

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.

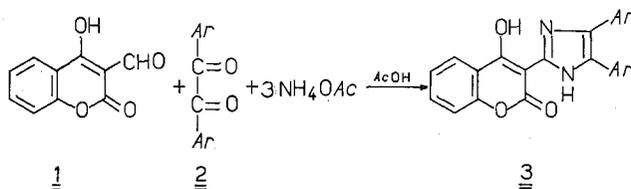


Tabelle 1. 4-Hydroxy-3-(2-imidazolyl)-cumarine

Ar	Ausb., °C	Schmp., °C	Formel**
C ₆ H ₅	93	229	C ₂₄ H ₁₆ N ₂ O ₃
4-Cl—C ₆ H ₄	81	225—226	C ₂₄ H ₁₄ N ₂ O ₃ Cl ₂
2-OH—C ₆ H ₄	85	196	C ₂₄ H ₁₆ N ₂ O ₅
3-OH—C ₆ H ₄	87	225	C ₂₄ H ₁₆ N ₂ O ₅
4-OH—C ₆ H ₄	82	214	C ₂₄ H ₁₆ N ₂ O ₅
2-OH-5-Cl—C ₆ H ₃	78	211	C ₂₄ H ₁₄ N ₂ O ₅ Cl ₂
4-OCH ₃ —C ₆ H ₄	89	234	C ₂₆ H ₂₀ N ₂ O ₅
4-CH ₃ —C ₆ H ₄	85	262	C ₂₆ H ₂₀ N ₂ O ₃
3-CH ₃ —C ₆ H ₄	84	230	C ₂₆ H ₂₀ N ₂ O ₃
2-CH ₃ —C ₆ H ₄	87	253	C ₂₆ H ₂₀ N ₂ 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 Antikoagulationen 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).