

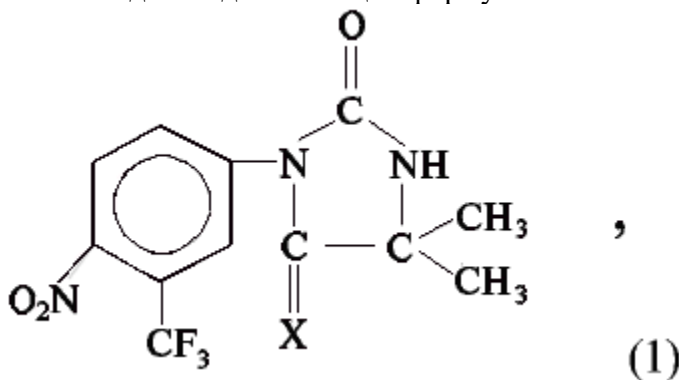
(19) **KG** (11) **95** (13) **C2**

ГОСУДАРСТВЕННОЕ АГЕНТСТВО
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ
ПРИ ПРАВИТЕЛЬСТВЕ КЫРГЫЗСКОЙ РЕСПУБЛИКИ (КЫРГЫЗПАТЕНТ)

(51)⁵ **C07D 233/74;**
A61K 31/395

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ к патенту Кыргызской Республики

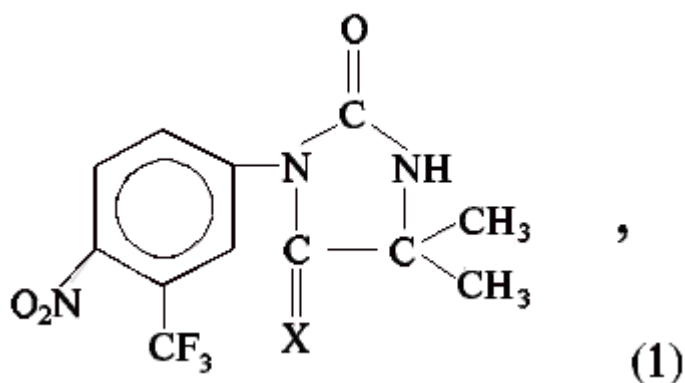
- (10) 596165
(21) 2414002/SU
(22) 21.10.1976
(31) 7533084
(32) 29.10.1975
(33) FR
(46) 01.01.1996, Бюл. №4, 1996
(71)(73) Руссель-Юклаф, FR
(72) Жак Перронне, Пьер Жиро, Клод Бонне, FR
(56) 1. Райд К. Курс физической органической химии. - М., 1972. - С. - 456
(54) **Способ получения имидазолидинов**
(57) 1. Способ получения имидазолидинов общей формулы



где X - кислород или иминная группа, отличающийся тем, что 2-амино-2-цианпропан подвергают взаимодействию с 3-трифторметил-4-нитрофениловым эфиром изоциановой кислоты в присутствии третичного амина в среде органического растворителя и полученное соединение выделяют или подвергают гидролизу в кислой среде.

2. Способ по п. 1, отличающийся тем, что в качестве растворителя применяют тетрагидрофуран.

Изобретение относится к синтезу новых химических соединений производных имидазолидина, а именно к способу получения соединений общей формулы



где X - кислород или иминная группа, которые являются физиологически активными соединениями.

Известно, что при взаимодействии изоцианатов с первичными аминами получают производные мочевины [1].

С целью синтеза новых производных имидазолидинов, которые позволяют расширить арсенал средств воздействия на живой организм, предлагается способ получения соединений общей формулы (1) путем взаимодействия 2-амино-2-цианпропана с 3-трифторметил-4-нитрофениловым эфиром изоциановой кислоты в присутствии третичного амина, например триэтиламина или пиридина, в среде органического растворителя, полученное соединение выделяют или подвергают гидролизу в кислой среде, например в присутствии соляной кислоты.

Взаимодействие 2-амино-2-цианпропана с 3-трифторметил-4-нитрофениловым эфиром изоциановой кислоты можно проводить в среде тетрагидрофурана.

Пример 1. 1-(3'-трифторметил-4-нитрофенил)-4,4-диметил-5-имино-имидазолин-2-он.

В 500 мл тетрагидрофурана вводят 49.6 г 3-трифторметил-4-нитрофенилового эфира изоциановой кислоты, 1 мл триэтиламина, а затем быстро прибавляют 18 г 2-амино-2-цианпропана, смесь перемешивают 72 ч при 20°C, отгоняют растворитель досуха при пониженном давлении, хроматографируют остаток на силикагеле, элюируя смесью хлористый метилен-ацетон (8 : 2), и получают 27 г целевого продукта, т. пл. 168°C.

Найдено, %: C 45.6; H 3.6; N 17.5;

$C_{12}H_{11}F_3N_4O_3$

Вычислено, %: C 45.57; H 3.50; N 17.71

В ИК-спектре (хлороформ) наблюдаются характеристические полосы поглощения (cm^{-1}) при 3442 (NH), 1755 (C=O), 1673 (C=N), 1615 и 1595 (ароматическое ядро), 1542, 1492 и 1355 (NO_2).

Пример 2. 1-(3'-трифторметил-4'-нитрофенил)-4,4-диметил-имидазолин-2,5-дион.

К 35 мл водного раствора соляной кислоты (22° Боме) и 35 мл воды прибавляют 10 г 1-(3'-трифторметил-4'-нитрофенил)-4,4-диметил-5-иминоимидазолин-2-она, суспензию нагревают с обратным холодильником 1 ч, охлаждают до 20°C и выливают в воду. Образовавшийся осадок фильтруют, промывают, сушат и получают 9.5 г целевого продукта, т.пл. 149°C. После перекристаллизации из этанола т.пл. та же.

Найдено, %: C 45.5; H 3.4; F 17.9; N 12.9

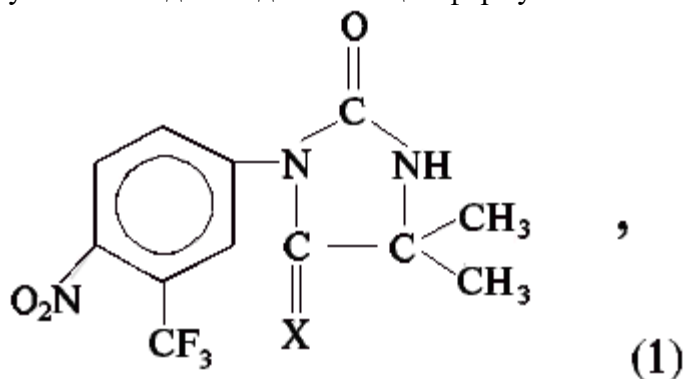
$C_{12}H_{10}F_3N_3O_4$

Вычислено, %: C 45.43; H 3.17; F 17.96; N 12.24.

В ИК-спектре (хлороформ) наблюдаются характеристические полосы поглощения (cm^{-1}) при 3438 (NH), 1792 и 1734 (C=O), 1597 и 1501 (ароматическое ядро), 1545, 1358 и 1349 (NO_2).

Формула изобретения

1. Способ получения имидазолидинов общей формулы



где X - кислород или иминная группа, отличающийся тем, что 2-амино-2-цианпропан подвергают взаимодействию с 3-трифторметил-4-нитрофениловым эфиром изоциановой кислоты в присутствии третичного амина в среде органического растворителя и полученное соединение выделяют или подвергают гидролизу в кислой среде.

2. Способ по п. 1, отличающийся тем, что в качестве растворителя применяют тетрагидрофуран.

Ответственный за выпуск

Ногай С.А.

Кыргызпатент, 720021, г. Бишкек, ул. Московская, 62, тел.: (312) 68 08 19, 68 16 41, факс: (312) 68 17 03