

Experimenteller Teil

¹H-NMR-Spektren: Bruker WH-90 mit 8k/4k Datenspeicher, Pulsbreite 1,2 μ sec, 2proz. Lös., 50 scans, $t = 29^\circ$, TMS = 0 δ (ppm).

(Eingegangen am 30. August 1977)

Anschrift: Dr. G. Lambrecht, Pharmakologie f. Naturwissenschaftler der Universität, Robert-Mayer-Straße 7/9, 6000 Frankfurt/M. [KPh 114]

Volker v. Weissenborn, Horst H. Brandt und Karl E. Schulte

Die Verwendung von Lewasorb AC 10/H zur Darstellung von Tetrahydrochinazolinonen

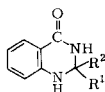
Tetrahydrochinazolinone werden im allgemeinen durch Umsetzung von Anthranilsäureamid mit Aldehyden bzw. Ketonen in Gegenwart von HCl-Gas in Äthanol dargestellt¹⁾. Aus den dabei erhaltenen Hydrochloriden lassen sich mit Ammoniak die freien Basen gewinnen.

Wesentlich einfacher gestaltet sich diese Kondensation bei der Verwendung des Ionenaustauschers Lewasorb AC 10/H⁺; die Umsetzung verläuft mit Aldehyden und Ketonen in befriedigenden Ausbeuten. In Tab. 1 sind drei bisher nicht beschriebene Tetrahydrochinazolinon-Derivate aufgeführt; im Oedemtest an der Rattenpfote zeigten die Substanzen keine dosisabhängigen entzündungshemmenden Eigenschaften⁺⁺⁾.

+ Hersteller: BAYER AG, Leverkusen.

++ Die Autoren danken auch an dieser Stelle Herrn Dr. *Hofrichter*, Leiter der pharmakologischen Abteilung der Firma Klinge Pharma GmbH, München, für die Überlassung der Testergebnisse, die Teil einer umfangreichen Testreihe sind.

1 W. Braun und K. Köberle D.R.P. 672493 (1936); ref. C. A. 33, 4051,8 (1939); J. R. Feldmann u. E. C. Wagner, J. Org. Chem. 7, 31 (1942); H. C. Carrington, J. Chem. Soc. 1955, 2527; T. A. K. Smith und H. Stephen, Tetrahedron 1, 38 (1957); ref. C. A. 51, 13869 (1957); H. Böhme und H. Böing, Arch. Pharm. (Weinheim) 293, 1011 (1960).

Tabelle 1: Die dargestellten Tetrahydrochinazolinone

R ¹	R ²	Ausbeute %	Schmp. °	Summenformel	Ber. Gef.	Analyse	
					C	H	N
H		62.6	208–211	C ₁₆ H ₁₇ N ₃ O	71,88 71,79	6,41 6,48	15,72 15,84
CH ₃	-CH ₂ -C ₆ H ₅	61.4	146–148 u. 236–238	C ₁₆ H ₁₆ N ₂ O	76,16 76,16	6,39 6,32	11,0 11,79
H		54.7	195–197 u. 260–264	C ₁₉ H ₁₈ N ₄ O ₂	68,25 68,07	5,43 5,43	16,76 16,72

Experimenteller Teil

20 mmol Anthranilsäureamid, 30 mmol Aldehyd bzw. Keton und 3 g Lewasorb AC 10/H werden mit 80 ml Äthanol 8 h unter Rühren und Rückfluß erhitzt. Nach beendeter Reaktion wird der Katalysator abfiltriert und das Filtrat i. Vak. zur Trockne eingedampft. Der Rückstand wird aus Äthanol oder Acetonitril umkristallisiert.

(Eingegangen am 2. September 1977)

Anschrift: Prof. Dr. Dr. h. c. K. E. Schulte, Institut für Pharmazeutische Chemie, Hittorfstr. 58–62, 44 Münster/W.

[KPh 115]

Hans-Gerd Lennartz⁺ und Walter Schunack

Imidazolsynthesen, 13. Mitt.¹⁾

Synthese 5(4)-alkylsubstituierter 4(5)-Brommethyl-imidazole

5(4)-aliphatisch substituierte 4(5)-Brommethyl-imidazole **6** sowie ihre Synthesestufen, die entsprechenden 4(5)-Methoxymethyl-imidazole **5** stellen geeignete Ausgangsprodukte für die Synthese Histamin H₂-Rezeptor wirksamer Substanzen dar.

⁺ Teilergebnisse der zukünftigen Dissertation H.-G. Lennartz, Mainz.

1 12. Mitt.: V. Stoeck und W. Schunack, Arch. Pharm. (Weinheim) 310, 677 (1977).