

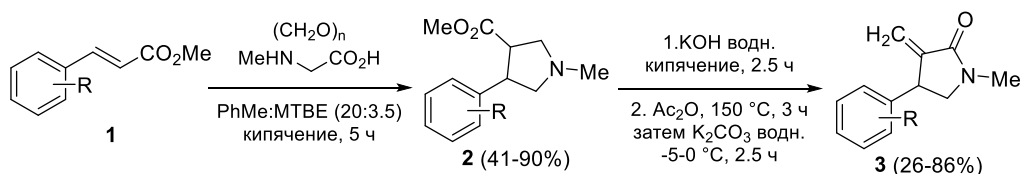
СИНТЕЗ 1-МЕТИЛ-3-МЕТИЛЕН-4-АРИЛ-2-ПИРРОЛИДОНОВ ИЗ МЕТИЛЦИННАМАТОВ

Ермолаев М.А., Лесков К.В., Буев Е.М., Мошкин В.С., Сосновских В.Я.

Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

3-Алкилиден-2-пирролидоны представляют важный класс природных соединений, проявляющих разнообразную биологическую активность, в том числе противовоспалительную, анальгетическую и значительную цитотоксичность по отношению к некоторым видам рака [1–2].

Данная работа представляет новый метод синтеза 1-метил-3-метилден-4-арил-2-пирролидонов из метиловых эфиров замещенных коричных кислот. Первая стадия заключается в реакции [3+2] циклоприсоединения нестабилизированного *N*-метилазометин-ирида к исходному метилциннамату **1**, в результате чего циклоаддукты **2** образовались с выходами от 41% до 90% (см. схему). Далее полученные пирролидины **2** обрабатывали водным раствором щелочи для гидролиза сложноэфирной группы, затем продукты гидролиза подвергались термической перегруппировке в метиленлактамы **3** при нагревании в уксусном ангидриде. Превращение пирролидинов **2** в 3-метилден-2-пирролидоны **3** было осуществлено с выходами от 26% до 86%.



Синтез 1-метил-3-метилден-4-арил-2-пирролидонов из метилциннаматов

Таким образом, разработанный метод позволяет получать 1-метил-3-метилден-4-арил-2-пирролидоны из легкодоступных метилциннаматов за три экспериментально простые стадии.

1. Janecka A. et al. Natural and synthetic α -methylene lactones and α -methylene lactams with anticancer potential // *Drug Discovery Today*. 2012. Vol. 17, Is. 11–12. P. 561–572;

2. Ikuta H. et al. Synthesis and Antiinflammatory Activities of 3-(3,5-Di-*tret*-butyl-4-hydroxybenzylidene)pyrrolidine-2-ones // *Journal of Medicinal Chemistry*. 1987. Vol. 30, Nr. 11. P. 1998–2004.

Работа выполнена при финансовой поддержке РФФ, проект № 22-73-10008-П