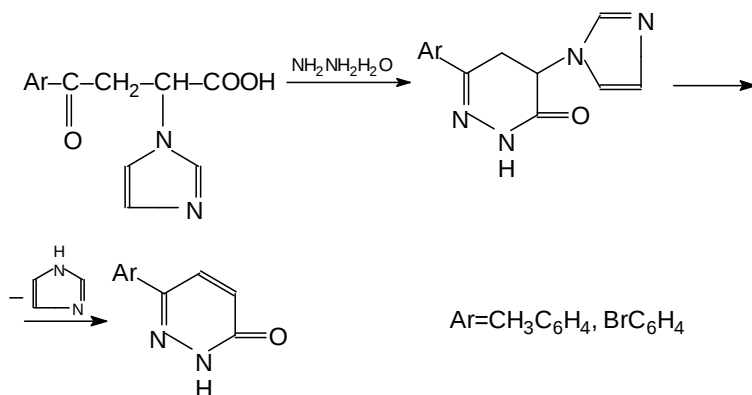


ПИСЬМА В РЕДАКЦИЮ

УДК 547-589+547-586

ИМИДАЗОЛ В КАЧЕСТВЕ ЗАЩИТНОГО НУКЛЕОФИЛА ДЛЯ ПОЛУЧЕНИЯ ПРОИЗВОДНЫХ ПИРИДАЗИНОНА ИЗ β -АРОИЛАКРИЛОВЫХ КИСЛОТ

Нами установлено, что β -ароил- α -/ N-имидазолил/пропионовые кислоты (Ar - $p\text{-CH}_3\text{C}_6\text{H}_4$, $p\text{-BrC}_6\text{H}_4$) [I] при кипячении с водным раствором гидразингидрата переходят в производные пиридазинона. По всей вероятности, образующиеся на первой стадии продукты гетероциклизации отщепляют имидазол в условиях реакции. Попытки получить те же соединения в аналогичных условиях из β -ароилакриловых кислот не увенчались успехом. В обоих случаях имело место образование производных пиразолина. Таким образом, имидазол может служить в качестве своеобразного защитного нуклеофила для получения производных пиридазинона из β -ароилакриловых кислот.

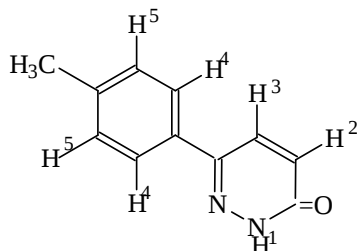


Экспериментальная часть

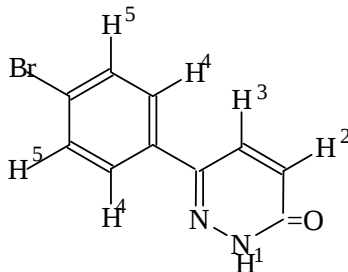
Спектры ЯМР¹H получены на "MERCURY-300 Varian".

Смесь 0,65 г (0,0025 моля) β -толуил- α -/ N-имидазолил/ пропионовой кислоты и 4 мл 60% гидразингидрата кипятили 4 ч. Образовавшийся осадок отфильтровали, многократно промыли спиртом и высушили в вакууме.

Получили 0,24 г (50,5%) 6-толуилпиридазинона-3 с т.пл. 242-243°C. Спектр ЯМР¹H (ДМСО) δ, м.д.: 13с(1H¹, >NH), 7,8 д (1H², J_{HH}=9,6 Гц), 7,7д (2H⁴, J_{HH}=7,8 Гц), 7,2 д (2H⁵, J_{HH}=7,8 Гц), 6,9 д (1H³, J_{HH}=9,6 Гц), 2,4 с (3H, CH₃C₆H₅):



Аналогично из β-/p-бромбензоил/-α-/N-имидазолил/пропионовой кислоты получен 6-/p-бромбензоил/пиридазинон-3 с выходом 45%, т.пл. 235°C. Спектр ЯМР¹H (ДМСО) δ, м.д.: 13с(1H¹, >NH), 7,85 д (1H², J_{HH}=9,6 Гц), 7,75д (2H⁴, J_{HH}=7,8 Гц), 7,55д (2H⁵, J_{HH}=7,8 Гц), 6,85 д (1H³, J_{HH}=9,6 Гц):



**ԻՄԻԴԱԶՈԼԸ ՈՐՊԵՍ ՊԱՇՏՊԱՆԻՉ ՆՈՒԿԼԵՈՖԻԼ
β-ԱՐՈՒԼԱԿՐԻԼԱԹԹՈՒՆԵՐԻՑ ՊԻՐԻԴԱԶԻՆՈՆԻ ԱԾԱՆՅԱԼՆԵՐԻ
ՍՏԱՅՄԱՆ ՀԱՄԱՐ**

**Ս. Հ. ԻՆՃԻԿՅԱՆ, Ռ. Զ. ԽԱԶԻԿՅԱՆ, Ն. Վ. ՔԱՐԱՍՅԱՆ,
Հ. Ա. ՓԱՆՈՍՅԱՆ և Ռ. Հ. ԽԱԶԱՏՐՅԱՆ**

Ցույց է տրվել, որ β-արոիլ-α-(N-իմիդազոլիլ)պրոպիոնաթթուները հիդրազինհիդրատի ջրային լուծույթի հետ եռացնելիս առաջացնում են պիրիդազինոնի ածանցյալներ: Ենթադրվում է, որ առաջին փուլում ստացված հետերոցիկլացման արգասիքներից ռեակցիայի պայմաններում տեղի է ունենում իմիդազոլի պոկում:

IMIDAZOLE AS DEFENCE NUCLEOPHILE FOR PREPARATION OF DERIVATIVES OF PYRIDAZINONE FROM β -AROYLACRYLIC ACIDS

M. H. INJIKYAN, R. J. KHACHIKYAN, N. V. KARAMYAN,
H. A. PANOSSYAN and **R. H. KHACHATRYAN**

It is established that β -aroyl- α -(N-imidazolyl)propionic acids by boiling with aqueous solution of hydrazine hydrate produce the derivatives of pyridazinone. It is shown that at the some conditions the appropriate aroylacrylic acids with hydrazine hydrate form only the derivatives of pyrazoline. So imidazole is peculiar defence nucleophil for obtaining of derivatives of pyridazinone from β -aroylacrylic acids.

ЛИТЕРАТУРА

[1] Хачикян Р. Дж., Григорян Г. В., Агбальян С. Г. // Арм. хим. ж., 1986, т. 39, № 6, с. 373.

М. Г. Инджикян
Р. Дж. Хачикян
Н. В. Карамян
Г. А. Паносян
Р. А. Хачатрян

Институт органической химии НАН Республики Армения, Ереван

Поступило 5 II 2002