

## 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 sind<sup>1</sup>, haben wir die Synthese einiger 4-Hydroxy-3-(2-imidazolyl)-cumarine nach der Methode von *Radziszewsky*<sup>2</sup> 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.

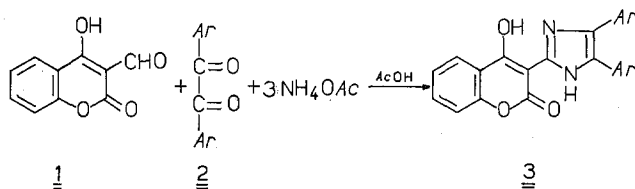


Tabelle 1. 4-Hydroxy-3-(2-imidazolyl)-cumarine

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

\* 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-cumarin<sup>3</sup> (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

<sup>1</sup> 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.

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

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