

Synthese von 4-Hydroxy-3-(2-imidazolyl)-cumarinen

(Kurze Mitteilung)

Von

Blanka Bobarević und M. Trkovnik*

Aus dem Laboratorium für Organische Chemie, Chemisches Institut
der Universität Sarajevo, Jugoslawien

(Eingegangen am 14. Februar 1972)

Da in 3-Stellung substituierte 4-Hydroxy-cumarine pharmakologisch interessante Verbindungen sind¹, haben wir die Synthese einiger 4-Hydroxy-3-(2-imidazolyl)-cumarine nach der Methode von *Radziszewsky*² durchgeführt. Als Ausgangssubstanz diente das 3-Formyl-4-hydroxy-cumarin (**1**), welches mit Benzil und dessen Derivaten (**2**) in Gegenwart von Ammonacetat in siedendem Eisessig zu den Imidazolen **3** (siehe Tab. 1) kondensiert wird.

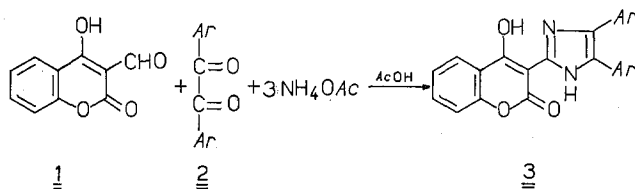


Tabelle 1. 4-Hydroxy-3-(2-imidazolyl)-cumarine

Ar	Ausb., °C	Schmp., °C	Formel **
C_6H_5	93	229	$\text{C}_{24}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{O}_3$
$4\text{-Cl-C}_6\text{H}_4$	81	225—226	$\text{C}_{24}\text{H}_{14}\text{N}_2\text{O}_3\text{Cl}_2$
$2\text{-OH-C}_6\text{H}_4$	85	196	$\text{C}_{24}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{O}_5$
$3\text{-OH-C}_6\text{H}_4$	87	225	$\text{C}_{24}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{O}_5$
$4\text{-OH-C}_6\text{H}_4$	82	214	$\text{C}_{24}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{O}_5$
$2\text{-OH-5-Cl-C}_6\text{H}_3$	78	211	$\text{C}_{24}\text{H}_{14}\text{N}_2\text{O}_5\text{Cl}_2$
$4\text{-OCH}_3\text{-C}_6\text{H}_4$	89	234	$\text{C}_{26}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_5$
$4\text{-CH}_3\text{-C}_6\text{H}_4$	85	262	$\text{C}_{26}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_3$
$3\text{-CH}_3\text{-C}_6\text{H}_4$	84	230	$\text{C}_{26}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_3$
$2\text{-CH}_3\text{-C}_6\text{H}_4$	87	253	$\text{C}_{26}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_3$

* Herrn Prof. Dr. E. Ziegler zum 60. Geburtstag gewidmet.

** Alle angegebenen Formeln wurden durch CH- und N-Bestimmung gesichert.

Allgemeines Verfahren zur Synthese der 4-Hydroxy-3-(2-imidazolyl)-cumarine (3)

0,01 Mol des entsprechenden Benzils (2), 0,01 Mol 3-Formyl-4-hydroxy-cumarin³ (1) und 0,03 Mol Ammonacetat werden in 10 ml Eisessig 2 Stdn. unter Rückfluß erhitzt. Nach dem Erkalten werden die ausgeschiedenen Kristalle abfiltriert und aus Äthanol umkristallisiert.

Literatur

¹ Eine große Anzahl von in 3-Stellung substit. 4-Hydroxy-cumarinen finden als orale Antikoagulation oder Rodenticide Verwendung: *L. Reppel*, Pharmazie **18**, 381 (1963); *E. Renk* und *W. G. Stoll*, Progr. Drug Res. **1968** (11), 226.

² *K. Hofmann*, Imidazole and its Derivatives, S. 33 (*A. Weissberger*, Hrsg.), New York: Interscience. 1953.

³ *E. Ziegler* und *H. Maier*, Mh. Chem. **89**, 787 (1958); *I. S. Checchi*, Gazz. chim. ital. **90**, 440 (1960).