

СИНТЕЗ ТА ВИВЧЕННЯ АНТИЕКСУДАТИВНОЇ АКТИВНОСТІ 6-АМІНО-5,7-ДИМЕТИЛ-3*H*-ТІАЗОЛО[4,5-*b*]ПІРИДИН-2-ОНУ ТА ЙОГО 6-АРИЛІДЕНАМІНО-ПОХІДНИХ

©Т. І. Чабан, В. В. Огурцов, І. Г. Чабан, М. М. Леб'як, І. О. Нектегаєв

Львівський національний медичний університет імені Данила Галицького

Резюме: вперше одержаний нами 5,7-диметил-6-фенілазо-3*H*-тіазоло[4,5-*b*]піридин-2-он (**1**) вивчався у реакціях відновлювального розщеплення, що призвело до отримання неописаного в літературі 6-аміно-5,7-диметил-3*H*-тіазоло[4,5-*b*]піридин-2-ону (**2**) – реагенту в перетвореннях базової гетероциклічної системи за положенням 6, який утилізовано в реакціях конденсації з ароматичними альдегідами з утворенням серії нових 6-ариліденамінопохідних. Вивчені деякі аспекти антиексудативної активності синтезованих речовин.

Ключові слова: конденсація, відновлювальне розщеплення, тіазоло[4,5-*b*]піридини, антиексудативна активність.

Вступ. Розробка препаративних методів синтезу конденсованих гетероциклічних систем із потенційною біологічною активністю є актуальним завданням для сучасної органічної, медичної і фармацевтичної хімії.

Тіазоло[4,5-*b*]піридини, які мають ізостеричну будову з відомими пуриновими і піримідиновими основами, становлять інтерес як можливі біологічно активні сполуки. Однак зазначений тип сполук з хімічної точки зору є важкодоступним і як наслідок на сьогодні залишається маловивченим [1, 2, 3, 4]. Інформації про біологічну активність серед похідних тіазоло[4,5-*b*]піридину також недостатньо. Зокрема, серед зазначених похідних виявлені речовини, що проявляють фунгіцидну активність [5], агоністи *H³*-гістамінових рецепторів [6], антагоністи метаболічних глутаматних рецепторів 5 (mGluR5) [7] з високою інгібуючою активністю до рецепторів епідермального фактора росту [8] та низки інших ферментів [9, 10].

Метою нашої роботи є синтез неописаного в літературі 6-аміно-5,7-диметил-3*H*-тіазоло[4,5-*b*]піридин-2-ону (**2**) та його структурна модифікація за положенням 6 шляхом утилізації в реакціях конденсації з ароматичними альдегідами з утворенням серії нових 6-ариліденамінопохідних та вивчення їх антиексудативної активності.

Методи дослідження. Об'єктами досліджень є похідні тіазоло[4,5-*b*]піридину, зокрема 6-аміно-5,7-диметил-3*H*-тіазоло[4,5-*b*]піридин-2-ону (**2**) – реагенту в перетвореннях базової гетероциклічної системи за положенням 6, який утилізовано в реакціях конденсації з ароматичними альдегідами з утворенням серії нових 6-ариліденамінопохідних. Для встановлення будови та індивідуальності синтезованих речовин були використані методи кількісного елементного

аналізу та спектроскопії ПМР. Антиексудативну активність синтезованих сполук вивчали на карагеніновій моделі запального набряку щура.

Результати й обговорення. Нами встановлено, що при взаємодії 4-імінотіазолідону-2 з α -фенілацетилацетоном утворюється 5,7-диметил-6-фенілазо-3*H*-тіазоло[4,5-*b*]піридин-2-он (**1**), а спроба його синтезу з 5,7-диметил-3*H*-тіазоло[4,5-*b*]піридин-2-ону та солі фенілдіазонію не завершується успіхом. Слід відзначити, що сполука **1** з хімічної точки зору становить інтерес як проміжний продукт для переходу до перспективних у синтетичному відношенні 6-амінопохідних тіазоло[4,5-*b*]піридину. З метою одержання сполуки **2** вивчали реакцію відновлювального розщеплення речовини **1**. Проведені експерименти показали, що найоптимальнішими умовами для одержання сполуки **2** є використання як відновника цинкового порошку у середовищі ацетатної кислоти. Структуру сполуки **2** підтверджено даними кількісного елементного аналізу та спектроскопії ПМР, які наведені в експериментальній частині роботи. Наявність аміногрупи у положенні 6 молекули **2** стало обґрунтуванням для утилізації вказаної сполуки у відповідні 6-ариліденамінопохідні. Дослідами встановлено, що оптимальним середовищем для взаємодії **2** з ароматичними альдегідами є оцтова кислота (схема 1).

Для синтезованих сполук вивчено спектри ПМР, які підтверджують їх структуру. Фізико-хімічні та спектральні характеристики одержаних похідних наведені в експериментальній хімічній частині.

Токсикометричні дослідження синтезованих сполук вивчали за відомою методикою [11]. Речовини вводили в дозах 500, 800, 1000, 1500 мг/кг маси тварини, при одноразовому па-

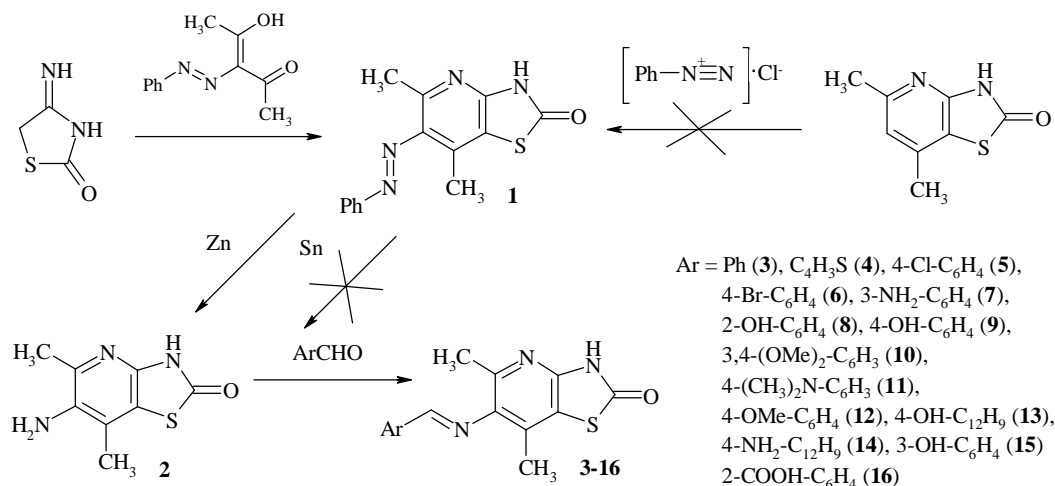


Схема 1.

рентеральному введенні суспензії речовин білим мишам обох статей масою 18–22 г. За тваринами спостерігали впродовж 14 днів. Як контроль використовували групу тварин, яким було введено воду очищену.

У результаті проведених токсикометричних досліджень встановлено, що значення LD₅₀ дозволяє віднести синтезовані сполуки до V класу безпеки, тобто за ступенем токсичності і небезпеки вони відповідають вимогам до лікарських засобів.

Антиексудативна активність досліджуваних речовин вивчалась за відомою методикою [11] на карагеніновій моделі запального набряку лапи білого щура. Зазначений експеримент був проведений на нелінійних білих щурах обох статей масою 180–220 г. Запальний набряк вик-

ликали ін'єкцією в асептичних умовах 0,1 мл 2% розчину карагеніну під апоневроз підошви задньої кінцівки щура. Наявність запальної реакції встановлювали за зміною об'єму кінцівки онкометричним методом до початку досліду та через 4 год після введення флогогенного агента. За 0,5 год до ін'єкції розчину карагеніну тваринам внутрішньочеревно вводили досліджувані речовини в дозі 100 мг/кг маси. Для порівняння у аналогічних умовах вивчали антиексудативний ефект відомих лікарських засобів в середньотерапевтичних дозах: вольтарен – 8 мг/кг, бутадіон – 50 мг/кг, аспірин – 100 мг/кг, ібупрофен – 50 мг/кг.

Одержані експериментальні результати наведені в таблиці 1.

Таблиця 1. Антиексудативна активність досліджуваних сполук

Сполука або еталонний лікарський засіб	Доза мг/кг	LD ₅₀ мг/кг	Показник пригнічення запальної реакції, %
Вольтарен	8	–	52
Бутадіон	50	–	45
Ібупрофен	50	–	40
Сполука 1	100	350	57
Сполука 2	100	225	23
Сполука 3	100	445	18
Сполука 4	100	726	15
Сполука 5	100	534	12
Сполука 6	100	425	21
Сполука 7	100	650	18
Сполука 8	100	520	16
Сполука 9	100	766	20
Сполука 10	100	750	25
Сполука 11	100	655	17
Сполука 12	100	890	22
Сполука 13	100	410	21
Сполука 14	100	665	23
Сполука 15	100	740	19
Сполука 16	100	524	12

Експериментальна хімічна частина. Спектри ПМР синтезованих сполук знімали на приладі «Varian Mercury VX-400», розчинник ДМСО- D_6 , стандарт – тетраметилсилан. Дані елементного аналізу на вміст Нітрогену і Сульфуру відповідають розрахованим ($\pm 0,3\%$).

5,7-Диметил-6-фенілазо-3H-тіазоло[4,5-b]піридин-2-он. (1) 200 ммоль натрію розчиняють у 100 мл абсолютного метанолу. До одержаного розчину додають 50 ммоль 4-імінотіазолідо-ну-2 і 50 ммоль α -фенілазоацетилацетону. Суміш залишають на 7 діб, потім підкислюють оцтовою кислотою до слабкокислого середовища і додають п'ятикратний надлишок води. Осад, що випав, відфільтровують, промивають водою і висушують за 100–110 °С. Після перекристалізації з толуолу цегляно-червоний кристалічний порошок з Т. пл. = 258–259 °С; добре розчинний у ДМФА, ДМСО, розчинах лугів і мінеральних кислот, мало – у бензені, толуені, спиртах; погано – в інших органічних розчинниках і воді.

6-Аміно-5,7-диметил-3H-тіазоло[4,5-b]піридин-2-он. (2) У 35 мл оцтової кислоти вносять 5 ммоль **2**. Суміш нагрівають до кипіння, що призводить до повного розчинення **2**. В отриманий розчин, який продовжують нагрівати, у декілька прийомів упродовж 1 години вносять 35 ммоль активованого цинкового порошку, що призводить до знебарвлення розчину. Потім розчин відфільтровують до фільтрату, охолодженого до кімнатної температури, додають 50 мл води і залишають на 4 години. Осад, що випав, відфільтровують, промивають водою і висушують. Вихід 0,6 г (62 %). Т. пл. 280 °С (з розкл.) (з ацетатної кислоти). Це білий кристалічний порошок, добре розчинний у ДМФА, ДМСО, розчинах лугів і мінеральних кислот; не розчинний у воді.

Загальна методика синтезу 6-ариліде-наміно-5,7-диметил-3H-тіазоло[4,5-b]піридин-2-онів (продукти взаємодії з ароматичними альдегідами) (3–16)

Суміш 5 ммоль сполуки **2** 5 ммоль відповідного ароматичного альдегіду і 15 мл оцтової кислоти кип'яють упродовж 30 хвилин. Кристалічний осад, що випав після охолодження, відфільтровують, промивають оцтовою кислотою та висушують. Одержані сполуки перекристалізують з оцтової кислоти (сполуки **3–8**), етанолу (сполуки **9–16**).

Сполука 1. Вихід 86 %. Т.пл. 258–259 °С. Знайдено, %: N 19,77; S 11,41. $C_{14}H_{12}N_4OS$. Обчислено, %: N 19,70; S 11,28. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,42 (с, 3H, CH_3), 2,61 (с, 3H, CH_3), 7,61 (д, 3H, $J=7,6$ Гц, Ph), 7,87 (д, 2H, $J=6,4$ Гц, Ph), 12,77 (с, 1H, NH).

Сполука 2. Вихід 60 %. Т.пл. 280 °С. Знайдено, %: N 21,40; S 16,55. $C_8H_9N_3OS$. Обчислено, %:

N 21,52; S 16,42. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,11 (с, 3H, CH_3), 2,28 (с, 3H, CH_3), 4,67 (с, 2H, NH_2), 11,89 (с, 1H, NH).

Сполука 3. Вихід 75 %. Т.пл. 260–261 °С. Знайдено, %: N 9,80; S 11,39. $C_{16}H_{14}N_2OS$. Обчислено, %: N 9,92; S 11,36. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,13 (с, 3H, CH_3), 2,30 (с, 3H, CH_3), 7,54–7,60 (м, 3H, Ar), 7,97 (д, 2H, $J=6,9$ Гц, Ar), 8,44 (с, 1H, CH), 12,32 (с, 1H, NH).

Сполука 4. Вихід 72 %. Т.пл. 275–276 °С. Знайдено, %: N 14,65; S 22,25. $C_{13}H_{11}N_3OS_2$. Обчислено, %: N 14,52; S 22,16. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,13 (с, 3H, CH_3), 2,29 (с, 3H, CH_3), 7,23 (с, 1H, Ar), 7,67–7,81 (м, 2H, Ar), 8,51 (с, 1H, CH), 12,09 (с, 1H, NH).

Сполука 5. Вихід 68 %. Т.пл. 290 °С. Знайдено, %: N 13,40; S 9,96. $C_{15}H_{12}ClN_3OS$. Обчислено, %: N 13,22; S 10,09. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,12 (с, 3H, CH_3), 2,28 (с, 3H, CH_3), 7,61 (д, 2H, $J=6,5$ Гц, Ar), 7,98 (д, 2H, $J=6,5$ Гц, Ar), 8,46 (с, 1H, CH), 12,40 (с, 1H, NH).

Сполука 6. Вихід 55 %. Т.пл. 270–271 °С. Знайдено, %: N 11,40; S 8,96. $C_{15}H_{12}BrN_3OS$. Обчислено, %: N 11,60; S 8,85. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,13 (с, 3H, CH_3), 2,19 (с, 3H, CH_3), 7,77 (д, 2H, $J=8,2$ Гц, Ar), 7,91 (д, 2H, $J=8,3$ Гц, CH), 8,45 (с, 1H, CH), 12,38 (с, 1H, NH).

Сполука 7. Вихід 63 %. Т.пл. 295 °С. Знайдено, %: N 16,40; S 9,46. $C_9H_9N_3OS$. Обчислено, %: N 16,27; S 9,31. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч. J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,16 (с, 3H, CH_3), 2,32 (с, 3H, CH_3), 7,87 (с, 1H, Ar), 8,43 (с, 2H, Ar), 8,65 (с, 1H, Ar), 8,78 (с, 1H, CH), 12,40 (с, 1H, NH).

Сполука 8. Вихід 68 %. Т.пл. 252–253 °С. Знайдено, %: N 14,24; S 10,86. $C_{15}H_{13}N_3O_2S$. Обчислено, %: N 14,04; S 10,71. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,18 (с, 3H, CH_3), 2,35 (с, 3H, CH_3), 7,01–7,03 (т, 2H, Ar), 7,47 (т, 1H, $J=8,2$ Гц, Ar), 7,66 (д, 1H, $J=7,8$ Гц, Ar), 8,69 (с, 1H, CH), 12,47 (с, 1H, OH), 12,58 (с, 1H, NH).

Сполука 9. Вихід 65 %. Т.пл. 265–266 °С. Знайдено, %: N 14,28; S 10,66. $C_{15}H_{13}N_3O_2S$. Обчислено, %: N 14,04; S 10,71. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,14 (с, 3H, CH_3), 2,65 (с, 3H, CH_3), 6,75–6,80 (м, 2H, Ar), 7,78–7,84 (м, 2H, Ar), 8,69 (с, 1H, CH), 10,95 (с, 1H, OH), 12,47 (с, 1H, NH).

Сполука 10. Вихід 60 %. Т.пл. 262–263 °С. Знайдено, %: N 8,30; S 9,25. $C_{18}H_{18}N_2O_3S$. Обчислено, %: N 8,18; S 9,36. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,10 (с, 3H, CH_3), 2,50 (с, 3H, CH_3), 3,33 (с, 6H, 2^*OCH_3), 6,86–6,90 (м, 1H, Ar), 7,23–7,28 (м, 1H, Ar), 7,39–7,44 (м, 1H, Ar), 8,71 (с, 1H, CH), 11,95 (с, 1H, NH).

Сполука 11. Вихід 73 %. Т.пл. 280–281 °С. Знайдено, %: N 12,70; S 9,96. $C_{18}H_{19}N_3OS$. Обчислено, %: N 12,91; S 9,85. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J,

Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,20 (с, 3H, CH_3), 2,60 (с, 3H, CH_3), 3,01 (с, 6H, $N(CH_3)_2$), 6,77–6,89 (м, 2H, Ar), 7,39–7,42 (м, 1H, Ar), 7,95–8,03 (м, 2H, Ar), 8,71 (с, 1H, CH), 12,05 (с, 1H, NH).

Сполука 12. Вихід 80 %. Т.пл. 295 °С. Знайдено, %: N 8,70; S 9,26. $C_{17}H_{16}N_2O_2S$. Обчислено, %: N 8,97; S 10,26. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,14 (с, 3H, CH_3), 2,86 (с, 3H, CH_3), 3,12 (с, 3H, OCH_3), 7,07 (д, 2H, $J = 8,2$ Гц Ar), 7,68–7,77 (м, 2H, Ar), 8,77 (с, 1H, CH), 12,55 (с, 1H, NH).

Сполука 13. Вихід 54 %. Т.пл. 275–276 °С. Знайдено, %: N 7,40; S 8,66. $C_{22}H_{18}N_2O_2S$. Обчислено, %: N 7,48; S 8,56. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,08 (с, 3H, CH_3), 2,54 (с, 3H, CH_3), 7,01–7,08 (м, 2H, Ar), 7,36–7,40 (м, 2H, Ar), 7,43–7,55 (м, 3H, Ar), 7,84–7,90 (м, 2H, Ar), 12,55 (с, 1H, NH).

Сполука 14. Вихід 59 %. Т.пл. 244–245 °С. Знайдено, %: N 11,40; S 8,46. $C_{22}H_{19}N_3OS$. Обчислено, %: N 11,25; S 8,59. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,10 (с, 3H, CH_3), 2,36 (с, 3H, CH_3), 4,46 (с, 1H, NH_2), 6,55–6,60 (м, 2H, Ar), 7,34–7,46 (м, 4H, Ar), 7,72–7,76 (м, 3H, Ar), 11,00 (с, 1H, NH).

Сполука 15. Вихід 78 %. Т.пл. 293–294 °С. Знайдено, %: N 14,20; S 10,80. $C_{15}H_{13}N_3O_2S$. Обчислено, %: N 14,04; S 10,71. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,30 (с, 3H, CH_3),

2,70 (с, 3H CH_3), 7,05–7,12 (м, 1H, Ar), 7,15–7,23 (м, 1H, Ar), 7,35–7,42 (м, 1H, Ar), 7,55–7,59 (м, 1H, Ar), 10,23 (с, 1H, OH), 12,20 (с, 1H, NH).

Сполука 16. Вихід 65 %. Т.пл. 270 °С. Знайдено, %: N 8,40; S 9,76. $C_{17}H_{14}N_2O_3S$. Обчислено, %: N 8,58; S 9,82. Спектр 1H ЯМР δ , м.ч., J, Гц (ДМСО- D_6 , 400 МГц): 2,24 (с, 3H, CH_3), 2,66 (с, 3H, CH_3), 7,55–7,59 (м, 1H, Ar), 7,71–7,75 (м, 1H, Ar), 7,98–8,06 (м, 1H, Ar), 9,42 (с, 1H, CH), 11,20 (с, 1H, NH), 11,72 (с, 1H, COOH).

Висновки. 1. Відновлювальним розщепленням 5,7-диметил-6-фенілазо-3H-тіазоло[4,5-*b*]піридин-2-ону одержано неописаний в літературі 6-аміно-5,7-диметил-3H-тіазоло[4,5-*b*]піридин-2-он – зручний реагент у перетвореннях базової гетероциклічної системи за положенням 6.

2. Вивчалася взаємодія 6-аміно-5,7-диметил-3H-тіазоло[4,5-*b*]піридин-2-ону з ароматичними альдегідами, що дозволило синтезувати серію неописаних у хімічній літературі 6-ариліденамінопохідних зазначеної гетероциклічної системи для фармакологічного скринінгу.

3. Вперше ідентифіковано незначний антиексудативний ефект одержаних сполук, що дає можливість встановлення деяких закономірностей «структура активність» серед похідних тіазоло[4,5-*b*]піридину.

Література

1. Lesyk R. B. 4-Thiazolidones: Centenarian history, current status and perspectives for modern organic and medicinal chemistry / R. B. Lesyk, V. S. Zimenkovsky // *Curent Org. Chem.* – 2004. – № 8. – P. 1547 – 1577.
2. Тіазолідиндіони – новий клас протидіабетичних лікарських засобів / Лесик Р. Б., Владзімірська О. В., Пачовський В. Ю. [та ін.] // *Клінічна фармація.* – 2001. – № 3. – С. 8-12.
3. Barrett G. C. The chemistry of 1,3-thiazolinone-hydroxy-1,3-thiazole systems / G. C. Barrett // *Tetrahedron.* – 1980. – Vol. 36. – P. 2023-2058.
4. Brown F. C. 4-Thiazolidones / F. C. Brown // *Chem. Rev.* – 1961. – Vol. 61, № 3. – P. 463–521.
5. Marzoog S., Synthesis of some new thiazolo[3,2-*a*]pyridines and related heterocyclic systems / S. Marzoog, Al-Thebeiti. // *Il Farmaco.* – 2000. – Vol. 55. – P. 109 – 118.
6. Non-imidazole histamine H_3 ligands. Part III. New 4-propylpiperazines as non-imidazole histamine H_3 -antagonists / K. Walczynski, P. Obbe, Zuiderveld, [et al.] // *European J. of Med. Chem.* – 2005. – Vol. 40. – P.15 – 23.
7. Kulkarni S. S. Design and synthesis of novel heterobiaryl amides as metabotropic glutamate receptor subtype 5 antagonists / S. S. Kulkarni, A. H. Newman // *Bioorg. Med. Chem. Lett.* – 2007. – Vol. 17. – P. 2987–2991.
8. Synthesis and evaluation of 2,7-diamino-thiazolo[4,5-*d*]pyrimidine analogues as anti-tumor epidermal growth factor receptor (EGFR) tyrosine kinase inhibitors / R. Lin, S. G Johnson, P. J. Connolly [et al.] // *Bioorg. Med. Chem. Lett.* – 2009. – Vol. 19. – P. 2333 – 2337.
9. Design, synthesis, and biological activity of novel factor Xa inhibitors: improving metabolic stability by S1 and S4 ligand modification / S. Komoriya, S. Kobayashi, K. Osanai [et al.] // *Bioorg. Med. Chem.* – 2006. – Vol. 14. – P. 1309-1330.
10. Novel and potent adenosine 3',5'-cyclic phosphate phosphodiesterase III inhibitors: thiazolo[4,5-*b*][1,6]naphthyridin-2-ones / B. Singh, E. R. Bacon, G. Y. Leshner [et al.] // *J. Med. Chem.* – 1995. – Vol. 38. – P. 2546–2550.
11. Доклінічні дослідження лікарських засобів / [За ред. О.В.Стефанова]. – К.: Авіцена, 2001. – 528 с.

**СИНТЕЗ И ИЗУЧЕНИЕ АНТИЭКССУДАТИВНОЙ АКТИВНОСТИ
6-АМИНО-5,7-ДИМЕТИЛ-3Н-ТИАЗОЛ[4,5-*b*]ПИРИДИН-2-ОНА
И ЕГО 6-АРИЛИДЕНАМИНОПРОИЗВОДНЫХ**

Т. И. Чабан, В. В. Огурцов, И. Г. Чабан, М. М. Лебяк, И. О. Нектегаев

Львовский национальный медицинский университет имени Данила Галицкого

Резюме: впервые полученный нами 5,7-диметил-6-фенилазо-3Н-тиазол[4,5-*b*]пиридин-2-он (**1**) изучался в реакциях восстановительного расщепления, что привело к получению неопisanного в литературе 6-амино-5,7-диметил-3Н-тиазол[4,5-*b*]пиридин-2-она (**2**) – реагента в преобразованиях базовой гетероциклической системы по положению 6, утилизированного в реакциях конденсации кетонами с образованием серии новых 6-арилиденаминопроизводных. Изучены некоторые аспекты антиэкссудативной активности синтезированных веществ.

Ключевые слова: конденсация, восстановительное расщепление, тиазоло[4,5-*b*]пиридины, антиэкссудативная активность.

SYNTHESIS AND ANTIEXCUDATIVE ACTIVITY OF 6-AMINO-5,7-DIMETHYL-3H-THIAZOLO[4,5-*b*]PYRIDINE-2-ONE AND ITS 6-ARYLIDENE AMINODERIVATIVES

T. I. Chaban, V. V. Ohurtsov, I. H. Chaban, M. M. Lebyak, I. O. Niektiehayev

Lviv National Medical University by Danylo Halytskyi

Summary: new 5,7-dimethyl-6-fenylazo-3H-thiazolo[4,5-*b*]pyridine-2-one (**1**) was studied in the reactions of reductive splitting, leading to a not-mentioned in the scientific literature 6-amino-5,7-dimethyl-3H-thiazolo[4,5-*b*]pyridine-2-one (**2**) obtaining. Further condensation of **2** with aromatic aldehydes allowed to synthesize a raw of 6-arylideneaminoderivatives. Some aspects of antiexcudative activity of the substances were studied.

Key words: condensation, reductive splitting, thiazolo[4,5-*b*]pyridines, antiexcudative activity.