

OR-28

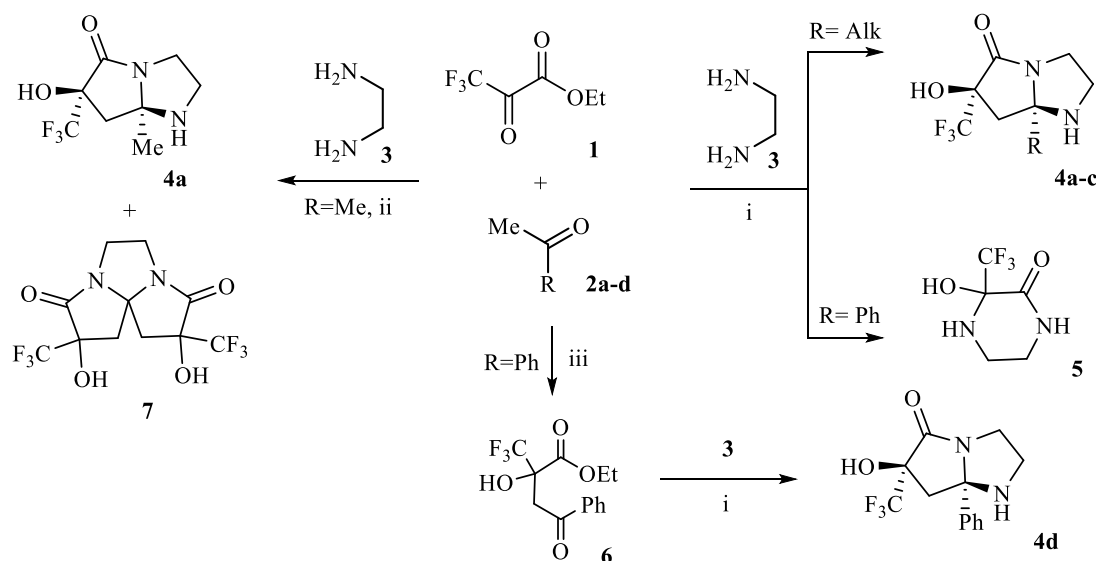
ЭТИЛ ТРИФТОРПИРУВАТ В РЕАКЦИЯХ С МЕТИЛКЕТОНАМИ И ЭТИЛЕНДИАМИНОМ

Фефелова О. А.^{1,2}, Горяева М. В.², Бургарт Я. В.², Салоутин В. И.²

¹Институт естественных наук и математики УрФУ,
620026, г. Екатеринбург, ул. Куйбышева, 48

²Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского УрО РАН,
620108, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, 22 / Академическая, 20
E-mail: kisskiss051099@gmail.com

Этил трифторпируват **1** является универсальным и доступным реагентом в синтезе разнообразных гетероциклических соединений. В докладе обсуждаются возможности трехкомпонентных реакций этил трифторпирувата **1** с метилкетонами **2a-d** и этилендиамином **3** для получения трифторметил-содержащих азагетероциклов. Найдено, что циклизации с алкилметилкетонами **2a-c** проходят диастереоселективно с образованием *цис*-диастереомеров гексагидропиролло[1,2-*a*]имидазолонов **4a-c**. Однако при использовании ацетофенона **2d** трехкомпонентная реакция не реализуется, а основным продуктом становится пиперазинон **5**, образующийся без участия метилкетонной компоненты **2**. Синтез целевого бицикла **4d** с встраиванием ацетофенона **2d** реализован через предварительное получение альдоля **6**, продукта присоединения ацетофенона **2d** к трифторацильной группе пирувата **1**. Далее альдол **6** реагирует с этилендиамином **3**, формируя *цис*-изомер гексагидропиролло[1,2-*a*]имидазолона **4d**.



Условия: (i) 1,4-диоксан, 22°C; (ii) 1,4-диоксан, MW, 60°C; (iii) L-пролин, ДМФА, MW, 50°C;
R= Me (**a**), Et (**b**), Bu (**c**), Ph (**d**).

Трехкомпонентные реакции проходят в мягких условиях за 3–5 дней. С целью ускорения процесса были изучены различные реакционные условия на примере циклизации пирувата **1** с этилендиамином **3** и ацетоном **2a**. Оказалось, что взаимодействие этих трех компонент при нагревании в микроволновом реакторе приводит к формированию смеси двух продуктов: основному – бициклу **4a** и минорному – дипиролло[1,2-*a*:2',1'-*b*]имидазол-3,8-диону **7**. Использование в этих превращениях двойного избытка пирувата **1** приводит к преимущественному формированию трициклического продукта **7**.

В докладе рассматриваются спектральные характеристики новых соединений **4a-d**, на основе которых установлено их диастереомерное строение.

Работа выполнена в рамках темы государственного задания АААА-А19-119011790132-7.