

ОДНОРЕАКТОРНЫЙ СИНТЕЗ (*E*)-3-(*N*-ВИНИЛПИРРОЛ-2-ИЛ)АКРИЛОВЫХ КИСЛОТ¹

© 2023 г. В. С. Щербакова, С. В. Мартыновская, Е. А. Гыргенова,
И. А. Ушаков, А. В. Иванов*

ФГБУН «Иркутский институт химии им. А.Е. Фаворского СО РАН», Россия, 664033 Иркутск, ул. Фаворского, 1
*e-mail: ivanov@iriokh.irk.ru

Поступила в редакцию 29.08.2023 г.

После доработки 10.09.2023 г.

Принята к публикации 11.09.2023 г.

В работе описан синтез ранее неизвестного класса *N*-винилпирролил акриловых кислот – многофункциональных мономеров и перспективных строительных блоков для тонкого органического синтеза, который был создан на фундаментальных работах академика Б.А. Трофимова, а именно синтеза неисчерпаемого класса *N*-винилпирролов.

Ключевые слова: *N*-винилпиррол-2-карбальдегиды, малоновая кислота, акриловые кислоты, конденсация Кнёвенагеля–Дёбнера

DOI: 10.31857/S0514749223100087, **EDN:** OLGKZM

ВВЕДЕНИЕ

Функционализированные пирролы известны в органической химии как класс строительных блоков для направленного дизайна широкого спектра соединений и материалов с заданными свойствами, поскольку центральный остов – пиррол, является ценным структурным элементом. Наличие карбонильной группы в пирроле позволяет получать полезные соединения, такие как карболины, цианопирролы, дивинилпирролы, различные олигопирролические системы и другие, обладающие разнообразным набором биологических активностей и используемые в высокотехнологичных материалах.

Большой потенциал представляет уже ставшая классической реакция Кнёвенагеля, хорошо известная в органической и фармацевтической химии. Она позволяет получать производные акриловых кислот из карбонильных соединений. Акриловые кислоты широко применяются, например, в производстве высокотехнологичных

полимерных материалов, лакокрасок, строительных смесей, клеев и т.д. Производные акриловых кислот используются и в фармацевтике (например, препараты Eudragit® и Carbopol®). А также являются строительными блоками при создании таких известных препаратов, как Аторвастатин® [1, 2].

Частным случаем реакции Кнёвенагеля является конденсация Кнёвенагеля–Дёбнера, а именно конденсации альдегидов с малоновой кислотой в присутствии основания (пиридина) и катализатора (пиперидина). Промежуточно образующиеся α,β -ненасыщенные дикарбоновые кислоты подвергаются декарбоксилированию с образованием α,β -ненасыщенных карбоновых кислот исключительно в *E*-конфигурации.

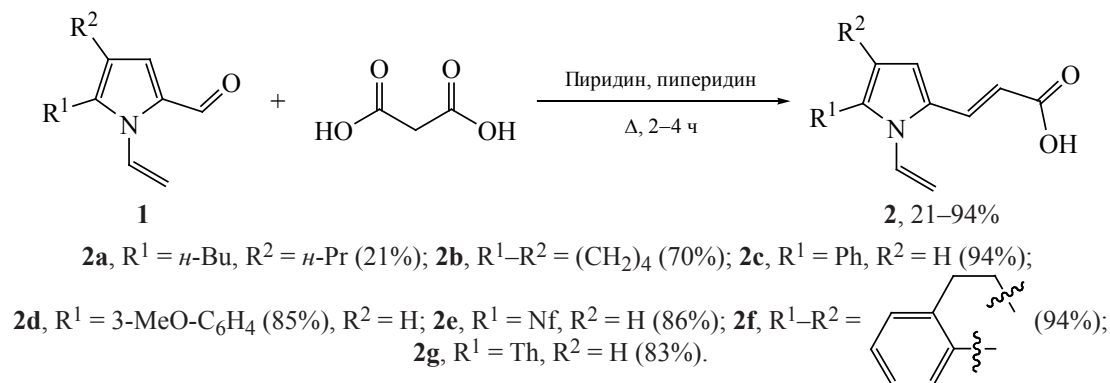
Синтез акриловых кислот, содержащих пиррольный фрагмент, в литературе известны, пирролакриловые кислоты получают различными способами, например из метилового эфира 3-(пиррол-2-ил)акриловой кислоты [3, 4].

РЕЗУЛЬТАТЫ И ОБСУЖДЕНИЕ

Распространение реакции Кнёвенагеля–Дёбнера на различные *N*-винилпиррол-2-карбаль-

¹ Статья посвящается академику РАН Б.А. Трофимову в связи с его 85-летием.

Схема 1



дегиды, ставшие доступными благодаря открытию реакции Трофимова [5], позволило открыть новые возможности для получения перспективных полифункциональных строительных блоков и предшественников лекарственных веществ. В настоящей работе нами было показано, что *N*-винилпиррол-2-карбальдегиды **1** с малоновой кислотой в условиях реакции конденсации Кнёвенагеля–Дёбнера образуют соответствующие ранее неизвестные *N*-винилпирролил-акриловые кислоты (схема 1).

Синтез осуществляли следующим образом: в круглодонной колбе с обратным холодильником растворяли малоновую кислоту в сухом пиридине, добавляли раствор *N*-винилпиррол-2-карбальдегида **1** в пиридине и пиперидин. Реакционную смесь нагревали на масляной бане 100–120°C в течение 2–5 ч до прекращения выделения CO_2 . По истечении времени реакционную смесь охлаждали, выливали в емкость, содержа-

щую смесь льда и 2н раствора HCl , отфильтровывали выпавший осадок. Сырой продукт перекристаллизовывали и сушили под вакуумом.

Как видно из схемы 1, выходы полученных акриловых кислот варьируются в широком диапазоне и зависят от природы заместителя в пиррольном кольце. В случае электроноакцепторных заместителей в *N*-винилпиррол-2-карбальдегидах **2c**, **d**, **e**, **f**, **g** реакция протекает с высокой конверсией, приводя к целевым акриловым кислотам с выходами 83–94%, тогда как конверсия *N*-винилпиррол-2-карбальдегидов **2a**, **b** с алкильными заместителями невелика и составляет 66–68%. Выходы **2a**, **b** приведены с учетом возвращенных из реакции *N*-винилпиррол-2-карбальдегидов **2a**, **b**.

Согласно классическим представлениям о механизме, представленным в литературе, реакция начинается с депротонирования малоновой кисло-

Схема 2

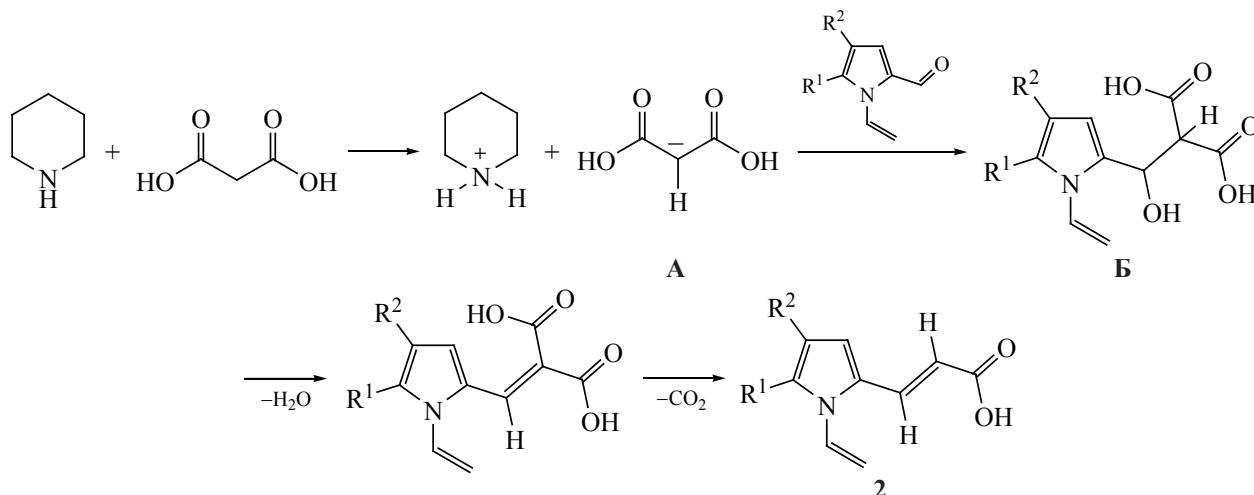
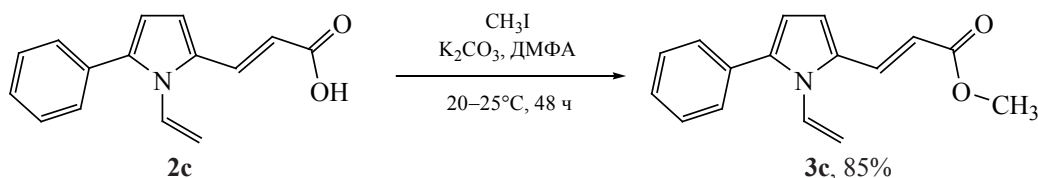


Схема 3



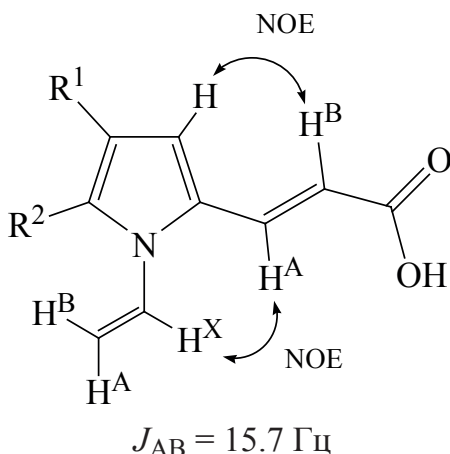
ты пиперидином, в результате чего образуется карбанион **A**, который вступает в альдольную конденсацию с альдегидной группой пиррольного кольца с образованием интермедиата **B**. Далее происходит дегидратация и последующее декарбоксилирование с образованием акриловых кислот **2** (схема 2).

На примере *N*-винил-5-фенилпиррол-2-карбальдегида **1c** установлено, что понижение температуры от 100 до 20–25°C, приводит к увеличению времени реакции (8 ч), а также к неполной конверсии исходного альдегида (40%).

На примере (*E*)-3-(5-фенил-*N*-винил-1*H*-пиррол-2-ил)акриловой кислоты **2c** была проведена реакция алкилирования, при этом был получен метил (*E*)-3-(5-фенил-*N*-винил-1*H*-пиррол-2-ил)-акрилат с выходом **3c** 95% (схема 3).

Структура полученных акриловых кислот **2** была доказана ЯМР ^1H , ^{13}C , ИК-спектроскопией и элементным анализом. Методом спектроскопии 2D ЯМР COSY и NOESY доказано, что в продукт реакции образуется исключительно в виде *E*-изомера, о чем свидетельствуют константы спин-спинового взаимодействия между протонами (схема 4).

Схема 4



ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

ИК спектры получали на спектрометре Varian 3100 FT-IR. Спектры ЯМР записаны на спектрометрах Bruker DPX-400 и AV-400 (400.1 МГц для ^1H , 100.6 МГц для ^{13}C и 40.5 МГц для ^{15}N) в $\text{DMSO}-d_6$. Отнесение сигналов в спектрах ЯМР ^1H выполнено с использованием экспериментов COSY и NOESY. Микроанализы выполнены на элементном анализаторе FlashEA 1112 Series. Температуры плавления (без поправок) измеряли на приборе Кофлера с микротермальной площадкой. Все химические вещества и растворители имеются в продаже и использовались без дополнительной очистки.

Синтез *N*-винилпирролил акриловых кислот. В круглодонную колбу, снабженную магнитной мешалкой, обратным холодильником помещали 0.266 г (0.002 моль) малоновой кислоты, *N*-винилпиррол-2-карбальдегида **1** (0.002 моль), 0.218 г (0.002 моль) пиперидина и 17.4 мл (0.224 моль) пиридина. Реакционную смесь нагревали на масляной бане при температуре от 100 до 120°C в течение 2–5 ч. Реакция считается оконченной по прекращению выделения углекислого газа. Далее реакционную смесь охлаждали и выливали в стакан, содержащий смесь льда и 2н водного раствора HCl (для удаления непрореагировавшего пиперидина), отфильтровывали выпавший осадок, промывали гексаном и получали чистый продукт в виде порошков.

(*E*)-3-(*N*-Винил-5-бутил-4-пропил-1*H*-пиррол-2-ил)акриловая кислота (2a**).** Время реакции 5 ч. Выход 0.073 г (21%), (конверсия **1b** 0.290 г, 66.2%), порошок кремового цвета, т.пл. 93–94°C. ИК спектр (KBr), ν , cm^{-1} : 3468 (OH), 1681 (C=O), 1605 (C=C), 1265 (OH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м.д.: 0.94 т (3H, CH_3 , J 7.3 Гц), 0.98 т (3H, CH_3 , J 7.3 Гц), 1.38 м (2H, CH_2), 1.48 м (2H, CH_2), 1.59 м (2H, CH_2), 2.38 м (2H, CH_2), 2.59 м (2H, CH_2), 5.20 д (1H, H^B , J 15.6 Гц), 5.40 д (1H, H^A , J 8.4 Гц), 6.10 д (1H, $\text{H}_{\text{акрил.к-ты}}$, J 15.6 Гц), 6.65 с (1H, $\text{H}_{\text{пиррол}}$), 6.80

к (1H, H^X , J 8.4, 15.6 Гц), 7.73 д (1H, $H_{\text{акрил.к-ты}}$, J 15.6 Гц), 11.08 уш.с (1H, OH). Спектр ЯМР ^{13}C , δ , м.д.: 14.1 (CH_3), 13.9 (CH_3), 28.0 (2CH_2), 31.8 (3CH_2), 110.1 (C^β), 113.8 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 114.0 ($\text{C}=\text{C}$), 123.8 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 127.4 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 130.4 (C^α), 135.6 ($\text{C}=\text{C}$), 136.1 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 173.3 (COOH). Найдено, %: C 73.84; H 8.70; N 5.38. $\text{C}_{16}\text{H}_{22}\text{NO}_2$. Вычислено, %: C 73.53; H 8.87; N 5.36.

(E)-3-(N-Винил-4,5,6,7-тетрагидро-1H-индол-2-ил)акриловая кислота (2b). Время реакции 4.5 ч. Выход 0.207 г (70%), (конверсия 7с 0.239 г, 68.2%). Порошок черного цвета, т.пл. 146–150°C. ИК спектр (KBr), ν , cm^{-1} : 3432 (OH), 1654 ($\text{C}=\text{O}$), 1598 ($\text{C}=\text{C}$), 1256 (OH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м.д.: 1.64 м (2H, CH_2), 1.70 м (2H, CH_2), 2.41 м (2H, CH_2), 2.56 м (2H, CH_2), 5.09 д (1H, H^B , J 15.7 Гц), 5.22 д (1H, H^A , J 8.8 Гц), 6.05 д (1H, $H_{\text{акрил.к-ты}}$, J 15.7 Гц), 6.60 с (1H, $H_{\text{пиррол}}$), 6.98 к (1H, H^X , J 8.8, 15.6 Гц), 7.48 д (1H, $H_{\text{акрил.к-ты}}$, J 15.7 Гц), 11.96 уш.с (1H, OH). Спектр ЯМР ^{13}C , δ , м.д.: 22.3 (CH_2), 22.7 (CH_2), 22.7 (CH_2), 22.5 (CH_2), 110.0 (C^β), 111.7 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 112.2 ($\text{C}=\text{C}$), 120.1 ($\text{C}_{\text{индол}}$), 127.1 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 130.1 (C^α), 132.6 ($\text{C}=\text{C}$), 133.1 ($\text{C}_{\text{индол}}$), 168.4 (COOH). Найдено, %: C 71.63; H 6.79; N 6.54. $\text{C}_{13}\text{H}_{15}\text{NO}_2$ (217.26). Вычислено, %: C 71.87; H 6.96; N 6.45.

(E)-3-(N-Винил-5-фенил-1H-пиррол-2-ил)-акриловая кислота (2с). Время реакции 2.5 ч. Выход 0.450 г (94%). Порошок темно-зеленого цвета, т.пл. 170–172°C. ИК спектр (KBr), ν , cm^{-1} : 3439 (OH), 1671 ($\text{C}=\text{O}$), 1596 ($\text{C}=\text{C}$), 1269 (OH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м.д.: 5.10 д (1H, H^B , J 15.6 Гц), 5.46 д (1H, H^A , J 8.3 Гц), 6.27 д (1H, $H_{\text{акрил.к-ты}}$, J 15.7 Гц), 6.45 д (1H, $H_{\text{пиррол}}$), 7.00 д (1H, $H_{\text{пиррол}}$), 7.02 к (1H, H^X , J 8.3, 15.6 Гц), 7.33 м (1H, $H_{\text{арил}}$), 7.41 д (1H, $H_{\text{арил}}$, J 15.6 Гц), 7.46 д (1H, $H_{\text{арил}}$, J 15.6 Гц), 7.56 д (1H, $H_{\text{акрил.к-ты}}$, J 15.7 Гц), 12.14 уш.с (1H, OH). Спектр ЯМР ^{13}C , δ , м.д.: 111.4 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 112.5 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 114.3 ($\text{C}=\text{C}$), 115.2 (C^β), 127.4 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 128.3 ($2\text{C}_{\text{арил}}$), 128.4 ($2\text{C}_{\text{арил}}$), 130.1 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 131.4 (C^α), 131.8 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 132.6 ($\text{C}=\text{C}$), 136.9 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 167.9 (COOH). Найдено, %: C 75.69; H 5.56; N 6.12. $\text{C}_{15}\text{H}_{13}\text{NO}_2$. Вычислено, %: C 75.30; H 5.48; N 5.85.

(E)-3-[N-Винил-5-(3-метоксифенил)-1H-пиррол-2-ил]акриловая кислота (2d). Время реакции 4 ч. Выход 0.458 г (85%). Порошок темно-желтого

цвета, т.пл. 142–144°C. ИК спектр (KBr), ν , cm^{-1} : 3463 (OH), 1676 ($\text{C}=\text{O}$), 1588 ($\text{C}=\text{C}$), 1258 (OH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м.д.: 3.77 с (3H, OCH_3), 5.11 д (1H, H^B , J 15.7 Гц), 5.47 д (1H, H^A , J 8.3 Гц), 6.27 д (1H, $H_{\text{акрил.к-ты}}$, J 15.7 Гц), 6.46 д (1H, $H_{\text{пиррол}}$, J 3.9 Гц), 6.89 м (1H, $H_{\text{арил}}$), 6.98 д (1H, $H_{\text{пиррол}}$, J 3.9 Гц), 6.99 м (1H, $H_{\text{арил}}$), 7.02 к (1H, H^X , J 8.3, 15.7 Гц), 7.04 м (1H, $H_{\text{арил}}$), 7.33 м (1H, $H_{\text{арил}}$), 7.56 д (1H, $H_{\text{акрил.к-ты}}$, J 15.7 Гц), 12.16 уш.с (1H, OH). Спектр ЯМР ^{13}C , δ , м.д.: 55.1 (OCH_3), 111.6 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 112.5 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 113.9 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 114.5 ($\text{C}=\text{C}$), 115.2 (C^β), 120.7 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 129.6 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 130.18 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 131.5 (C^α), 132.7 ($\text{C}=\text{C}$), 133.1 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 136.8 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 159.2 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 168.1 (COOH). $\text{C}_{16}\text{H}_{15}\text{NO}_3$. Найдено, %: C 69.91; H 5.54; N 5.34. Вычислено, %: C 71.36; H 5.68; N 5.20.

(E)-3-[N-Винил-5-(2-нафтил)-1H-пиррол-2-ил]акриловая кислота (2е). Время реакции 4 ч. Выход 0.498 г (86%). Порошок коричневого цвета, т.пл. 175–177°C. ИК спектр (KBr), ν , cm^{-1} : 3486 (OH), 1670 ($\text{C}=\text{O}$), 1600 ($\text{C}=\text{C}$), 1270 (OH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м.д.: 5.13 д (1H, H^B , J 15.7 Гц), 5.48 д (1H, H^A , J 8.3 Гц), 6.31 д (1H, $H_{\text{акрил.к-ты}}$, J 15.7 Гц), 6.58 д (1H, $H_{\text{пиррол}}$, J 3.9 Гц), 7.05 д (1H, $H_{\text{пиррол}}$, J 3.9 Гц), 7.13 к (1H, H^X , J 15.7 Гц), 7.51 с (1H, $H_{\text{нафтил}}$), 7.53 с (1H, $H_{\text{нафтил}}$), 7.59 с (1H, $H_{\text{нафтил}}$), 7.62 д (1H, $H_{\text{акрил.к-ты}}$, J 15.7 Гц), 7.91 с (1H, $H_{\text{нафтил}}$), 7.93 с (1H, $H_{\text{нафтил}}$), 7.94 с (1H, $H_{\text{нафтил}}$), 8.00 с (1H, $H_{\text{нафтил}}$), 12.14 уш.с (1H, OH). Спектр ЯМР ^{13}C , δ , м.д.: 112.1 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 112.7 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 114.5 ($\text{C}=\text{C}$), 115.5 (C^β), 126.5 ($\text{C}_{\text{нафтил}}$), 126.8 ($\text{C}_{\text{нафтил}}$), 127.9 ($\text{C}_{\text{нафтил}}$), 129.3 ($\text{C}_{\text{нафтил}}$), 130.4 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 131.5 (C^α), 132.7 ($\text{C}=\text{C}$), 136.9 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 168.1 (COOH). Найдено, %: C 78.95; H 5.15; N 4.90. $\text{C}_{19}\text{H}_{15}\text{NO}_2$. Вычислено, %: C 78.87; H 5.23; N 4.84.

(E)-3-(N-Винил-4,5дигидро-1H-бензо[g]индол-2-ил)акриловая кислота (2f). Время реакции 2 ч. Выход 0.499 г (94%). Порошок желтого цвета, т.пл. 182–184°C. ИК спектр (KBr), ν , cm^{-1} : 3429 (OH), 1603 ($\text{C}=\text{C}$), 1686 ($\text{C}=\text{O}$), 1272 (OH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м.д.: 2.59 м (2H, $H_{\text{арил}}$), 2.81 м (2H, $H_{\text{арил}}$), 5.30 д (1H, H^B , J 15.4 Гц), 5.64 д (1H, H^A , J 8.1 Гц), 6.25 д (1H, $H_{\text{акрил.к-ты}}$, J 15.7 Гц), 6.85 с (1H, $H_{\text{пиррол}}$), 7.10 м (1H, $H_{\text{арил}}$), 7.20 м (1H, $H_{\text{арил}}$), 7.23 к (1H, H^X , J 8.2, 15.6 Гц), 7.27 м (1H, $H_{\text{арил}}$), 7.12 д (1H, $H_{\text{акрил.к-ты}}$, J 15.7 Гц), 7.54 д (1H, $H_{\text{арил}}$, J 15.7 Гц), 7.57 м (1H, $H_{\text{арил}}$), 12.06 уш.с (1H,

ОН). Спектр ЯМР ^{13}C , δ , м.д.: 21.5 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 29.7 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 110.3 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 113.8 ($\text{C}=\text{C}$), 115.9 (C^{β}), 121.9 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 123.9 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 125.9 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 126.4 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 128.2 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 128.4 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 129.8 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 131.4 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 132.1 (C^{α}), 132.1 ($\text{C}=\text{C}$), 136.4 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 167.9 (COOH). Найдено, %: C 76.83; H 5.72; N 5.25. $\text{C}_{17}\text{H}_{15}\text{NO}_2$. Вычислено, %: C 76.96; H 5.70; N 5.28.

(E)-3-[N-Винил-5-(2-тиенил)-1H-пиррол-2-ил]акриловая кислота (2g). Время реакции 2 ч. Выход 0.407 г (83%). Порошок зеленого цвета, т.пл. 170–172°C. ИК спектр (KBr), ν , cm^{-1} : 3503 (ОН), 1676 ($\text{C}=\text{O}$), 1628 ($\text{C}=\text{C}$), 1271 (ОН). Спектр ЯМР ^1H , δ , м.д.: 5.29 д (1H, H^{B} , J 15.6 Гц), 5.61 д (1H, H^{A} , J 8.2 Гц), 6.28 д (1H, $\text{H}_{\text{акрил. к-ты}}$, J 15.7 Гц, 1H), 6.51 д (1H, $\text{H}_{\text{пиррол}}$, J 3.9 Гц), 6.98 д (1H, $\text{H}_{\text{пиррол}}$, J 3.9 Гц), 7.07 к (1H, H^{X} , J 8.2, 15.6 Гц), 7.10 д.д (1H, $\text{H}_{\text{тиенил}}$, J 3.6, 5.0 Гц), 7.23 д.д (1H, $\text{H}_{\text{тиенил}}$, J 1.0, 3.6 Гц), 7.52 д (1H, $\text{H}_{\text{акрил. к-ты}}$, J 15.7 Гц), 7.53 д.д (1H, $\text{H}_{\text{тиенил}}$, J 1.0, 5.0 Гц), 12.10 уш.с (1H, ОН). Спектр ЯМР ^{13}C , δ , м.д.: 111.29 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 112.4 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 114.64 ($\text{C}=\text{C}$), 116.8 (C^{β}), 125.9 ($\text{C}_{\text{тиенил}}$), 126.0 ($\text{C}_{\text{тиенил}}$), 127.7 ($\text{C}_{\text{тиенил}}$), 130.1 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 130.3 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 131.0 (C^{α}), 132.3 ($\text{C}=\text{C}$), 133.1 ($\text{C}_{\text{тиенил}}$), 167.8 (COOH). Найдено, %: C 63.21; H 4.67; N 6.11; S 12.95. $\text{C}_{13}\text{H}_{11}\text{NO}_2\text{S}$. Вычислено, %: C 63.65; H 4.52; N 5.70; S 13.07.

Синтез метил-3-(5-фенил-N-винилпирролил)акрилата. Смесь 5-фенил-N-винилпирролил акриловой кислоты **2c** (0.002 моль) и карбоната калия 0.276 г (0.002 моль) в ДМФА (4 мл) перешивали в течение 10 мин. Затем добавляли иодметан 0.426 г (0.003 моль). Реакционную смесь перемешивали 48 ч при комнатной температуре. По истечению времени разбавляли насыщенным раствором NaHCO_3 и экстрагировали диэтиловым эфиром (5×15 мл). Эфирные экстракты промывали H_2O (5×15 мл), затем сушили над MgSO_4 . Удаляли растворитель и очищали колоночной хроматографией (Al_2O_3 , смесь гексан–диэтиловый эфир 4:1).

(E)-Метил-3-(5-фенил-N-винил-1H-пиррол-2-ил)акрилат (3c). Выход 0.43 г (85%). Масло коричневого цвета. Спектр ЯМР ^1H , δ , м.д.: 3.12 с (3H, CH_3), 4.58 д (1H, H^{B} , J 15.7 Гц), 4.76 д (1H, H^{A} , J 15.7 Гц), 5.56 д (1H, $\text{H}_{\text{акрил. к-ты}}$, J 15.7 Гц), 5.67 д (1H, $\text{H}_{\text{пиррол}}$, J 3.6 Гц), 6.11 д (1H, $\text{H}_{\text{пиррол}}$, J 3.6 Гц), 6.22 к (1H, H^{X} , J 8.2, 15.7 Гц), 6.65–6.77 м (5H_{арил}), 7.06 д (1H, $\text{H}_{\text{акрил. к-ты}}$, J 15.7 Гц).

Спектр ЯМР ^{13}C , δ , м.д.: 48.2 (CH_3), 94.5 (C^{β}), 108.7 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 109.7 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 111.2 ($\text{C}=\text{C}$), 124.7 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 125.6 (2 $\text{C}_{\text{арил}}$), 126.2 (2 $\text{C}_{\text{арил}}$), 127.7 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 128.5 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 130.4 ($\text{C}_{\text{арил}}$), 133.1 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 134.6 ($\text{C}_{\text{пиррол}}$), 163.6 (COOH). Найдено, %: C 75.90; H 5.92; N 5.63. $\text{C}_{16}\text{H}_{15}\text{NO}_2$. Вычислено, %: C 75.87; H 5.97; N 5.53.

ЗАКЛЮЧЕНИЕ

Таким образом, нами впервые был осуществлен стереоселективный синтез ранее неизвестных (E)-3-(N-винилпиррол-2-ил)акриловых кислот **2a–g**, ставший возможным благодаря систематическому изучению реакции Трофимова, сделавшей доступными замещенные N-винилпирролы – удобную платформу для дальнейшего дизайна многочисленных синтонов. В свою очередь, полученные пирролилакриловые кислоты являются перспективными мономерами, строительными блоками для создания высокотехнологичных материалов и перспективными биологически активными веществами, пригодными для применения в фармацевтической химии.

БЛАГОДАРНОСТИ

Авторы работы поздравляют академика Бориса Александровича Трофимова с 85-летием, благодарят за плодотворную совместную работу и гордятся правом быть частью классической школы академика Трофимова.

ФОНДОВАЯ ПОДДЕРЖКА

Работа была выполнена при финансировании Министерства науки и образования и Российской академии наук (Рег. № НИОКТР 122041100031-5). Работа выполнена с использованием оборудования Байкальского аналитического центра коллективного пользования СО РАН.

ИНФОРМАЦИЯ ОБ АВТОРАХ

Щербакова Виктория Сергеевна, ORCID: <https://orcid.org/0000-0003-4594-1034>

Мартыновская Светлана Валерьевна ORCID: <https://orcid.org/0000-0001-6237-8533>

Гыргенова Елена Андреевна ORCID: <https://orcid.org/0000-0001-6018-1462>

Иванов Андрей Викторович ORCID: <https://orcid.org/0000-0002-0430-3215>

КОНФЛИКТ ИНТЕРЕСОВ

Авторы заявляют об отсутствии конфликта интересов.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Roth B.D. Pat. 5273995 (1993). США.
2. Li J.J., Johnson D.S., Sliskovic D.R., Roth B.D. *Contemporary Drug Synthesis*. New Jersey: Wiley-Interscience, 2004.
3. You H., Youn H.-S., Im I., Bae M.-H., Lee S.-K., Ko H., Eom S.H., Kim Y.-Ch. *Eur. J. Med. Chem.* **2011**, 46, 1153–1164. doi 10.1016/j.ejmech.2011.01.034
4. Kancharla P., Kelly J.X., Reynolds K.A. *J. Med. Chem.* **2015**, 58, 7286–7309. doi 10.1021/acs.jmedchem.5b00560
5. Trofimov B.A., Mikhaleva A.I. *Chem. Heterocycl. Compd.* **1980**, 10, 979–991. doi doi.org/10.1007/BF00496592

One-Pot Synthesis of (*E*)-3-(*N*-Vinylpyrro-2-yl)acrylic Acids

V. S. Shcherbakova, S. V. Martynovskaya, E. A. Gyrgenova, I. A. Ushakov, and A. V. Ivanov*

A.E. Favorskii Irkutsk institute of chemistry SB RAS, ul. Favorskogo, 1, Irkutsk, 664033 Russia

**e-mail: ivanov@irioch.irk.ru*

Received August 29, 2023; revised September 10, 2023; accepted September 11, 2023

The paper describes the synthesis of a previously unknown class of *N*-vinylpyrrolyl acrylic acids – multifunctional monomers and promising building blocks for fine organic synthesis, which was created on the basis of the fundamental works of academician Trofimov B.A., namely the synthesis of an inexhaustible class of *N*-vinylpyrroles.

Keywords: *N*-vinylpyrrol-2-carbaldehydes, malonic acid, acrylic acids, Knevenagel–Debner condensation