

7-Трифторметил-5-фенил-2-оксо-(1H)-оксазоло[5,4-b]пиридин (Шв, C₁₃H₇F₃N₂O₂). T_{пл} 255...256 °С (EtOH—H₂O, 2 : 1). ИК спектр: 1630, 1760, 2937, 3200 см⁻¹. Спектр ПМР (DMCO-D₆): 7,44 (3 H, Ph), 7,93 (1 H, =CH-), 8,06 (2 H, Ph), 12,64 м. д. (1 H, NH).

3-(N-Фенилуреидо)-4,6-диметил-2(1H)-пиридон (IVa, C₁₄H₁₄N₂O₂). T_{разл} > 300 °С (DMFA). ИК спектр: 1578, 1640, 3094, 3120, 3195, 3294 см⁻¹. Спектр ПМР (DMCO-D₆): 2,13 (3 H, CH₃), 2,31 (3 H, CH₃), 7,27 (5 H, Ph), 7,73 (1 H, NH), 9,02 (1 H, NH), 12,08 м. д. (1 H, NH).

3-(N-Фенилуреидо)-4-трифторметил-6-фенил-2(1H)-пиридон (IVb, C₁₉H₁₄F₃N₂O₂). T_{пл} 244...246 °С (DMFA—EtOH—H₂O, 1 : 1 : 1). ИК спектр: 1556, 1600, 1638, 2960, 3064, 3268 см⁻¹. Спектр ПМР (DMCO-D₆): 6,67...7,50 (9 H, 2Ph, =CH-), 7,86 (2 H, Ph), 8,00 (1 H, NH), 9,11 (1 H, NH), 12,53 м. д. (1 H, NH).

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Singh B., Leshner G. Y. // J. Heterocycl. Chem. — 1991. — Vol. 28. — P. 933.
2. Singh B., Bacon E. R., Robinson Sh., Fritz R. K., Leshner G. Y., Kumar V., Dority J. A., Reuman M., Kuo G. H., Eissenstat M. A., Pagani E. D., Bode D. C., Bentley R. G., Connell M. J., Hamel L. T., Silver P. J. // J. Med. Chem. — 1994. — Vol. 37. — P. 248.
3. Flouzat C., Blanchet M., Guillaumet G. // Tetrah. Lett. — 1992. — Vol. 33. — P. 4571.
4. Юре М. В., Беляков С. В., Гудринице Э. Ю., Блейделис Я. Я. // Изв. АН ЛатвССР. Сер. хим. — 1987. — № 5. — С. 627.
5. А. с. 1704417 СССР / Гудринице Э. Ю., Лидак М. Ю., Юре М. В., Владыко Г. В., Бореко Е. И., Вотяков В. И. // Б. И. — 1991.
6. Graebe C., Rostovzeff S. // Ber. — 1902. — Bd 35. — S. 2747.
7. Гудринице Э. Ю., Гутцайт А. В., Беляков С. В. // Изв. АН ЛатвССР. Сер. хим. — 1984. — № 5. — С. 611.
8. Плуке И. Я., Карклина А. Х., Гудринице Э. Ю., Пелчер И. О., Петрова М. В. // Изв. АН ЛатвССР. Сер. хим. — 1985. — № 2. — С. 200.

Э. Гудринице, М. Юре, П. Пасторс,
А. Карклина, Э. Палитис

Рижский технический университет,
Riga LV-1658

Поступило в редакцию 06.01.95

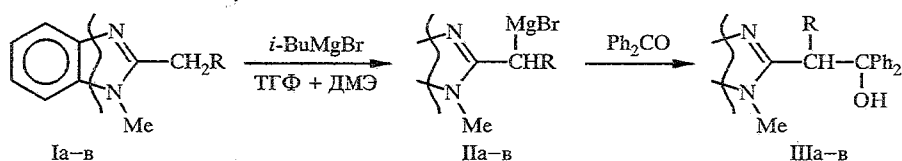
ХГС. — 1995. — № 2. — С. 271.

МАГНИЙОРГАНИЧЕСКИЕ СОЕДИНЕНИЯ 1-МЕТИЛ-2-АЛКИЛБЕНЗИМИДАЗОЛОВ

Известно, что 1-метил-2-*трет*-бутилбензимидазол при действии фениллития присоединяет его по циклической связи C=N [1]. Если алкильная группа в положении 2 N-замещенного бензимидазола содержит атомы водорода у углеродного атома, связанного с гетероциклом, то наряду с продуктами присоединения бутил- и фениллития по азометиновой связи образуются N-замещенные 2-(1-литийалкил)бензимидазолы. Однако выход последних в большинстве случаев низкий [2].

Нами установлено, что если в качестве металлирующего агента применить изопропилмагнийбромид в смеси тетрагидрофурана и 1,2-диметоксигтана, то реакция металлирования бензимидазолов I, приводящая к образованию магнийорганических соединений II, становится преобладающим процессом. Для определения выходов соединений II и выяснения их строения действием бензофенона они превращались в спирты III. Выход соединений II (по соединениям III) составляет 71...99%.

При проведении реакции металлирования бензимидазолов I без 1,2-диметоксигтана выход магнийорганических соединений II снижается до



I—III a R = H, б R = Me, в R = Et

45...82%, а при замене изопропилмагнийбромида бутилмагнийбромидом выход соединений II составляет 42...71%.

К изопропилмагнийбромиду, полученному из 0,61 г (25 ммоль) магния и 3,07 г (25 ммоль) бромистого изопропила в 9 мл ТГФ, в атмосфере аргона добавляют 6 мл 1,2-диметоксэтана и раствор 9 ммоль 1-метил-2-алкилбензимидазола (I) в 5 мл ТГФ, после чего реакционную смесь кипятят 1,5 ч. Образовавшееся магнийорганическое соединение II кипячением в течение 1 ч с 4,55 г (25 ммоль) бензофенона превращают в спирты III. $T_{\text{пл}}$ 194...195 °С (IIIa, EtOH), 158...159 °С (IIIб, бензол), 162...163 °С (IIIв, EtOH), что соответствует литературным данным [2].

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Elderfield R. C., Meyer V. B. // J. Amer. Chem. Soc. — 1954. — Vol. 76. — P. 1891.
2. Тертов Б. А., Богачев Ю. Г., Коцценко Ю. В., Суворова Г. М., Цупак Е. Б., Чуб Н. К., Бреус С. Ф. // ХГС. — 1986. — № 8. — С. 1073.

Ю. В. Коцценко, О. В. Рябцова, Б. А. Тертов

Ростовский государственный университет,
Научно-исследовательский институт
физической и органической химии,
Ростов-на-Дону 344104

Поступило в редакцию 14.01.95

ХГС. — 1995. — № 2. — С. 272.

СИНТЕЗ N-ЭТОКСИКАРБОНИЛ- β -АМИНОКЕТОНОВ — КЛЮЧЕВЫХ ПОЛУПРОДУКТОВ ДЛЯ ПОЛУЧЕНИЯ АЗОТСОДЕРЖАЩИХ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИХ СОЕДИНЕНИЙ

Ранее мы разработали новый эффективный метод конструирования пиримидинового кольца, основанный на α -амидоалкилировании 1,3-дикарбонильных соединений легкодоступными α -арилсульфонилзамещенными тиомочевинами [1]. Продукты этой реакции — β -оксоалкилтиомочевины самопроизвольно циклизуются до соответствующих 4-гидрокси-6-гидропиримидин-2-тионов. Аналогичный принцип был использован нами в настоящей работе для синтеза N-этоксикарбонил- β -аминокетон (Ia—в), которые являются ключевыми полупродуктами при получении разнообразных азотсодержащих гидрированных гетероциклических соединений ряда пиримидина, 1,3-оксазина и т. д.

Нами показано, что α -(*n*-толилсульфонил)замещенные карбаматы (IIa—в), легко образующиеся с высокими выходами при взаимодействии