

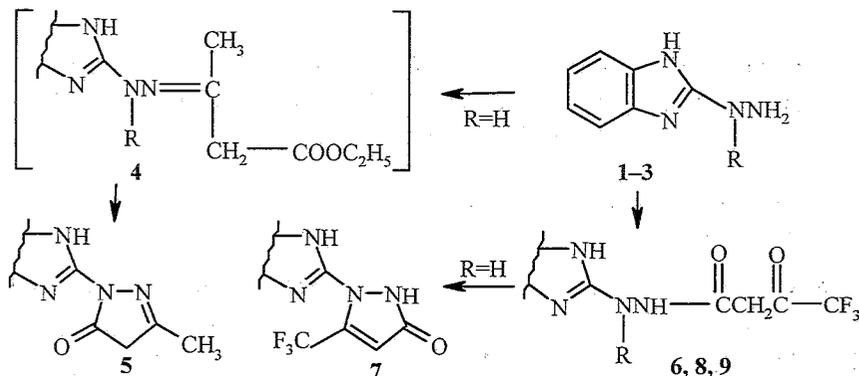
ПИСЬМА В РЕДАКЦИЮ

**ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ 2-ГИДРАЗИНОБЕНЗИМИДАЗОЛОВ
С АЦЕТОУКСУСНЫМ ЭФИРОМ
И ЕГО ТРИФТОРМЕТИЛЗАМЕЩЕННЫМ**

Ключевые слова: 1-(2-бензимидазоллил)-1-этил-2-гидразид трифторметилацетоуксусной кислоты, 2-гидразинобензимидазол, 2-(3-метилпиразол-1-ил-5-он)бензимидазол, трифторметилацетоуксусный эфир, 2-(2Н-5-трифторметилпиразол-1-ил-3-он)бензимидазол.

Конденсация 2-гидразино(алкилгидразино)бензимидазолов **1–3** с β -дикарбонильными соединениями протекает неоднозначно. В зависимости от природы динуклеофильного реагента получают 2-замещенные бензимидазолы [1] или замыкается цикл с образованием 1,2,4-триазепино- [2] и 1,2,4-триазинобензимидазолов [3].

Конденсация 2-гидразинобензимидазола (**1**) с ацетоуксусным эфиром в кипящем метаноле (0.5 ч) с добавкой каталитических количеств соляной кислоты протекает через первоначальную стадию синтеза гидразона **4**, который в условиях реакции циклизуется до 2-(3-метил-5-оксопиразол-1-ил)бензимидазола (**5**). В аналогичных условиях реакция гидразина **1** с трифторметилацетоуксусным эфиром (ТФАУЭ) протекает с образованием 2-бензимидазоллигидразида трифторметилацетоуксусной кислоты (**6**) и продукта его циклизации изомерного 2-(2Н-3-оксо-5-трифторметилпиразол-1-ил)бензимидазола (**7**).



Конденсация алкилгидразинобензимидазолов **2, 3** с ТФАУЭ в кипящей уксусной кислоте (3 ч) или толуоле (5 ч) останавливается на стадии синтеза замещенных гидразидов **8, 9**, попытки циклизации которых не дали положительных результатов.

2-(3-Метил-5-оксопиразол-1-ил)бензимидазол (5). Т. пл. 249–250 °С (из ацетонитрила). R_f 0.71. Выход 60%. ИК спектр (КВг), ν , см^{-1} : 1660 (C=O); 3330 (NH). Спектр ЯМР ^1H (ДМСО- d_6), δ , м. д.: 1.28 (3H, с, CH_3); 2.19 (2H, с, CH_2); 7.17–7.52 (4H, м, $\text{H}_{\text{аром}}$). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 215 (10); M^+ 214 (100); $[(M+H) - \text{C}_4\text{H}_5\text{N}_2\text{O}]^+$ 118 (28); $[M - \text{C}_7\text{H}_5\text{N}_2]^+$ 97 (18). Найдено, %: С 61.83; Н 4.65; N 26.45. $\text{C}_{11}\text{H}_{10}\text{N}_4\text{O}$. Вычислено, %: С 61.71; Н 4.74; N 26.15.

Гидразид 6. Т. пл. 264–266 °С (из ДМФА). Выход 10 %. ИК спектр (КВг), ν , см^{-1} : 1670, 1710 (C=O); 3250 (NH). Найдено, %: С 45.99; Н 3.21; N 19.60. $\text{C}_{11}\text{H}_9\text{N}_4\text{F}_3\text{O}_2$. Вычислено, %: С 46.15; Н 3.17; N 19.57.

2-(2Н-3-Оксо-5-трифторметилпиразол-1-ил)бензимидазол (7). Т. пл. 241–242 °С (из водного метанола). R_f 0.84. Выход 80%. ИК спектр (КВг), ν , см^{-1} : 1670 (C=O); 3260 (NH). Спектр ЯМР ^1H (ДМСО- d_6), δ , м. д.: 5.31 (1H, с, NH); 7.30–7.60 (4H, м, $\text{H}_{\text{аром}}$). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 269 (14); M^+ 268 (100); $[M - F]^+$ 249 (3); $[M - \text{CF}_3]^+$ 199 (27); $[(M+H) - \text{NHCOCHCF}_3]^+$ 132 (12); $[(M+H) - \text{C}_4\text{H}_2\text{N}_2\text{F}_3\text{O}]^+$ 118 (24). Найдено, %: С 49.26; Н 2.63; N 20.89. $\text{C}_{11}\text{H}_7\text{N}_4\text{F}_3\text{O}$. Вычислено, %: С 49.26; Н 2.63; N 20.89.

1-(2-Бензимидазолил)-1-этил-2-гидразид трифторметилацетоуксусной кислоты (8). Т. пл. 230–231 °С (из водного метанола). Выход 80%. ИК спектр (КВг), ν , см^{-1} : 1660, 1720 (C=O); 3190 (NH). Спектр ЯМР ^1H (ДМСО- d_6), δ , м. д.: 1.20 (3H, т, CH_2CH_3); 3.37 (2H, с, CH_2); 3.78 (2H, кв, CH_2N); 6.90–7.40 (4H, м, $\text{H}_{\text{аром}}$). Найдено, %: С 49.41; Н 4.43; N 17.85. $\text{C}_{13}\text{H}_{13}\text{N}_4\text{F}_3\text{O}$. Вычислено, %: С 49.69; Н 4.13; N 17.83.

1-(2-Бензимидазолил)-1-бензил-2-гидразид трифторметилацетоуксусной кислоты (9). Т. пл. 220–221 °С (из ацетонитрила). Выход 88%. ИК спектр (КВг), ν , см^{-1} : 1650, 1680 (C=O); 3180 (NH). Спектр ЯМР ^1H (CD_3OD), δ , м. д.: 3.20 (2H, с, CH_2); 4.82 (2H, с, CH_2N); 6.88–7.25 (4H, м, $\text{H}_{\text{аром}}$). Найдено, %: С 57.32; Н 3.95; N 14.95. $\text{C}_{13}\text{H}_{13}\text{N}_4\text{F}_3\text{O}$. Вычислено, %: С 57.44; Н 4.01; N 14.88.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Н. А. Клюев, М. В. Повстяной, Г. Г. Александров, В. П. Гуменный, *ХГС*, 88 (1983).
2. М. В. Повстяной, В. П. Кругленко, Е. Н. Федосенко, Н. А. Клюев, *ХГС*, 1065 (1990).
3. В. П. Кругленко, Е. Н. Федосенко, М. В. Повстяной, *Укр. хим. ж.*, 56, 1089 (1990).

М. В. Повстяной, В. П. Кругленко, В. М. Повстяной

Херсонский государственный технический университет, Херсон 73008, Украина
e-mail: kstu@cherson.ua

Поступило в редакцию 03.11.2000

СИНТЕЗ НОВОЙ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКОЙ СИСТЕМЫ 1,3-ДИОКСО-1,3-ДИГИДРОПИРРОЛО[3',4':4,5]ПИРРОЛО[1,2-*a*]- БЕНЗИМИДАЗОЛА

Ключевые слова: 1,3-диоксо-1,3-дигидропирроло[3',4':4,5]пирроло[1,2-*a*]-бензимидазол.

Взаимодействие дихлормалеимида **1** с метиленактивными соединениями, в частности малонодинитрилом и циануксусным эфиром, приводит к арилированию метиленовой группы [1, 2]. Нами установлено, что при взаимодействии дихлормалеимида **1** с 2-бензимидазолилацетонитрилами **2a, b** происходит нуклеофильное замещение атома хлора с образованием соединений **3a, b**, кипячение которых в пиридине приводит к внутри-молекулярной циклизации, продуктами которой являются соединения **4a, b** – производные новой гетероциклической системы – 1,3-диоксо-1,3-тетрагидропирроло[3',4':4,5]пирроло[1,2-*a*]бензимидазола.