

# СИНТЕЗ И НЕКОТОРЫЕ ПРЕВРАЩЕНИЯ АМИДОВ 4-(2,5-ДИГИДРО-2,5-ДИОКСО-1*H*-ПИРРОЛ-1-ИЛ)- БЕНЗОЙНОЙ И -ФЕНИЛУКСУСНОЙ КИСЛОТ

© 2023 г. О. А. Колямшин<sup>1,\*</sup>, Ю. Н. Митрасов<sup>2</sup>, В. А. Данилов<sup>1</sup>,  
Ю. Ю. Пыльчикова<sup>1</sup>, А. А. Авруйская<sup>2</sup>

<sup>1</sup> Чувашский государственный университет имени И. Н. Ульянова, Московский пр. 15, Чебоксары, 428015 Россия

<sup>2</sup> Чувашский государственный педагогический университет имени И. Я. Яковлева, Чебоксары, 428000 Россия

\*e-mail: kolyamshin.oleg@yandex.ru

Поступило в редакцию 17 октября 2022 г.

После доработки 17 октября 2022 г.

Принято к печати 21 декабря 2022 г.

Амиды 4-аминобензойной и 4-аминофенилэтановой кислот при последовательном действии малеинового и уксусного ангидридов превращаются в амиды 4-(2,5-дигидро-2,5-диоксо-1*H*-пиррол-1-ил)бензойной и 4-(2,5-дигидро-2,5-диоксо-1*H*-пиррол-1-ил)фенилэтановой кислот, которые взаимодействуют со вторичными аминами по реакции аза-Михаэля с образованием амидов 4-(3-диалкиламино-2,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1*H*-пиррол-1-ил)бензойной и 4-(3-диалкиламино-2,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1*H*-пиррол-1-ил)фенилэтановой кислот.

**Ключевые слова:** амиды 4-аминобензойной кислоты, амиды 4-аминофенилэтановой кислот, малеиновый ангидрид, малеинимиды, сукцинимиды

**DOI:** 10.31857/S0044460X23020026, **EDN:** PZXDWP

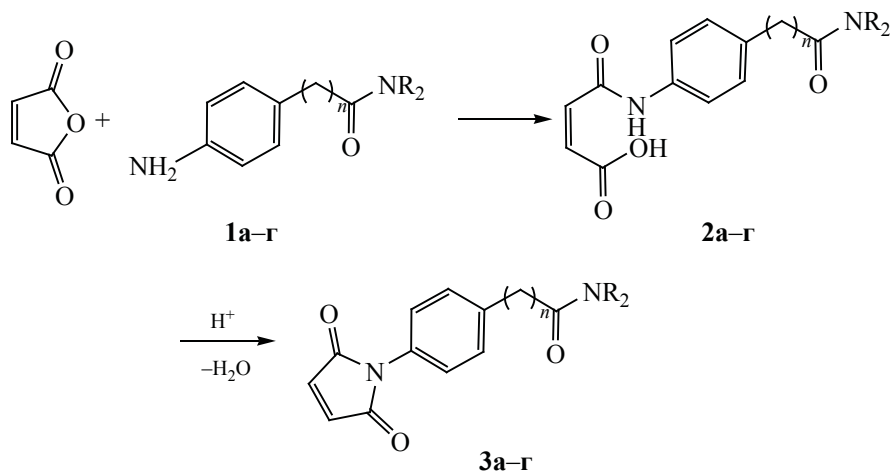
Производные 1*H*-пиррол-2,5-дионов (малеинимидов) являются ценными синтонами органического синтеза. Это обусловлено наличием в их составе высокоактивной двойной связи, за счет которой малеинимиды присоединяют разнообразные нуклеофильные и электрофильные реагенты, вступают в реакции циклоприсоединения, а также легко полимеризуются и сополимеризуются с различными непредельными соединениями [1, 2]. Значительный интерес для получения термостойких полимеров представляют бис-малеинимиды на основе сложных эфиров [3–5] и амидов [6–9] *m*- или *n*-аминобензойных кислот.

Весьма привлекательным свойством производных малеинимидов является их высокая и разноплановая биологическая активность [1]. Так, недавно были описаны 1-[4-(*E*)-3-арилакрилоил]фенил]-3,4-дибром-1*H*-пирролил-2,5-ди-

оны, обладающие антиканцерогенным и противотуберкулезным действием [10]. На основе тетрафенилпорфиринов, содержащих в своем составе малеинимидные группы, получены карбоксансодержащие порфирины, которые могут быть использованы при лечении опухолей головного мозга, печени и рака кожи [11]. На основе малеинимидов также были синтезированы сукцинимиды с высокой противоопухолевой [12, 13], антиаритмической, антигистаминной, антихолестеремической [14, 15], снотворной и седативной активностью [16, 17].

На основании изложенного выше можно заключить, что исследования по синтезу и изучению свойств новых типов малеинимиды представляются весьма актуальными. В связи с этим, целью настоящей работы явились синтез и изучение свойств неописанных ранее амидов 4-(2,5-ди-

Схема 1.



$n = 0$ ,  $R = \text{CH}_3$  (**a**),  $\text{C}_2\text{H}_5$  (**б**);  $n = 1$ ,  $\text{R}_2\text{N} = \text{пиперидин-1-ил}$  (**в**);  $n = 0$ ,  $\text{R}_2\text{N} = \text{NHCH}_2\text{C}_6\text{H}_5$  (**г**).

гидро-2,5-диоксо-1*H*-пиррол-1-ил)бензойной и -фенилуксусной кислот.

Ранее нами было показано, что эфиры 4-(2,5-дигидро-2,5-диоксо-1*H*-пиррол-1-ил)бензойной и -фенилуксусной кислот реагируют со вторичными аминами по реакции аза-Михаэля, что позволило синтезировать неизвестные 3- $\text{R}_2$ -аминосукцинимиды [18–20]. Поэтому весьма логичным представлялось вовлечение в данную реакцию также амидов этих кислот, что позволило бы получить новые соединения, содержащие фармакофорные имидную и амидную группы.

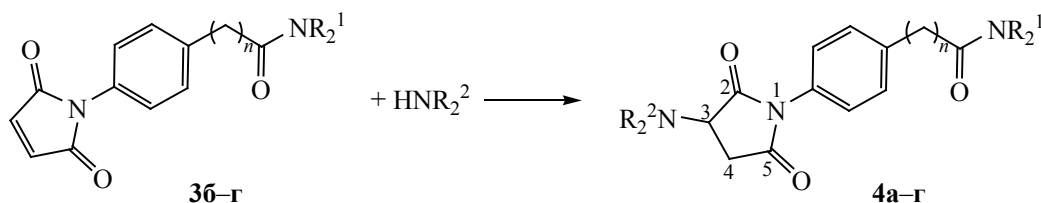
Исходные амиды были получены в результате двухстадийного процесса, который включал первоначальное взаимодействие малеинового ангидрида с амидами 4-аминобензойной (**1a**, **б**, **г**) и 4-аминофенилэтановой (**1в**) кислот и последующую циклизацию образующихся малеинмоноамидов **2a–г** под действием уксусного ангидрида в присутствии ацетата натрия. Выходы амидов 4-(2,5-дигидро-2,5-диоксо-1*H*-пиррол-1-ил)бензойной (**3a**, **б**, **г**) и 4-(2,5-дигидро-2,5-диоксо-1*H*-пиррол-1-ил)фенилэтановой (**3в**) кислот составили 48–92% (схема 1).

Синтезированные моноамиды **2a–г** и малеинимиды **3a–г** представляют собой бесцветные

или светло-желтые кристаллические вещества. В ИК спектрах малеинимидов **3a–г** присутствуют полосы поглощения, характерные для валентных колебаний карбонильных групп малеинимидного цикла ( $1757\text{--}1760$  и  $1705\text{--}1708$   $\text{см}^{-1}$ ) и амидной группы (амид I в области  $1620\text{--}1635$   $\text{см}^{-1}$  и амид II при  $1540$   $\text{см}^{-1}$  для имида **3г**). Наряду с этим в спектрах имеются полосы поглощения группы  $\text{HC}=\text{CH}$  ( $1618\text{--}1620$   $\text{см}^{-1}$ ) и ароматического кольца ( $3050\text{--}3090$ ,  $1490\text{--}1580$ ,  $820\text{--}850$   $\text{см}^{-1}$ ). Протоны цикла малеинимидов **3a–г** являются магнитно эквивалентными и проявляются в спектрах ЯМР  $^1\text{H}$  в виде характерных синглетов в слабом поле при 7.08–7.21 м. д., а протоны *n*-фениленовой группы – в виде дублетов с  $\delta$  7.25–7.46 и 7.32–7.99 м. д. ( $^3J_{\text{HH}}$  8.3–8.5 Гц).

Малеинимиды **3a–г** представляют повышенный интерес в качестве матрицы для синтеза новых типов сукцинимидов, потенциально обладающих биологической активностью. В связи с этим нами осуществлено взаимодействие малеинимидов **3б–г** со вторичными аминами (диэтиламино, пиперидином и морфолином). Реакции проводили в среде абсолютного 1,4-диоксана при температуре 25–70°C. Протекание реакции контролировали с помощью тонкослойной хроматографии (ТСХ).

Схема 2.



$n = 0$ ,  $R^1 = C_2H_5$ ,  $R^2 = C_2H_5$  (**4a**);  $n = 1$ ,  $R^1_2N =$  пиперидин-1-ил,  $R^2 = C_2H_5$  (**4б**);  $n = 0$ ,  $R^1_2N = NHCH_2C_6H_5$ ,  $R^2 = C_2H_5$  (**4в**);  $n = 0$ ,  $R^1_2N = NHCH_2C_6H_5$ ,  $R^2_2N =$  пиперидин-1-ил (**4г**).

По данным ИК и ЯМР  $^1H$  спектроскопии, в результате реакции образуются соответствующие 3- $R_2$ -диалкиламинозамещенные сукцинимиды **4а–г**, т. е. происходит аза-присоединение по Михаэлю вторичных аминов к малеинимидам **3б–г** (схема 2).

Сукцинимиды **4а–г** образуются с хорошими выходами (80–94%) и представляют собой бесцветные кристаллические соединения. В ИК спектрах соединений **4а–г** имеются полосы поглощения в области 1690–1710 и 1750–1775  $cm^{-1}$ , соответствующие валентным колебаниям  $C=O$ -групп в сукцинимидном цикле, а также 1635–1670  $cm^{-1}$  – полоса амид I. Соединения **4в, г** дополнительно характеризуются полосами поглощения амид II (1536–1541  $cm^{-1}$ ) и валентных колебаний  $N-H$  связи (3294–3346  $cm^{-1}$ ). Незначительный сдвиг максимума поглощения  $\nu_{N-H}$  в низкочастотную область указывает на ассоциированный характер амидной группы [21].

Протоны метиленовой группы цикла ( $C^4H_2$ ) имидов **4а–г** являются диастереотопными и в спектрах ЯМР  $^1H$  проявляются в виде дублета дублетов в области 2.70–2.80 и 2.95–2.97 м. д. соответственно, как и протон  $C^3H$  (4.01–4.28 м. д.,  $^2J_{HH}$  18.0–18.2,  $^3J_{HH}$  4.9–5.6 и 9.0–9.1 Гц). В спектрах имеются также сигналы протонов алкиламиногрупп, бензольного, пиперидинового и морфолинового колец. Протон амидной группы имидов **4в, г** резонирует в слабом поле в виде триплета с  $\delta$  9.13–9.14 м. д. ( $^3J_{HN}$  6.0 Гц), а метиленовые протоны бензильной группы – в виде дублета с  $\delta$  4.50 м. д. В масс-спектрах соединений **4а–г** имеются пики молекулярных ионов и продуктов их фрагментации.

Таким образом, в результате проведенных исследований на основе амидов 4-аминобензойной и 4-аминофенилэтановой кислот синтезированы новые типы малеинимидов и 3- $R_2$ -диалкиламинозамещенных сукцинимидов, структура которых изучена методами масс-спектрометрии, ИК и ЯМР  $^1H$  спектроскопии.

#### ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

В работе использовали коммерческие реагенты и растворители.

ИК спектры получены на спектрофотометре ФСМ 1202 в вазелиновом масле. Спектры ЯМР  $^1H$  зарегистрированы на спектрометре Bruker DRX500 (500.13 МГц) в  $DMCO-d_6$ , внутренний стандарт – тетраметилсилан. Масс-спектры сняты на приборе Finnigan MAT INCOS-50 (энергия ионизирующих электронов 70 эВ). Элементный анализ осуществляли на анализаторе PerkinElmer 2400 CHN. Температуры плавления определяли капиллярным методом.

**(Z)-4-N-[4-(N,N-Диметилкарбамоил)фениламино]-4-оксобут-2-еновая кислота (2a).** К раствору 1.62 г (0.01 моль) N,N-диметил-4-аминобензамида **1a** в 5 мл ацетона постепенно при перемешивании добавляли раствор 0.98 г (0.01 моль) малеинового ангидрида в 3 мл ацетона. Выделившийся осадок отфильтровывали, промывали ацетоном (3×0.5 мл) и сушили на воздухе. Выход 0.16 г (57%), бесцветные кристаллы, т. пл. 165°C. ИК спектр,  $\nu$ ,  $cm^{-1}$ : 3277, 3188 [NHC(O)], 1710, 1690 (C=O), 1618 (CH=CH), 3080, 1595, 851 ( $C_6H_4$ ). Найдено, %: C 59.33; H 5.10; N 10.29.  $C_{13}H_{14}N_2O_4$ . Вычислено, %: C 59.54; H 5.38; N 10.68.

Аналогично синтезировали соединения **2б–г**.

**(Z)-4-N-[4-(N,N-Диэтилкарбамоил)фениламино]-4-оксобут-2-еновая кислота (2б)**. Выход 87%, светло-желтый порошок, т. пл. 188°C. ИК спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 3280, 3178 [NHC(O)], 1700 (C=O), 1618 (амид I), 1545 (амид II), 1634 (CH=CH), 3080, 1595, 844 ( $\text{C}_6\text{H}_4$ ). Найдено, %: С 62.19; Н 6.34; N 10.01.  $\text{C}_{15}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_4$ . Вычислено, %: С 62.06; Н 6.25; N 9.95.

**(Z)-4-Оксо-4-{4-[2-оксо-2-(пиперидин-1-ил)-этил]фениламино}бут-2-еновая кислота (2в)**. Выход 77%, желтый порошок, т. пл. 180–181°C. ИК спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 3260, 3180 [NHC(O)], 1670, 1600 (C=O), 1620 (C=C), 3060, 830 ( $\text{C}_6\text{H}_4$ ). Найдено, %: С 64.39; Н 6.22; N 8.71.  $\text{C}_{17}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_4$ . Вычислено, %: С 64.54; Н 6.37; N 8.86.

**(Z)-4-[4-N-(Бензилкарбамоил)фениламино]-4-оксобут-2-еновая кислота (2г)**. Выход 91%, светло-желтый порошок, т. пл. 197–199°C. ИК спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 3320 [NHC(O)], 1690, 1660 (C=O), 3050, 810, 750 ( $\text{C}_6\text{H}_5$ ,  $\text{C}_6\text{H}_4$ ). Найдено, %: С 66.49; Н 5.05; N 8.51.  $\text{C}_{18}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{O}_4$ . Вычислено, %: С 66.66; Н 4.97; N 8.64.

**N,N-Диметил-4-(2,5-дигидро-2,5-диоксо-1H-пиррол-1-ил)бензамид (3а)**. Смесь 0.29 г (11 ммоль) амида **2а**, 0.45 г (44 ммоль) уксусного ангидрида и 0.1 г безводного ацетата натрия нагревали при 80–85°C в течение 10 мин, затем охлаждали до комнатной температуры и размешивали с 10 мл воды. Осадок отфильтровывали, промывали водой (10×1 мл) и сушили на воздухе. Выход 0.23 г (79%), бесцветные кристаллы, т. пл. 230–232°C (ДМФА). ИК спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 1719 (C=O), 1614 (CH=CH), 3058, 848 ( $\text{C}_6\text{H}_4$ ). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м. д.: 2.93 с и 3.00 с (6H,  $\text{CH}_3$ ), 7.20 с (2H, CH=CH), 7.41 д и 7.52 д (4H,  $\text{C}_6\text{H}_4$ ,  $^3J_{\text{HH}}$  8.4 Гц). Масс-спектр,  $m/z$  ( $I_{\text{отн}}$ , %): 244 (10.6) [ $M$ ] $^+$ . Найдено, %: С 63.69; Н 5.02; N 11.59.  $\text{C}_{13}\text{H}_{12}\text{N}_2\text{O}_3$ . Вычислено, %: С 63.93; Н 4.95; N 11.47.

**N,N-Диэтил-4-(2,5-дигидро-2,5-диоксо-1H-пиррол-1-ил)бензамид (3б)**. Смесь 6.39 г (22 ммоль) амида **2б**, 3.34 г (33 ммоль) уксусного ангидрида, 0.3 г ацетата натрия и 20 мл ДМФА перемешивали при температуре 50–60°C в течение 4 ч, затем добавляли 200 мл холодной воды. Выделившийся осадок отфильтровывали, многократно промывали водой и сушили на воздухе. Выход

2.9 г (48%), бесцветные кристаллы, т. пл. 176–177°C (EtOAc). ИК спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 1700 (C=O), 1615 (CH=CH), 3045, 825 ( $\text{C}_6\text{H}_4$ ). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м. д.: 1.35 т (6H,  $\text{CH}_3$ ,  $J$  7.0 Гц Гц), 3.75 м (4H,  $\text{CH}_2$ ), 7.08 с (2H, CH=CH), 7.40 с (4H,  $\text{C}_6\text{H}_4$ ). Масс-спектр,  $m/z$  ( $I_{\text{отн}}$ , %): 272 (11.6) [ $M$ ] $^+$ . Найдено, %: С 66.39; Н 5.70; N 10.11.  $\text{C}_{15}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{O}_3$ . Вычислено, %: С 66.16; Н 5.92; N 10.29.

Соединения **3в**, **г** получали аналогично.

**N-(Пиперидин-1-ил)-2-[4-(2,5-дигидро-2,5-диоксо-1H-пиррол-1-ил)-фенил]этанамид (3в)**. Выход 82%, бесцветные кристаллы, т. пл. 139–141°C (этанол). ИК спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 1690 (C=O), 1620 (CH=CH), 3080, 820 ( $\text{C}_6\text{H}_4$ ). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м. д.: 1.37–1.44 м (4H,  $\text{CH}_2$ ), 1.53–1.58 м (2H,  $\text{CH}_2$ ), 3.43–3.46 м (4H,  $\text{CH}_2\text{N}$ ), 3.74 с [2H,  $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})$ ], 7.17 с (2H, CH=CH), 7.25 д и 7.32 д (4H,  $\text{C}_6\text{H}_4$ ,  $^3J_{\text{HH}}$  8.3 Гц). Масс-спектр,  $m/z$  ( $I_{\text{отн}}$ , %): 298 (12.2) [ $M$ ] $^+$ . Найдено, %: С 68.24; Н 6.28; N 9.54.  $\text{C}_{17}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_3$ . Вычислено, %: С 68.44; Н 6.08; N 9.39.

**N-Бензил-4-(2,5-дигидро-2,5-диоксо-1H-пиррол-1-ил)бензамид (3г)**. Выход 92%, бесцветные кристаллы, т. пл. 188–190°C (этанол). ИК спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 3280 [C(O)NH], 1705 (C=O), 1630 (CH=CH), 3080, 850, 760 ( $\text{C}_6\text{H}_5$ ,  $\text{C}_6\text{H}_4$ ). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м. д.: 4.53 д (2H,  $\text{CH}_2\text{N}$ ,  $^3J_{\text{HH}}$  6.0 Гц), 7.22 с (2H, CH=CH), 7.23–7.34 м (5H,  $\text{C}_6\text{H}_5$ ), 7.46 д и 7.99 д (4H,  $\text{C}_6\text{H}_4$ ,  $^3J_{\text{HH}}$  8.5 Гц), 9.13 т (1H, NHCO,  $^3J_{\text{HH}}$  6.0 Гц). Масс-спектр,  $m/z$  ( $I_{\text{отн}}$ , %): 306 (11.5) [ $M$ ] $^+$ . Найдено, %: С 70.44; Н 4.38; N 9.29.  $\text{C}_{18}\text{H}_{14}\text{N}_2\text{O}_3$ . Вычислено, %: С 70.58; Н 4.61; N 9.15.

**N,N-Диэтил-4-[3-(N,N-диэтиламино)-2,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1H-пиррол-1-ил]бензамид (4а)**. К суспензии 1.09 г (4 ммоль) малеинида **3б** в 3 мл 1,4-диоксана при 25°C добавляли раствор 0.293 г (4 ммоль) диэтиламина в 2 мл диоксана. После упаривания растворителя в вакууме получили густое красное масло, которое при растирании кристаллизуется. Выход 1.3 г (94%), бесцветные кристаллы, т. пл. 91–94°C (толуол). ИК спектр,  $\nu$ ,  $\text{см}^{-1}$ : 1750, 1690, 1680 (C=O), 3080, 1590, 840 ( $\text{C}_6\text{H}_4$ ). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м. д.: 1.20 т и 1.35 т (12H,  $\text{CH}_3$ ,  $^3J_{\text{HH}}$  7.0 Гц), 2.65 м (4H,  $\text{CH}_2\text{N}$ ), 2.70 м (1H,  $\text{C}^4\text{H}$ , сукцинимид), 2.95 д. д (1H,  $\text{C}^4\text{H}$ , сукцинимид,  $^2J_{\text{HH}}$  18.0,  $^3J_{\text{HH}}$  9.0 Гц), 3.35 м (4H,  $\text{CH}_2\text{NCO}$ ), 4.20 д. д. (1H,  $\text{C}^3\text{H}$ , сукцинимид,  $^3J_{\text{HH}}$  5.6,

9.0 Гц), 7.32 д и 7.43 д (4H, C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 8.5 Гц). Масс-спектр, *m/z* (*I*<sub>отн.</sub>, %): 345 (2.6) [*M*]<sup>+</sup>. Найдено, %: С 66.24; Н 7.69; N 12.29. С<sub>19</sub>H<sub>27</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>. Вычислено, %: С 66.06; Н 7.88; N 12.16.

**N-Пиперидин-1-ил-2-[4-(3-N,N-диэтиламино-2,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1H-пиррол-1-ил)фенил]этанамид (4б).** К суспензии 1.06 г (3.4 ммоль) малеинимида **3в** в 3 мл 1,4-диоксана при комнатной температуре добавляли раствор 0.25 г (3.4 ммоль) диэтиламина в 2 мл диоксана. Через 24 ч выпавший осадок отфильтровывали, сушили на воздухе. Выход 1.1 г (80%), бесцветные кристаллы, т. пл. 137–139°C (толуол). ИК спектр, *v*, см<sup>-1</sup>: 1710 (C=O), 3057, 1597, 811 (C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>). Спектр ЯМР <sup>1</sup>H, *δ*, м. д.: 1.10 т (6H, CH<sub>3</sub>, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 7.0 Гц), 1.45–1.65 м (4H, CH<sub>2</sub>, пиперидин), 2.65 м (4H, CH<sub>2</sub>N, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 7.0 Гц), 2.70 м (1H, C<sup>4</sup>H, сукцинимид), 2.95 д. д (1H, C<sup>4</sup>H, сукцинимид, <sup>2</sup>J<sub>HH</sub> 18.0, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 9.0 Гц), 3.45 м (4H, CH<sub>2</sub>N, пиперидин), 3.70 с [2H, CH<sub>2</sub>C(O)], 4.20 д. д. (1H, C<sup>3</sup>H, сукцинимид, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 5.6, 9.0 Гц), 7.15 д и 7.30 д (4H, C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 8.5 Гц). Масс-спектр, *m/z* (*I*<sub>отн.</sub>, %): 367 (1.8) [*M*]<sup>+</sup>. Найдено, %: С 67.64; Н 7.78; N 11.29. С<sub>21</sub>H<sub>29</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>. Вычислено, %: С 67.90; Н 7.78; N 11.31.

**N-Бензил-4-(3-N,N-диэтиламино-2,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1H-пиррол-1-ил)бензамид (4в).** Раствор 1.12 г (3.7 ммоль) малеинимида **3г** в 6 мл 1,4-диоксана при 25°C постепенно смешивали с раствором 0.27 г (3.7 ммоль) диэтиламина в 2 мл диоксана. Образовавшуюся суспензию нагревали 1.5 ч при 45–50°C, затем добавляли 60 мл воды. Осадок отфильтровывали, промывали водой (5×2 мл) и сушили на воздухе. Выход 1.17 г (83%), бесцветный порошок, т. пл. 155–157°C (диоксан). ИК спектр, *v*, см<sup>-1</sup>: 3346 [NHС(O)], 1707, 1640 (C=O), 3056, 3030, 1600, 824 (C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>, C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>). Спектр ЯМР <sup>1</sup>H, *δ*, м. д.: 1.03 т (6H, CH<sub>3</sub>, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 7.1 Гц), 2.62 м (4H, CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>N), 2.75 д. д (1H, C<sup>4</sup>H, сукцинимид, <sup>2</sup>J<sub>HH</sub> 18.0, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 5.6 Гц), 2.95 д. д (1H, C<sup>4</sup>H, сукцинимид, <sup>2</sup>J<sub>HH</sub> 18.0, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 9.0 Гц), 4.28 д. д (1H, C<sup>3</sup>H, сукцинимид, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 5.6, 9.0 Гц), 4.50 д (2H, PhCH<sub>2</sub>NH, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 6.0 Гц), 7.24–7.33 м (5H, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>), 7.37 д и 7.99 д (4H, C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 8.5 Гц), 9.13 т (1H, NHCO, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 6.0 Гц). Масс-спектр, *m/z* (*I*<sub>отн.</sub>, %): 379 (3.7) [*M*]<sup>+</sup>. Найдено, %: С 69.44; Н 6.48; N 11.99. С<sub>22</sub>H<sub>25</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>. Вычислено, %: С 69.64; Н 6.64; N 11.07.

**N-Бензил-4-(3-пиперидин-1-ил-2,5-диоксо-**

**2,3,4,5-тетрагидро-1H-пиррол-1-ил)бензамид (4г)** получали аналогично. Выход 80%, бесцветный порошок, т. пл. 185–187°C (диоксан). ИК спектр, *v*, см<sup>-1</sup>: 3294 [NHС(O)], 1709, 1635 (C=O), 3030, 1595, 738, 696 (C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>, C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>). Спектр ЯМР <sup>1</sup>H, *δ*, м. д.: 1.39–1.53 м [6H, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>, пиперидин], 2.44–2.48 м и 2.77–2.80 м (4H, NCH<sub>2</sub>, пиперидин), 2.80 д. д (1H, C<sup>4</sup>H, сукцинимид, <sup>2</sup>J<sub>HH</sub> 18.2, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 4.9 Гц), 2.97 д. д (1H, C<sup>4</sup>H, сукцинимид, <sup>2</sup>J<sub>HH</sub> 18.2, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 9.1 Гц), 4.01 д. д (1H, C<sup>3</sup>H, сукцинимид, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 4.9, 9.1 Гц), 4.50 д (2H, PhCH<sub>2</sub>NH, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 6.0 Гц), 7.23–7.33 м (5H, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>), 7.37 д и 7.99 д (4H, C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 8.5 Гц), 9.14 т (1H, NHCO, <sup>3</sup>J<sub>HH</sub> 6.0 Гц). Масс-спектр, *m/z* (*I*<sub>отн.</sub>, %): 391 (2.8) [*M*]<sup>+</sup>. Найдено, %: С 70.24; Н 6.08; N 10.59. С<sub>23</sub>H<sub>25</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>. Вычислено, %: С 70.57; Н 6.44; N 10.73.

#### ИНФОРМАЦИЯ ОБ АВТОРАХ

Митрасов Юрий Никитич, ORCID: <https://orcid.org/0000-0002-4083-7863>

Данилов Владимир Александрович, ORCID: <https://orcid.org/0000-0001-9140-1747>

#### КОНФЛИКТ ИНТЕРЕСОВ

Авторы заявляют об отсутствии конфликта интересов.

#### СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Михайлин Ю.А. Термоустойчивые полимеры и полимерные материалы. СПб.: Профессия, 2006. 528 с.
2. Митрасов Ю.Н., Колямишин О.А., Данилов В.А. Малейнимиды: синтез, свойства и полимеры на их основе. Чебоксары: Чуваш. гос. пед. унив., 2017. 286 с.
3. Sava M., Găină C., Găină V. // Rev. Roum. Chim. 2001. Vol. 46. P. 1167.
4. Sava M.J. Appl. Polym. Sci. 2004. Vol. 91. P. 3806. doi 10.1002/app.13548
5. Пат. 3887582 (1975). США // РЖХим. 1976. 8Н189 П.
6. Alwin K., Johan B., Theo J.D. // Polymer. 2010. Vol. 51. P. 1887. doi 10.1016/j.polymer.2010.03.015
7. Пат. 5198551 (1993). США // РЖХим. 1994. 18С279 П.
8. Milano J.S., Mekkid S., Vernet J.L. // Eur. Polym. J. 1998. Vol. 34. P. 717. doi 10.1016/S0014-3057(97)00184-5
9. Milano J.C., Mekkid S., Vernet J.L. Eur. Polym. J. 1997. Vol. 33. P. 1333. doi 10.1016/S0014-3057(96)00143-7
10. Patel J.R., Dholakiya B.Z. // Med. Chem. Res. 2012. Vol. 21. P. 1977. doi 10.1007/s00044-011-9718-x

11. Ольшевская В.А., Макаренков А.В., Короткова Н.С., Кононова Е.Г., Коновалова Н.В., Калинин В.Н. // Докл. АН. 2014. Т. 458. № 1. С. 47; *Ol'shevskaya V.A., Makarenkov A.V., Korotkova N.S., Kononova E.G., Konovalova N.V., Kalinin V.N.* // Doklady Chem. 2014. Vol. 458. Pt 1. P. 165. doi 1134/S0012500814090018
12. Patel J.R., Dhorajiya B.D., Dholakiya B.Z., Badria F.A., Ibrahim A.S. // Med. Chem. Res. 2014. Vol. 23. P. 3907. doi 10.1007/s00044-014-0965-5
13. Patel J.R., Dholakiya B.Z. // Res. Chem. Intermed. 2013. Vol. 39. P. 4159. doi 10.1007/s11164-012-0932-z
14. Пат. 583226 (1976). Швейцария // РЖХим. 1977. 14О131П.
15. Пат. 30308 (1968). Япония // РЖХим. 1970. 7Н374П.
16. Пат. 30313 (1968). Япония // РЖХим. 1970. 7Н375П.
17. Пат. 21433 (1968). Япония // РЖХим. 1969. 23Н310П.
18. Колямшин О.А., Данилов В.А., Дашкова Г.Ю., Кольцов Н.И. // ЖОрХ. 2005. Т. 41. С. 1691; *Kolyamshin O.A., Danilov V.A., Dashkova G.Yu., Kol'tsov N.I.* // Russ. J. Org. Chem. 2005. Vol. 41. N 11. P. 1657. doi 10.1007/s11178-006-0014-z
19. Колямшин О.А., Данилов В.А., Кольцов Н.И. // ЖОрХ. 2007. Т. 43. № 3. С. 395; *Kolyamshin O.A., Danilov V.A., Kol'tsov N.I.* // Russ. J. Org. 2007. Vol. 43. N 3. P. 393. doi 10.1134/S1070428007030104
20. Колямшин О.А., Митрасов Ю.Н., Данилов В.А., Авруйская А.А. // ЖОХ. 2019. Т. 89. № 9. С. 1321. doi 10.1134/S0044460X19090026; *Kolyamshin O.A., Mitrasov Yu.N., Danilov V.A., Avruiskaya A.A.* // Russ. J. Gen. Chem. 2019. Vol. 89. N 9. P. 1740. doi 10.1134/S1070363219090020
21. Преч Э., Бюльманн Ф., Аффельтер К. Определение строения органических соединений. Таблицы спектральных данных. М.: Мир; БИНОМ. Лаборатория знаний. 2013. 438 с.

## Synthesis and Some Transformations of 4-(2,5-Dihydro-2,5-dioxo-1H-pyrrol-1-yl)benzoic and -phenylacetic Acids Amides

O. A. Kolyamshin<sup>a,\*</sup>, Yu. N. Mitrasov<sup>b</sup>, V. A. Danilov<sup>a</sup>,  
Yu. Yu. Pylchikova<sup>a</sup>, and A. A. Avruyskaya<sup>b</sup>

<sup>a</sup> I.N. Ulyanov Chuvash State University, Cheboksary, 428015 Russia

<sup>b</sup> I.Ya. Yakovlev Chuvash State Pedagogical University, Cheboksary, 428000 Russia

\*e-mail: kolyamshin.oleg@yandex.ru

Received October 17, 2022; revised October 17, 2022; accepted December 21, 2022

The reactions of 4-aminobenzoic and 4-aminophenylacetic acids amides with maleic anhydride yielded the corresponding monoamides of maleic acid, the cyclization of which gave amides of 4-(2,5-dihydro-2,5-dioxo-1H-pyrrol-1-yl)benzoic and 4-(2,5-dihydro-2,5-dioxo-1H-pyrrol-1-yl)phenylethanoic acids. Their reactions with secondary amines afforded the corresponding 4-(3-dialkylamino-2,5-dioxo-2,3,4,5-tetrahydro-1H-pyrrol-1-yl)benzoic and 4-(3-dialkylamino-2,5-dioxo-2,3,4,5-tetrahydro-1H-pyrrol-1-yl)phenylethanoic acids amides.

**Keywords:** amides of 4-aminobenzoic and 4-aminophenylethanoic acids, maleic anhydride, maleinimides, succinimides