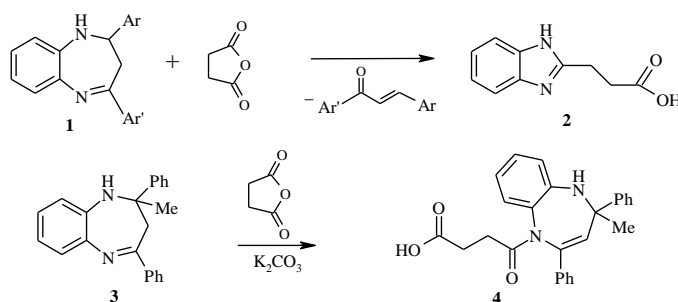


## АЦИЛИРОВАНИЕ 2-МЕТИЛ-2,4-ДИФЕНИЛ-2,3-ДИГИДРО-1Н-1,5-БЕНЗОДИАЗЕПИНА ЯНТАРНЫМ АНГИДРИДОМ

**Ключевые слова:** 2-метил-2,4-дифенил-2,3-дигидро-1Н-1,5-бензодиазепин, янтарный ангидрид, ацилирование.

При попытках ацилирования 2,4-диарил-2,3-дигидро-1Н-1,5-бензодиазепинов **1** янтарным ангидридом наблюдается перегруппировка с образованием 3-(1Н-бензимидазол-2-ил)пропионовой кислоты **2** [1].

Нами установлено, что кипячение в толуоле в течение 2 ч в присутствии карбоната калия раствора эквимольных количеств янтарного ангидрида и 2-метил-2,4-дифенил-2,3-дигидро-1Н-1,5-бензодиазепина (**3**), полученного по методике [2] взаимодействием 2 моль ацетофенона с *o*-фенилендиамином, приводит к 4-(2-метил-2,4-дифенил-2,5-дигидро-1Н-1,5-бензодиазепин-5-ил)-4-оксобутановой кислоте **4** с выходом 70%.



Реакции ацилирования 2,3-дигидро-1Н-1,5-бензодиазепинов могут идти по двум различным направлениям [1]: для 2,4-дизамещенных во взаимодействии участвует группа NH, для 2,2,4-тризамещенных – азометиновый атом азота. Сравнение спектров ЯМР <sup>1</sup>H исходного бензодиазепина **3** и полученного продукта **4** показало, что в спектре последнего отсутствует сигнал, соответствующий метиленовой группе, и появляется сигнал этиленового протона при 6.41 м. д. Таким образом, ацилирование направляется на иминный атом азота.

**4-(2-Метил-2,4-дифенил-2,5-дигидро-1Н-1,5-бензодиазепин-5-ил)-4-оксобутановая кислота (4).** К раствору 0.312 г (1 ммоль) 2-метил-2,4-дифенил-2,3-дигидро-1Н-1,5-бензодиазепина **3** в 20 мл толуола добавляют 0.1 г (1 ммоль) янтарного ангидрида и каталитическое количество K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>. Полученную смесь кипятят 2 ч, карбонат калия отфильтровывают, к раствору добавляют 10 мл гексана. Выпавший осадок отделяют и промывают гексаном. Выход 70%. Т. пл. 140 °С. Спектр ЯМР <sup>1</sup>H (Varian Mercury VX-200 (200 МГц), ДМСО-d<sub>6</sub>), δ, м. д.: 1.77 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 2.85–2.56 (4H, м, 2CH<sub>2</sub>); 6.41 (1H, с, CH); 7.82–6.91 (15H, м, CH аром. + NH). Найдено, %: N 6.70. C<sub>26</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub>. Вычислено, %: N 6.79.

### СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. В. Д. Орлов, Н. Н. Колос, С. М. Десенко, В. Ф. Лаврушин, ХГС, 830 (1982).
2. С. М. Десенко, В. Д. Орлов, *Азагетероциклы на основе ароматических непредельных кетонов*, Фолио, Харьков, 1998.

**В. А. Чебанов, Е. А. Муравьева, К. М. Кобзарь**

НТК "Институт монокристаллов"  
НАН Украины, Харьков 61001  
e-mail: [chebanov@isc.kharkov.com](mailto:chebanov@isc.kharkov.com)

Поступило в редакцию 15.08.2002  
После доработки 06.02.2003