 214 – 216 C ga, Rf qiymati esa 0.733 ga teng ekanligi aniqlandi.

Foydalanilgan adabiyotlar

1. B. Zh. Elmuradov, Kh. A. Bozorov and Kh. M. Shakhidoyatov // Thieno[2,3-d]Pyrimidin-4-ones. Part 2. Condensation of 2,3- Disubstituted Thieno[2,3-d]Pyrimidin-4-ones with Aldehydes// American Chemical Science Journal 3(2): 164-177, 2013
2. Khurshed Bozorov, Jiang-Yu Zhao, and Haji A. Aisa, Recent advances in *ipso*-nitration reactions, Arkivoc 2017, part i, 41-66 DOI: 10.3998/ark.5550190.p009.852.
3. I.S. Ortikov, B. Zh. Elmuradov, Kh. M. Shakhidoyatov, Thieno[2,3-d]pyrimidin-4-ones. Part 4. Directions of reactions of the 2-oxo-, -thioxo-5,6-dimethyl-3,4-dihydrothieno[2,3-d]pyrimidine-4-ones with electrophilic reagents, American Chemical Science Journal 2014, 4 (6), 774-786.
4. S Brase, J. H. Kirchhoff, J. Kobberling, *Tetrahedron*, 2003, 59 (7), 885-939.
5. Vikunjana K. Akbari, Pragnesh D. Patel and Keshav C. Patel// Synthesis, Characterization And Biological Evaluation of Some New Thieno[2,3-d]Pyrimidine Derivatives// *Int. Journal of Chem Tech Research* Vol.5, pp 142-155, 2013
6. N.L. Shirole, K.D. Shirole, R.D. Deore, R.A. Fursule and G.S. Talele // Synthesis, Characterization and Pharmacological Evaluation of 2-

Substituted thieno[2,3-d]pyrimidine-4(3H)-ones // *Asian Journal of Chemistry* Vol. 19, No. 7 (2007), 4985-4992.

7. S. Kanwar, S.D. Sharma// Thienopyrimidines as hetryl moiety in 2-azetidinones: Synthesis of 4-hetryl-2-azetidinones // *Indian Journal of Chemistry*. Vol, 44 B, 2005, 2367-2371