

УДК 547.74

# СИНТЕЗ 2-(2,4-ДИФЕНІЛ-1Н-ПІРОЛ-1-ІЛ)БЕНЗОЙНИХ КИСЛОТ

Л.М.Потіха

Київський національний університет ім. Тараса Шевченка,  
01033, м. Київ, вул. Володимирська, 64. E-mail: potikha\_l@mail.ru

*Ключові слова:* антранілові кислоти;  $\gamma$ -бромодипнон; 2-(1Н-пірол-1-іл)бензоат;  
2-(1Н-пірол-1-іл)бензойна кислота

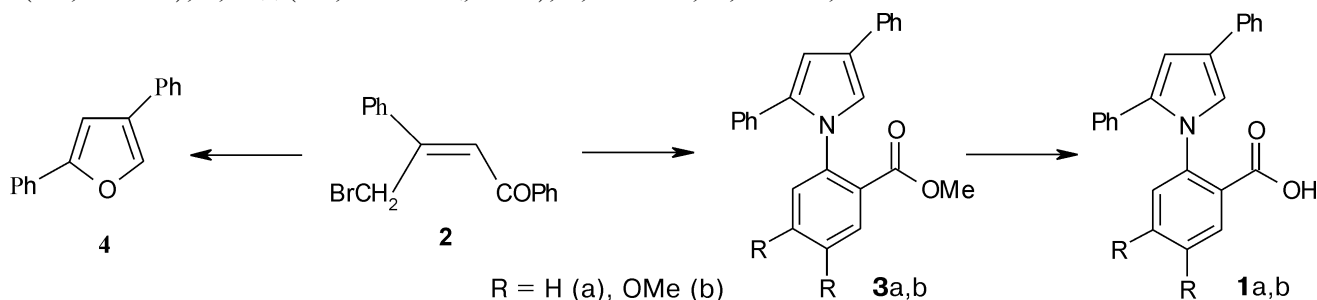
Серед похідних 1-арилпіролів знайдені сполуки, у тому числі 2-(1Н-пірол-1-іл)бензойні кислоти, що виявляють гіпоглікемічну [1] та аналгетичну [2] активність. 2-(1Н-Пірол-1-іл)бензойні кислоти є зручними прекурсорами в синтезі піроло[1,2-а]індолів, -хінолінів та інших піролконденсованих систем, що використовуються як лікарські засоби широкого спектра дії. Пропонується зручний спосіб одержання 2-(2,4-дифеніл-1Н-пірол-1-іл)бензойних кислот (1а, б), який полягає у конденсації  $\gamma$ -бромодипнону (2) з естерами антранілових кислот [3] і подальшому лужному гідролізу естерів 2-(1Н-пірол-1-іл)бензойних кислот (3а, б), які при цьому утворюються. Використання алкілантранілатів з електроноакцепторними замісниками приводить до продукту внутрішньомолекулярної циклізації 2 — 2,4-дифенілфурану (4) [3] (схема).

Спектри ЯМР  $^1\text{H}$  зареєстровані на приладі Mercury 400 (Varian) (400 МГц), внутрішній стандарт — ТМС.

**Метил 2-(2,4-дифеніл-1Н-пірол-1-іл)-4,5-диметоксибензоат (3б).** Одержаний за методикою [3] з використанням 1,99 г (6,6 ммоль)  $\gamma$ -бромодипнону і 1,4 г (6,6 ммоль) метилового естеру 4,5-диметоксіантранілової кислоти. Вихід: 2,03 г (74%), Т.пл. — 178-180°C (i-PrOH). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м.д.: 3,47 с (3Н,  $\text{CO}_2\text{Me}$ ), 3,80 с (3Н, 4-ОМе), 3,84 с (3Н, 5-ОМе), 6,70 д (1Н,  $^4\text{J}$  1,2 Гц, Н-3'), 6,99 с

(1Н, Н-3), 7,05-7,33 м (10Н,  $\text{H}_{\text{аром}}$ , Н-5'), 7,57 д (2Н,  $^3\text{J}$  8,0 Гц,  $\text{H}_{\text{аром}}$ ). Знайдено, %: С — 75,43; Н — 5,49; N — 3,43.  $\text{C}_{26}\text{H}_{23}\text{NO}_4$ . Вирахувано, %: С — 75,53; Н — 5,61; N — 3,39.

**Загальна методика одержання 2-(2,4-дифеніл-1Н-пірол-1-іл)бензойних кислот (1а, б).** До розчину 0,4 г (10 ммоль) NaOH в 45 мл етанолу додають 4 ммоль естеру 3а або 3б і кип'ячать 20 хв. Після охолодження повільно додають 2М розчин соляної кислоти до слабо-кислої реакції (рН = 5-6). Осад, що випав через 2 год, відфільтровують, промивають водою та перекристалізують. 1а. Вихід: 1,07 г (85%), Т.пл. — 160-162°C (i-PrOH). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м.д.: 6,72 д (1Н,  $^4\text{J}$  1,6 Гц, Н-3'), 6,78 с (1Н, Н-3), 7,10-7,17 м (7Н,  $\text{H}_{\text{аром}}$ , Н-5'), 7,23 д (1Н,  $^4\text{J}$  1,6 Гц, Н-5'), 7,30 т (2Н,  $\text{H}_{\text{аром}}$ ), 7,48 м (2Н,  $\text{H}_{\text{аром}}$ ), 7,56 д (2Н,  $^3\text{J}$  7,6 Гц,  $\text{H}_{\text{аром}}$ ), 7,80 д (1Н,  $^3\text{J}$  7,6 Гц, Н-6), 12,76 ушир.с (1Н, OH). Знайдено, %: С — 74,25; Н — 4,52; N — 3,80.  $\text{C}_{23}\text{H}_{17}\text{NO}_4$ . Вирахувано, %: С — 74,38; Н — 4,61; N — 3,77. 1б. Вихід: 1,78 г (91%), Т.пл. — 185-188°C (i-PrOH). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м.д.: 3,71 с (3Н, 4-ОМе), 3,87 с (3Н, 5-ОМе), 6,69 д (1Н,  $^4\text{J}$  1,2 Гц, Н-3'), 6,78 с (1Н, Н-3), 7,12-7,33 м (10Н,  $\text{H}_{\text{аром}}$ , Н-5'), 7,57 д (2Н,  $^3\text{J}$  7,6 Гц,  $\text{H}_{\text{аром}}$ ), 12,75 ушир.с (1Н, OH). Знайдено, %: С — 75,02; Н — 5,23; N — 3,57.  $\text{C}_{25}\text{H}_{21}\text{NO}_4$ . Вирахувано, %: С — 75,17; Н — 5,30; N — 3,51.



Схема

## Література

1. Sugihara H., Matsumoto N., Hamuro Y. et al. // *Arzneim.-Forsch.* — 1974. — Vol. 24. — P. 1560-1563.
2. Negro A., Diez M., Alemani M. // *Org. Prep. Proced.* — 1988. — Vol. 20. — P. 414-418.
3. Потіха Л.М., Ковтуненко В.А. // *ХГС.* — 2006. — С. 848-853.

Надійшла до редакції 03.09.2007 р.