

СИНТЕЗ НОВЫХ АМИДОВ *N*-АЦИЛ-*N*-АРИЛАЛАНИНАТА КАК ПОТЕНЦИАЛЬНЫХ ПРОТИВОГРИБКОВЫХ ВЕЩЕСТВ

Баландина В.И.⁽¹⁾, Яковлева В.Э.⁽¹⁾, Калинина Т.А.⁽¹⁾, Глухарева Т.В.^(1,2)

⁽¹⁾ Уральский федеральный университет

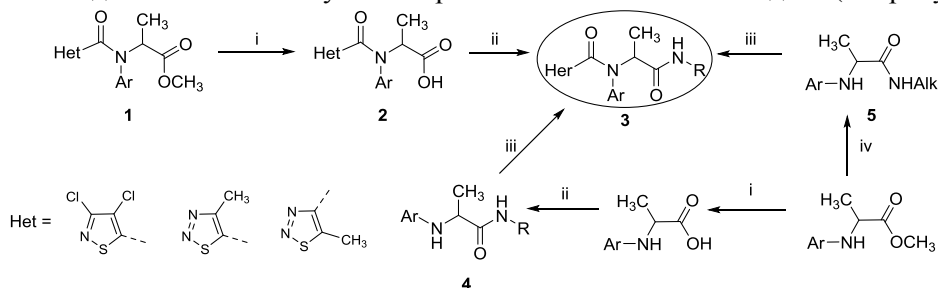
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

⁽²⁾ Институт органического синтеза УрО РАН

620137, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22

N-Ацил-*N*-арилаланинаты – соединения, обладающие различными видами биологической активности, главным образом, пестицидной. Они проявляют фунгицидные, гербицидные, антибактериальные свойства. В сельском хозяйстве в качестве системных фунгицидов применяют такие ацилаланиновые препараты, как металаксил, беналаксин, фуралаксин.

Ранее нами был разработан метод получения новых *N*-ацилированных метил-*N*-арилаланинатов **1**, содержащих 4(5)-метил-1,2,3-тиадиазол-5(4)-илкарбонильный и 3,4-дихлор-1,2-тиазол-5-илкарбонильный заместители – фрагменты индукторов системной устойчивости растений. В ряду данных производных были обнаружены вещества, проявляющие высокую фунгицидную активность в отношении фитопатогенных грибов. С целью расширения ряда новых соединений были получены карбоновые кислоты **2** и амиды **3** (см. рисунок).



i 1. NaOH, H₂O, rt, 2. HCl, rt; ii NH₂R, NHS, DIPC, THF (dry), rt; iii HetCOCl, Et₃N, benzene (dry), 80°C; iv NH₂Alk, methanol, 40°C.
R = Ar, Alk; Alk = CH₃, CH(CH₃)₂, (CH₂)₂CH₃; Ar = C₆H₅, 4-CH₃C₆H₄, 4-CH₃OC₆H₄, 4-ClC₆H₄, 3-CH₃C₆H₄, 3-CH₃OC₆H₄, 2,6-(CH₃)₂C₆H₃, 2-CH₃-3-ClC₆H₃, 2,4,6-(CH₃)₃C₆H₂, 4-CF₃C₆H₄

Синтез *N*-ацил-*N*-арилаланинатов и их амидов

Карбоновые кислоты **2** были синтезированы щелочным гидролизом и использованы для получения амидов **3** методом пептидного синтеза. Реакция с ароматическими аминами проводилась в присутствии *N*-гидрохлоридсукцинимид и *N,N'*-диизопропилкарбодиимид в тетрагидрофуране. Также карбоксамиды **3** были получены из анилинов **4** и **5** ацилированием хлорангидридами гетероциклических карбоновых кислот.

Строение полученных соединений было доказано с помощью методов ЯМР ¹H, ¹³C спектроскопии, масс-спектрометрии и ИК-спектроскопии.

Биологическая активность веществ исследована в отношении фитопатогенных штаммов грибов и оомицетов.