

DEPARTAMENTO DE QUIMICA ORGANICA

Director: Prof. Dr. LOPEZ APARICIO

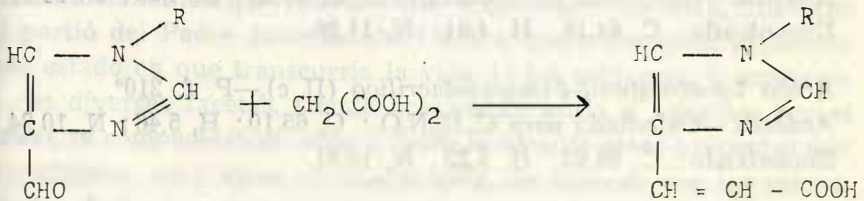
ACIDOS 1-ARIL-4-IMIDAZOLACRILICOS

SAENZ DE BURUAGA LERENA, J., y SAENZ DE BURUAGA LERENA, J. M.

SUMMARY

It is reported the reaction of 1-aryl-4-imidazolecarboxaldehydes (I) with malonic acid.

Como continuación de la línea de trabajo comenzada por uno de nosotros sobre la síntesis de derivados del imidazol con probable acción farmacológica hemos preparado los ácidos 1-aryl-4-imidazola-crílicos (II) basándonos en la reactividad del grupo formilo. Hemos empleado la modificación de Doebner de la reacción de Perkin (1) a la condensación de los 1-aryl-4-formilimidazoles (2) (I) con ácido malónico. Para ello hemos hecho reaccionar ambos compuestos en piridina y en presencia de una pequeña cantidad de piperidina.



I

- II a, R=p-C₆H₄-CH₃
 b, R=p-C₆H₄-OCH₃
 c, R=p-C₆H₄-OC₂H₅

Estos derivados (II) se han recrystalizado de etanol hasta punto de fusión constante y cromatográficamente puros. El análisis de C, H y N es concordante entre los valores calculados.

Su estructura se ha confirmado por espectroscopia I. R. y R. M. N. Por el estudio de ambos espectros se puede deducir que solamente hemos obtenido el isómero trans, ya que aparece a 971 cm^{-1} la banda característica y en el de RMN la constante de acoplamiento así lo confirma.

Estos derivados pueden considerarse interesantes más que por sus propiedades farmacológicas en sí por permitirnos realizar una serie de adiciones al doble enlace que facilite el camino para obtener sustancias potencialmente activas.

PARTE EXPERIMENTAL

Una mezcla de 0,01 mol del correspondiente 1-aryl-4-formilimidazol, 0,01 mol de ácido malónico, 15 ml de piridina y 8 gotas de piperidina, se calienta en baño de agua durante tres horas y a continuación a reflujo en baño de glicerina a $130\text{-}140^\circ$ durante 10 minutos. Una vez enfriada la mezcla de la reacción, se vierte sobre agua y el producto formado se precipita con ácido clorhídrico. Se recristaliza de etanol.

(1) *Acido 1-tolil-4-imidazolacrílico* (II a).—P. f. $234\text{-}225^\circ$.
Análisis.—Calculado para $\text{C}_{13}\text{H}_{12}\text{N}_2\text{O}_3$: C, 68,40; H, 5,30; N, 12,27.
Encontrado: C, 68,12; H, 5,20; N, 11,99.

Acido 1-p-metoxifenil-4-imidazolacrílico (II b).—P. f. 240° .
Análisis.—Calculado para $\text{C}_{13}\text{H}_{12}\text{N}_2\text{O}_3$: C, 63,93; H, 4,95; N, 11,47.
Encontrado: C, 64,16; H, 4,91; N, 11,56.

Acido 1-p-etoxifenil-4-imidazolacrílico (II c).—P. f. 210° .
Análisis.—Calculado para $\text{C}_{14}\text{H}_{14}\text{N}_2\text{O}_3$: C, 65,10; H, 5,46; N, 10,84.
Encontrado: C, 64,93; H, 5,22; N, 10,61.

Damos las gracias al Dr. J. Calderón por los análisis que se han realizado en el Laboratorio de Microanálisis del Instituto de Química Orgánica del C. S. I. C. de Madrid y al Prof. Dr. Fernández Sánchez, Jefe del servicio de R. M. N.

BIBLIOGRAFIA

- (1) JOHNSON, J. R.: *Organic Reactions*, 1, 210 (1942).
- (2) HUBER, G. y col.: *Helv. Chim. Acta*, 43, 713 (1960);
MARTINEZ RUIZ, D.: Tesis doctoral, Sevilla (1967).