

УДК 547.754.07

СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ И РЕАКЦИОННАЯ СПОСОБНОСТЬ 1-МЕТИЛ-5-АРИЛ-2- АМИНОИМИДАЗОЛОВ

Т.А. СМИРНОВА, П.Б. КУРАПОВ, Е.Л. ВЕТРОВА,
А.Г. БАСС, Н.Л. НАМ

(Кафедра органической химии)

С целью поиска новых физиологически активных соединений, обладающих также рострегулирующей активностью, на растениях синтезирован ряд производных 1-метил-5-арил-2-аминоимидазолов.

Описанные в литературе производные 2-аминоимидазола характеризуются чрезвычайно широким спектром биологической активности. Среди соединений, содержащих 2-аминоимидазольный фрагмент, известны препараты, обладающие антипротозойной и антибактериальной [11], антидепрессантной и антигипертензивной [8] активностью, стимулирующие активность ЦНС [10]. Производные 2-аминоимидазола известны как инсектициды, гербициды и регуляторы роста растений [12]. К настоящему времени в литературе описано несколько способов получения 1-замещенных 2-аминоимидазолов [3, 5, 6, 9, 13]. С целью получения новых биологически активных соединений, содержащих 2-

аминоимидазольный фрагмент, нами был осуществлен оригинальный синтез ряда 1-метил-2-амино-5-арилимидазолов (VI) исходя из 2-аминопиримидина (I) по схеме 1.

Рециклизация соли (II) [4] приводит с высоким выходом к 2-(N-метиламино)пиримидину (III), получение которого обычным алкилированием практически невозможно.

а-Фенацилбромиды алкилируют 2-(N-метиламино)пиримидин по одному из циклических атомов азота с образованием четвертичных аммониевых солей (IV), которые под действием ортофосфорной и хлорной кислот гладко и с высокими выходами (85-97%) циклизуются в имидазопиримидиний перхлораты (V). Под действием нуклеофилов (в частности

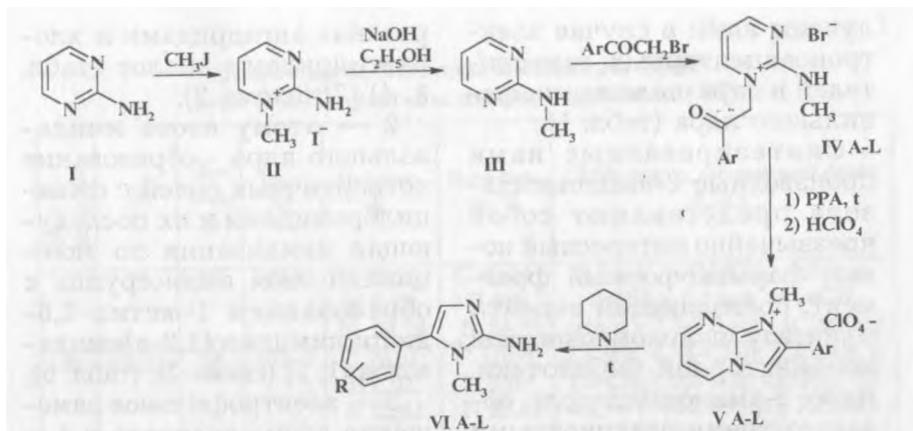


Схема 1

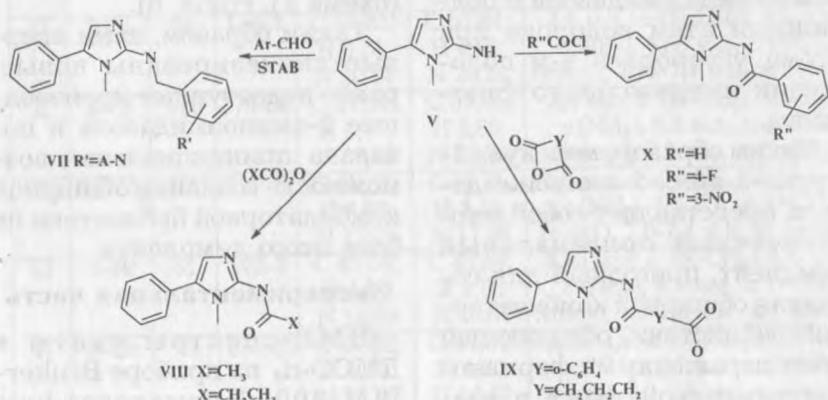


Схема 2

пиперидина) пиримидиновый цикл перхлоратов (V) раскрывается с образованием 1-метил-5-арил-2-аминоимидазолов (VI).

Используя различные феноцилбромиды, мы синтезировали 12 1-метил-5-арил-2-аминоимидазолов (VI A-L), структура которых была под-

тверждена спектрами ПМР и данными элементного анализа. Следует отметить, что наличие заместителей в мета-положении фенольного ядра исходного феноцилбромидов существенно снижает общий выход как реакции циклизации, так и раскрытия цикла. Наилучшие результаты по-

лучены нами в случае электрооакцепторных заместителей в пара-положении фенольного ядра (табл. 1).

Синтезированные нами производные 2-аминоимидазола представляют собой чрезвычайно интересный новый фармакофорный фрагмент, позволяющий перейти к синтезу многокомпонентной комбинаторной библиотеки. Ядро 2-аминоимидазола обладает тремя реакционными центрами: атом азота аминогруппы, атом азота пиридинового типа имидазола и подвижный атом водорода при атоме углерода в 4-м положении имидазольного фрагмента.

Таким образом, молекула 1-метил-5-арил-2-аминоимидазола представляет собой многоточечный оригинальный темплейт, пригодный для создания обширной комбинаторной библиотеки, обладающей ярко выраженными фармакофорными свойствами и возможной росторегулирующей активностью на растениях.

С целью разработки методов синтеза такой комбинаторной библиотеки нами была детально изучена реакционная способность 2-аминоимидазольного ядра по трем основным реакционным центрам:

1 — аминогруппе - реакции восстановительного аминирования (табл. 2), ацили-

рование ангидридами и хлорангидридами кислот (табл. 3, 4) [7] (схема 2);

2 — атому азота имидазольного ядра - образование четвертичных солей с фенацилбромидами и их последующая циклизация по экзоциклической аминогруппе с образованием 1-метил-2,6-диарилимидазо[1,2-а]имидазолов [1, 2] (схема 3), (табл. 5);

3 — электрофильное замещение атома водорода в 4-м положении имидазольного кольца (реакция Манниха) (схема 4), (табл. 6).

Таким образом, нами впервые синтезированы новые, ранее недоступные производные 2-аминоимидазола и показана принципиальная возможность создания обширной комбинаторной библиотеки на базе этого темплейта.

Экспериментальная часть

ПМР-спектры сняты в ДМСО-сЦ на приборе Bruker-WM-400. Хроматографию проводили на пластинках Merck Silica gel 60 F 254. Проявление УФ-254 нм и раствором нингидрина.

1-Метил-2-аминопиримидиний йодид (II). 100 г (1.051 моль) 2-аминопиримидина (I) растворили при нагревании в 1600 мл смеси бензола и ацетона (1:1 об.). К полученному раствору при постоянном перемешивании добавили 746.5 г (329 мл) (5.257 моль) йодис-

**Константы, выходы и спектры ПМР
1-метил-5-арил-2-аминоимдазолов (VI)**

Соеди- нение VI	R	Вы- ход, %	Т.пл., °С	Найдено, %	Вычисле- но, %	ПМР спектр, химический сдвиг, δ , мд
A	H	98	<300	C 69,29; H 6,25; N 24,24	C 69,34; H 6,4; N 24,26	3,4 мд, с (N-CH ₃), 5,5 мд, с (NH ₂), 6,4 мд, с (=CH, гетер.), 7,3-7,8 мд, м (аром)
B	4-CH ₃	96	175-7	C 70,51; H 6,92; N 22,41	C 70,56; H 7,00; N 22,44	2,3 мд, с (4-CH ₃), 3,35 мд, с (N-CH ₃), 5,2 мд, с (NH ₂), 6,4 мд, с (=CH, гетер.), 7,15 мд, кв (аром)
C	4-F	98,5	205-8	C 62,74; H 5,08; N 21,95	C 62,82; H 5,27; N 21,98	3,3 мд, с (N-CH ₃), 5,45 мд, с (NH ₂), 6,5 мд, с (=CH, гетер.), 7,1-7,5 мд, дт (аром)
D	3-Cl	68	145-7	C 57,83; H 5,04; N 20,17	C 57,84; H 4,85; N 20,24	3,4 мд, с (N-CH ₃), 5,4 мд, с (NH ₂), 6,55 мд, с (=CH, гетер.), 7,15-7,4 мд, м (аром)
E	4-Cl	100	179-81	C 57,54; H 4,77; N 20,35	C 57,84; H 4,85; N 20,24	3,4 мд, с (N-CH ₃), 5,3 мд, с (NH ₂), 6,5 мд, с (=CH, гетер.), 7,3 мд, д (аром)
F	3,4-Cl ₂	62	137-9	C 49,62; H 3,82; N 17,29	C 49,61; H 3,75; N 17,36	3,3 мд, с (N-CH ₃), 5,45 мд, с (NH ₂), 6,5 мд, с (=CH, гетер.), 7,0-7,4 мд, м (аром)
G	4-Br	81	192-3	C 47,34; H 4,30; N 16,69	C 47,64; H 4,00; N 16,67	3,35 мд, с (N-CH ₃), 5,5 мд, с (NH ₂), 6,5 мд, с (=CH, гетер.), 7,2-7,5 мд, дд (аром)
H	3-Br	77	138-40	C 47,62; H 4,22; N 16,66	C 47,64; H 4,00; N 16,67	3,35 мд, с (N-CH ₃), 5,6 мд, с (NH ₂), 6,5 мд, с (=CH, гетер.), 7,2-7,5 мд, м (аром)
I	3-NO ₂	90	187-8	C 54,98; H 4,77; N 25,61	C 55,04; H 4,62; N 25,68	3,4 мд, с (N-CH ₃), 5,7 мд, с (NH ₂), 6,8 мд, с (=CH, гетер.), 7,6-8,15 мд, м (аром)
J	4- OCH ₃	94	205-7	C 64,94; H 6,64; N 20,64	C 65,01; H 6,45; N 20,67	3,3 мд, с (N-CH ₃), 4,0 мд, с (OCH ₃), 5,2 мд, с (NH ₂), 6,35 мд, с (=CH, гетер.), 6,85-7,25 мд, дд (аром)
K	3,4- OCH ₂ O	82	157-8	C 60,81; H 5,29; N 19,27	C 60,82; H 5,10; N 19,34	3,3 мд, с (N-CH ₃), 5,15 мд, с (OCH ₂ O), 6,0 мд, с (NH ₂), 6,4 мд, с (=CH, гетер.), 6,7- 6,9 мд, м (аром)
L	4-Ph	59	280-5	C 77,04; H 6,21; N 16,77	C 77,08; H 6,06; N 16,85	3,4 мд, с (N-CH ₃), 5,5 мд, с (NH ₂), 6,6 мд, с (=CH, гетер.), 7,3-7,75 мд, дд+м (аром)

Выходы и спектры ПМР продуктов реакции восстановительного аминирования 5-(3'-бромфенил)-2-аминоимидзола

Соедине- ние VII	R	R'	Вы- ход, %	ПМР спектр, химический сдвиг, δ , мд
A	3-Br	4-Br	51	3,45 мд, с (N-CH ₃), 4,54 мд, с (CH ₂ NH), 6,98 мд, с (=CH, гетер.), 7,25-7,65 мд, м (аром.), 8,08 мд, с (NH)
B	3-Br	2,4-di-OCH ₃	55	3,45 мд, с (N-CH ₃), 3,78 мд, с (OCH ₃), 3,82 мд, с (OCH ₃), 4,45 мд, с (CH ₂ NH), 7,05 мд, с (=CH, гетер.), 6,35-6,55 мд, м (аром.), 6,85-7,65 мд, м (аром.), 7,82 мд, с (NH)
C	3-Br	2-OH, 5-Cl	52	3,45 мд, с (N-CH ₃), 4,35 мд, с (CH ₂ NH), 6,88 мд, с (=CH, гетер.), 6,75-7,6 мд, м (аром.), 8,13 д, с (NH)
D	3-Br	3,4,5,-tri-OCH ₃	58	3,45 мд, с (N-CH ₃), 3,68 мд, с (OCH ₃), 3,82 мд, с (2OCH ₃), 4,47 мд, с (CH ₂ NH), 7,0 мд, с (=CH, гетер.), 6,76 мд, с (2CH, аром.), 7,35-7,65 мд, м (аром.), 7,94 мд, с (NH)
E	3-Br	2-F, 6-Br	53	3,45 мд, с (N-CH ₃), 4,53 мд, с (CH ₂ NH), 6,82 мд, с (=CH, гетер.), 7,05-7,7 мд, м (аром.), 7,95 д, с (NH)
F	3-Br	3-Cl	60	3,45 мд, с (N-CH ₃), 4,45 мд, с (CH ₂ NH), 6,95 мд, с (=CH, гетер.), 7,2-7,65 мд, м (аром.), 7,95 д, с (NH)
G	3-Br	2-OCH ₃	54	3,45 мд, с (N-CH ₃), 3,85 мд, с (OCH ₃), 4,52 мд, с (CH ₂ NH), 6,95 мд, с (=CH, гетер.), 7,2-7,65 мд, м (аром.)
H	3-Br	3-OBz	62	3,45 мд, с (N-CH ₃), 4,52 мд, с (CH ₂ NH), 5,08 мд, с (CH ₂ O), 7,1 мд, с (=CH, гетер.), 6,8-7,6 мд, м (аром.), 7,8 мд, с (NH)
I	3-Br	2-OH	55	3,42 мд, с (N-CH ₃), 4,35 мд, с (CH ₂ NH), 6,96 мд, с (=CH, гетер.), 6,7-7,6 мд, м (аром.), 7,95 д, с (NH)
J	3-Br	3,4-di-OCH ₃	54	3,45 мд, с (N-CH ₃), 3,75 мд, с (OCH ₃), 3,79 мд, с (OCH ₃), 4,45 мд, с (CH ₂ NH), 7,05 мд, с (=CH, гетер.), 7,3-7,6 мд, м (аром.), 7,82 мд, с (NH)
K	3-Br	4-Cl	58	3,45 мд, с (N-CH ₃), 4,55 мд, с (CH ₂ NH), 6,92 мд, с (=CH, гетер.), 7,25-7,65 мд, м (аром.), 7,82 мд, с (NH)
L	3-Br	4-OBz, 3-OCH ₃	47	3,45 мд, с (N-CH ₃), 3,73 мд, с (OCH ₃), 4,46 мд, с (CH ₂ NH), 6,92 мд, с (=CH, гетер.), 6,72-7,15 мд, м (аром.), 7,25-7,65 мд, м (аром.), 7,78 мд, с (NH)
M	3-Br	2-OH, 3-OCH ₃	58	3,43 мд, с (N-CH ₃), 3,7 мд, с (OCH ₃), 4,45 мд, с (CH ₂ NH), 6,93 мд, с (=CH, гетер.), 6,65-7,6 мд, м (аром.), 7,73 мд, с (NH)
N	3-Br	2-Cl	51	3,48 мд, с (N-CH ₃), 4,62 мд, с (CH ₂ NH), 6,87 мд, с (=CH, гетер.), 7,25-7,6 мд, м (аром.), 7,82 мд, с (NH)

Таблица 3

Константы, выходы и спектры ПМР продуктов реакции ацилирования ангидридами кислот 1-метил-5-фенил-2-аминоимидазола (V)

Соединение	X, Y	Выход, %	Т.пл., °С	ПМР спектр, химический сдвиг, δ , м.д.
VIII	CH ₃	80	200-1	2,1 м.д., с. (COCH ₃), 3,4 м.д., с. (N-CH ₃), 6,8 м.д., с. (=CH, гетер.), 7,25-7,45 м.д., м. (аром.), 10,1 м.д., с. (NH)
VIII	CH ₂ CH ₃	74	174-5	1,15 м.д., т. (COCH ₂ CH ₃), 2,35 м.д., кв. (COCH ₂ CH ₃), 3,4 м.д., с. (N-CH ₃), 6,8 м.д., с. (=CH, гетер.), 7,3-7,5 м.д., м. (аром.), 10,1 м.д., с. (NH)
IX	o-C ₆ H ₄	57	188 с разл.	3,6 м.д., с. (N-CH ₃), 6,9 м.д., с. (=CH, гетер.), 7,3-8,1 м.д., м. (аром.), 10,3 м.д., с. (NH), 12-14 м.д., у.с. (COOH)
IX	(CH ₂) ₃	84	180-2	2,4 м.д., т. (CH ₂ COOH), 2,9 м.д., м. ((CH ₂) ₃), 3,5 м.д., с. (N-CH ₃), 7,0 м.д., с. (=CH, гетер.), 7,2-7,5 м.д., м. (аром.), 11,8 м.д., с. (NH), 14-15 м.д., у.с. (COOH)

Таблица 4

Константы, выходы и спектры ПМР продуктов реакции ацилирования хлорангидридами кислот 1-метил-5-фенил-2-аминоимидазола (X)

R''	Выход, %	Т.пл., °С	ПМР спектр, химический сдвиг, δ , м.д.
H	87	167	3,6 м.д., с. (N-CH ₃), 6,9 м.д., с. (=CH, гетер.), 7,3-8,3 м.д., м. (аром.), 12,5 м.д., с. (NH)
4-F	70	170	3,2 м.д., с. (N-CH ₃), 6,8 м.д., с. (=CH, гетер.), 7,0-8,6 м.д., м. (аром.), 12,4 м.д., с. (NH)
3-NO ₂	70	203	3,7 м.д., с. (N-CH ₃), 6,9 м.д., с. (=CH, гетер.), 7,35-9,0 м.д., м. (аром.), 12,5 м.д., с. (NH)

Таблица 5

Константы, выходы и спектры ПМР продуктов реакции циклизации 1-метил-5-(3,4-дихлорфенил)-2-аминоимидазола (XIII)

R'''	Выход, %	Т.пл., °С	ПМР спектр, химический сдвиг, δ , м.д.
H	81	175-7	3,7 м.д., с. (N-CH ₃), 7,43 м.д., с. (=C(3)H, гетер.), 7,54 м.д., с. (=C(5)H, гетер.), 7,72-7,81 м.д., м. (аром.)
3-Cl	79	181-2	3,68 м.д., с. (N-CH ₃), 7,45 м.д., с. (=C(3)H, гетер.), 7,63 м.д., с. (=C(5)H, гетер.), 7,1-7,85 м.д., м. (аром.)
4-Cl	87	198-9	3,68 м.д., с. (N-CH ₃), 7,44 м.д., с. (=C(3)H, гетер.), 7,58 м.д., с. (=C(5)H, гетер.), 7,25-7,85 м.д., м. (аром.)
4-F	85	183-4	3,68 м.д., с. (N-CH ₃), 7,43 м.д., с. (=C(3)H, гетер.), 7,52 м.д., с. (=C(5)H, гетер.), 7,0-7,1 м.д., т. (аром.), 7,65-7,85 м.д., м. (аром.)

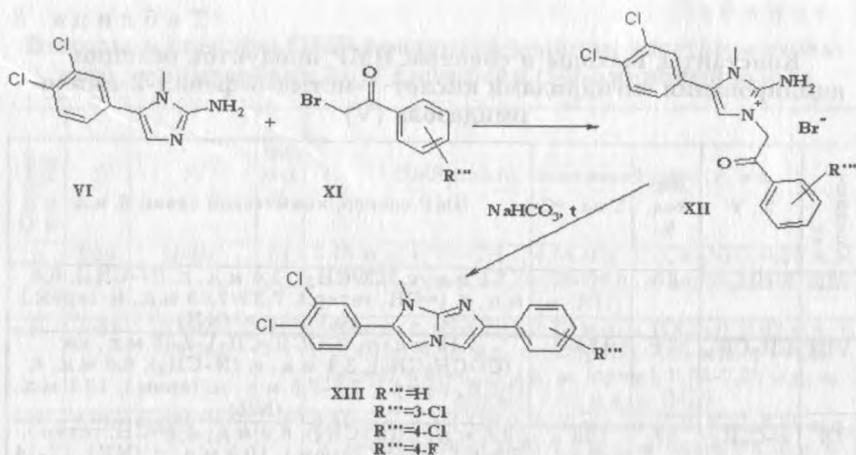


Схема 3

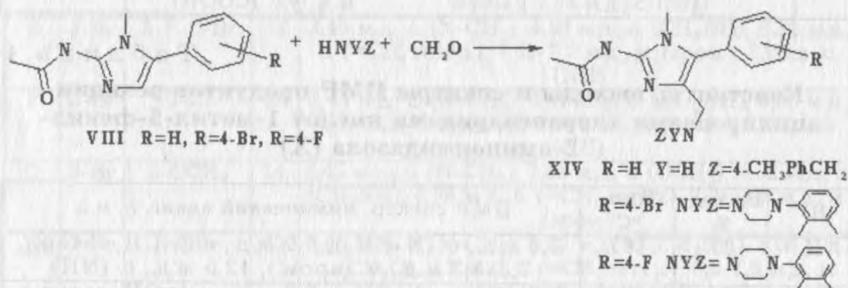


Схема 4

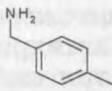
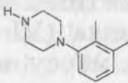
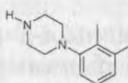
того метила. Реакционную смесь оставили при комнатной температуре на 48 ч. Выпавший осадок отфильтровали, промыли бензолом и высушили. Получено 234,74 г (97%) продукта.

2-М этиламинопиримидин (III). Смесь 100 г (0.42 моль) 1-метил-2-аминометилпиримидиний йодида (II) и 39 г (0.98 моль) NaOH кипятили в 100 мл этанола 48 ч. Раствори-

тель упарили, сухой остаток экстрагировали диэтиловым эфиром. Эфир упарили. Получено 45г (98 %) продукта.

2-Аминометил-2-фенацилпиримидиний бромид (IV). 16.7 г (0.153 моль) 2-метиламинопиримидина (III) и 30.4 г (0.153 моль) 2'-бромацетофенона в ацетонитриле кипятили 48 ч при перемешивании. Реакционную массу охладили, выпавший оса-

**Выходы и спектры ПМР продуктов реакции Манниха
1-метил-5-арил-2-аминоимдазола (XIV)**

R	HNYZ	Выход, %	ПМР спектр, химический сдвиг, δ , м.д.
H		26	1,9 м.д., с. (CH ₃ , аром.), 2,1 м.д., с. (CH ₃ CO), 2,35 м.д., с. (N-CH ₃), 3,42 м.д., с. (CH ₂ N=), 3,82 м.д., с. (CH ₂ , аром.), 6,85 м.д., с. (NH), 6,95-7,95 м.д., м. (аром.)
4-Br		57	2,05 м.д., с. (CH ₃ CO), 2,15 м.д., с. (CH ₃ , аром.), 2,25 м.д., с. (CH ₃ , аром.), 2,65-3,25 м.д., м. (пиперазин), 3,42 м.д., с. (N-CH ₃), 3,52 м.д., с. (CH ₂ N=), 6,85 м.д., с. (NH), 6,75-7,05 м.д., м. (аром.), 7,35-7,55 м.д., д.д. (аром.)
4-F		51	2,08 м.д., с. (CH ₃ CO), 2,15 м.д., с. (CH ₃ , аром.), 2,23 м.д., с. (CH ₃ , аром.), 2,6-3,15 м.д., м. (пиперазин), 3,32 м.д., с. (CH ₂ N=), 3,4 м.д., с. (N-CH ₃), 6,8 м.д., с. (NH), 6,85-7,05 м.д., м. (аром.), 7,15-7,45 м.д., д.т. (аром.)

док отфильтровали, промыли ацетонитрилом и высушили на воздухе. Получено 40 г (85 %) продукта.

1-Метил-2-арилимидазо-пиримидиний перхлорат (V). (Общая методика). 40 г 2-аминометил-N-фенацил-пиримидиний бромид (IV) растворили в 100 мл полифосфорной кислоты и нагрели до температуры 170°C. Раствор охладили и разбавили 4-кратным объемом воды. К полученному раствору медленно по каплям прилили 1.5 экв. 70 % HClO₄. Выпавший при стоянии осадок отфильтровали, промыли водой и высушили

на воздухе. Получено 35.2 г (87.6 %) продукта.

1-Метил-2-амино-5-арилимидазолы (VIА-L, табл. 1) (Общая методика). 35.2 г (0.114 моль) перхлората (V) и 48.4 г (0.569 моль) пиперидина в 100 мл ацетонитрила кипятили 3 ч. После охлаждения выпавший осадок отфильтровали, промыли ацетонитрилом и высушили на воздухе.

Синтез 1-метил-2-(R-замещенных бензиламино)-5-(3-хлорфенил)имидазола (VII А-N, табл. 2) (Общая методика). К 0.001 моль 2-амино-5-фенилимидазола, раство-

ренному в 10 мл дихлорэтана, добавили 0.0012 моль альдегида и перемешивали при комнатной температуре 1 сутки. К полученному раствору прибавили 0.0015 моль триацетоксиборгидрида натрия и перемешивали еще 3 дня. К реакционной смеси добавили 10 мл раствора карбоната калия и оставили при комнатной температуре. Через 3 ч проэкстрагировали хлористым метиленом (50 мл), отделили органический слой. Растворитель упарили. Соединения (VII) очищали методом колоночной хроматографии. Элюировали альдегиды хлороформом, основной продукт - системой растворителей хлороформ: метанол (10:1). Растворитель упарили. Вещества растворили в минимальном количестве хлористого метилена, добавили 0.5 ммоль щавелевой кислоты, растворенной в изопропиловом спирте. Выпавший при стоянии осадок отфильтровали, промыли эфиром и высушили на воздухе. Соединения (VII A-N) получены в виде оксалатов.

Синтез 1-метил-2-(N-ациламино)-5-фенилимидазолов (VIII, табл. 3). (Общая методика). К 0.002 моль 1-метил-2-амино-5-фенилимидазола при перемешивании прикапали раствор 0.002 моль ангидрида в диоксане. Реакционную массу выдержали

при комнатной температуре сутки. Выпавший осадок отфильтровали, промыли эфиром и сушили на воздухе.

Ацилирование 1-метил-2-амино - 5 - фенилимидазола ангидридами кислот (IX, табл. 3). (Общая методика). К 0.002 моль ангидрида, растворенному при кипении в 10 мл бензола, порциями при перемешивании добавляли 0.002 моль 1-метил-2-амино-5-арилимидазола (VI R=H). Реакционную массу выдержали при комнатной температуре сутки. Выпавший осадок отфильтровали, промыли бензолом.

Синтез 1-метил-2-(N-бензоиламино)-5-фенилимидазолов (X, табл. 4). (Общая методика). К 0.002 моль хлорангидрида, растворенному в 7 мл диоксана, прикапали 0.002 моль триэтиламина. Выдержали 5 мин. Порциями при перемешивании добавляли 0.002 моль 1-метил-2-амино-5-арилимидазола (VI R=H). Выдержали при комнатной температуре сутки. Реакционную массу вылили в воду, выпавший осадок отфильтровали, промыли водой, сушили на воздухе.

Производные имидазо[1,2-a]имидазола (XIII, табл. 5). (Обитая методика). 0.001 моль 1-метил-2-амино-5-арилимидазола (VI R=3,4-diCl) прикапали порциями к 0.001 моль фенацилбромада, растворен-

ному в 10 мл диоксана. Выдержали при комнатной температуре сутки. Выпавший осадок отфильтровали, промыли диоксаном. Осадок растворяли в водно-спиртовом растворе (1:1) при кипении и небольшими порциями присыпали гидрокарбонат натрия до рН 9. Реакционную массу охладили, выпавший осадок отфильтровали, промыли водой, сушили на воздухе.

Синтез 1-метил-2-(N-ациламино)-4-(N-алкиламинометил)-5-фенилимидазолов (XIV, табл. 4) (Общая методика). 0.001 моль 1-метил-2-ациламино-5-арилимидазола (VIII R=H X=CH₃) порциями при перемешивании добавляли к смеси 0.0011 моль формалина и 0.001 моль амина в 5 мл уксусной кислоты. Реакционную массу выдержали при комнатной температуре 12 ч. Вылили в воду, обрабатывали гидрокарбонатом натрия (до прекращения выделения газа). Упарили на роторном испарителе. Полученное масло смешали с водой и тщательно перемешали. Воду декантировали (операцию повторили 3 раза). Получены продукты в виде масел.

ЛИТЕРАТУРА

1. *Паталаха Н.С., Куратов П.Б. и др.* - Изв. ТСХА, 1983, вып. 5, с.145-146. —
2. *Прийменко Б.А., Кочергин П.М.* - ХГС, 1971, № 9, с. 1243-1247. — 3. *Прийменко Б.А., Кочергин П.М.* - ХГС, 1971, № 9, с. 1248-1251. — 4. *Сигитулин Р.С., Кост А.Н.* - ЖорХ, 1980, т. 16, № 3, с. 658-669. — 5. *Тептое Б.А., Бурякин В.В., Коблик А.В.* - ХГС, 1972, №11, с. 1552-1554. — 6. *Glennon R.A., Rogers M.E., El-Said M.K.* - J. Heterocyclic Chem., 1980, vol. 17, p. 337-340. — 7. *Heinisch G., Reusser W.* - Sci. Phar., 1974, vol. 42, p. 19-33. — 8. *Jen T., Hoesven H.V., Groves W. a. o.* - J. Med. Chem., 1975, vol. 18, p. 90-99. — 9. *Lawson A.* - J. Chem. Soc., 1956, pp. 307-310. — 10. *Maffrand J.P., Pereillo J.M. a. o.* - Eur. J. Med. Chem.- Chim. Ther., 1978, vol. 13, p. 469-474). — 11. *Miller L.F., Bambury R.E.* - J. Med. Chem. 1971, vol. 14, p. 1217-1218. — 12. *Monsanto Co, Japan. Kokai 76 35,430 C. A.* 1976, 85, P138620p. — 13. *Pyl T., Melde S., Beyer H.* - Ann., 1963, Bd. 663, S. 108-112.

SUMMARY

In order to find new physiologically active compound with plant growth regulation activity a number of derivatives of 1-methyl-5-phenyl-2-aminoimidazole were synthesized.