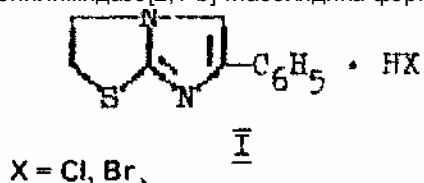
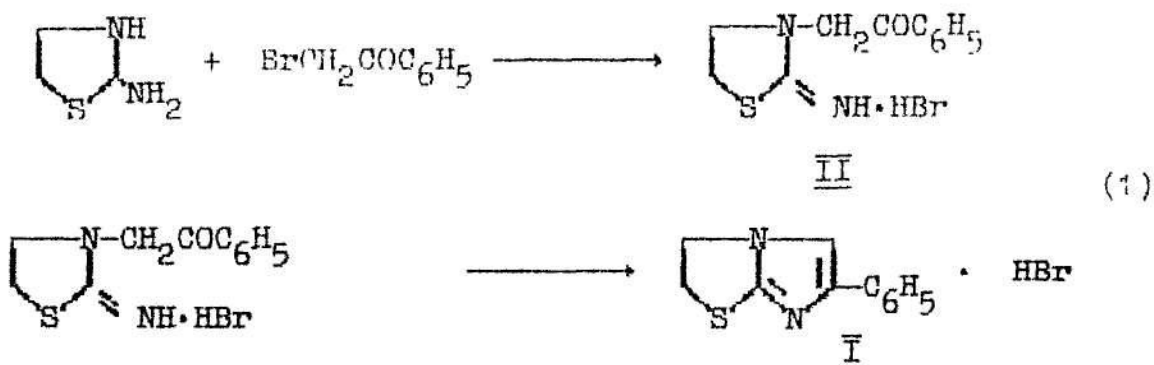


Изобретение относится к области органической химии, конкретно способу получения бром(хлор)гидрата 6-фенилимидазо[2,1-b]тиазолидина формулы I



который проявляет антигельминтные свойства и может быть применен в ветеринарной практике в качестве высокоэффективного, малотоксичного, экологически чистого антигельминтика.

Известный способ получения соединения I имеет две стадии: первая - фенацилирование 2-аминотиазолина фенацилбромидом с выделением гидробромида 2-имино-3-фена-цилтиазолина II; вторая - циклодегидратация II (схема 1)



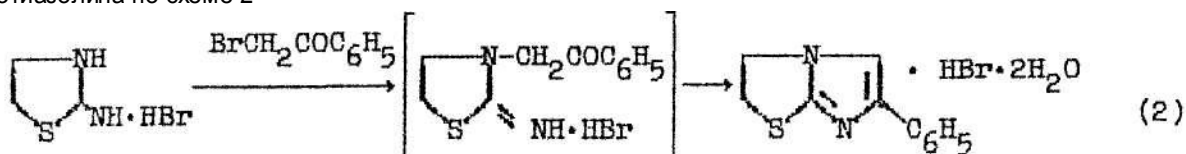
Первую стадию проводят в бензольном растворе в течение 5 часов, в результате получают бромгидрат 2-имино-3-фенацил-тиазолина II, который после выделения путем кипячения в воде циклизуется в соединение I (стадия 2).

К недостаткам известного метода следует отнести:

- двухстадийность процесса получения целевого продукта;
- применение в качестве растворителя токсичного и пожароопасного бензола;
- длительность реакции фенацилирования (5 ч);
- невысокий (менее 70%) выход продукта реакции.

Задачей изобретения является разработка способа получения бром(хлор)гидрата 6-фенилимидазо[2,1-b]тиазолидина, в котором, путем замены исходных реагентов, достигалась бы возможность исключения токсичного растворителя, повышения выхода конечного продукта, а также проведения процесса в одну стадию, что привело бы к сокращению времени протекания реакции.

Поставленная задача достигается тем, что соединение I получают исходя из соли бром(хлор)гидрата 2-иминотиазолина по схеме 2



Взаимодействие бром(хлор)гидрата 2-иминотиазолина с фенацилбромидом(хлоридом) проводят в водно-спиртовой среде в присутствии щелочи в течение 0,5-1,0 ч.

Использование 2-аминотиазолина в виде соли и проведение реакции в щелочной водно-спиртовой среде представляет новизну предлагаемого решения.

Указанные условия позволяют в одной среде осуществить две реакции - фенацилирование и циклодегидратацию - и приводят к:

- исключению стадии выделения бром(хлор)гидрата 2-имино-3-фенацилтиазолина;
- исключению бензола, как растворителя;
- повышению выхода целевого продукта более, чем на 25%;
- сокращению продолжительности реакции фенацилирования с 5 ч до 0,5-1,0 ч.

Продукт I, полученный предлагаемым способом представляет собой белые кристаллы, ограниченно растворимые в воде и спирте. Т.пл. ХП 203-205°C; Т.пл. БП 202-204°C; ИК-спектр (KBr, см⁻¹): ν_{C=O} = 1510-1620; ν_{N-H} = 2650-2760; УФ-спектр (этанол, λ, нм): 278-360; 218-236, что соответствует литературным данным.

Элементный анализ:

Найдено, %: С 41,40; Н 4,75; Br 25,3; N 8,85; S 10,05.

Вычислено для C₁₁H₁₀N₂S · HBr · 2H₂O, %: С 41,38; Н 4,73; Br 25,03; N 8,77; S 10,04. После сушки при 100°C:

Найдено, %: С 46,80; Н 3,95; Br 28,21; N 9,90; D 11,41.

Вычислено для C₁₁H₁₀N₂S · HBr, %: С 46,69; Н 3,91; Br 28,21; N 9,89; S 11,39.

Спектр ПМР СДМСО-D₆, δ, м.д.): 4,19 т (2H, 2CH₂); 4,49 т (2H, 3CH₂); 7,47-7,64 м (5H, C₆H₅); 8,16с (1H, 5H).

Пример 1. К раствору, содержащему 1,83 г гидробромида 2-иминотиазолина и 0,56 г гидроксида калия в 20 мл воды, при перемешивании прибавляют 2 г фенацилб-ромид в 5 мл этанола. После прибавления продолжают перемешивание в течение 0,5 ч. Осадок отфильтровывают и сушат в вакуум-эксихаторе.

Получают 3,06 г двуводного бромгидрата 6-фенилимидазо[2,1-b]тиазолидина (96%). Кристаллизационную воду удаляют при сушке (100°) в течение 2 ч.

Пример 2. К раствору, содержащему 1,39 г гидрохлорида 2-иминотиазолина и 0,56 г гидроксида калия в 20 мл воды, при перемешивании прибавляют 1,55 г фенацил-хлорида в 5 мл этанола. Реакцию проводят в течение 1 ч и продукт выделяют аналогично примеру 1.