

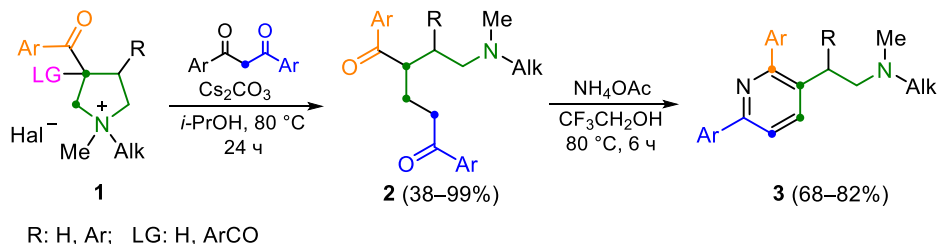
СИНТЕЗ 3-(2-АМИНОЭТИЛ)ПИРИДИНОВ ИЗ ЧЕТВЕРТИЧНЫХ АММОНИЕВЫХ СОЛЕЙ 3-БЕНЗОИЛПИРРОЛИДИНОВ

Хардина П.А., Бувев Е.М., Мошкин В.С., Сосновских В.Я.

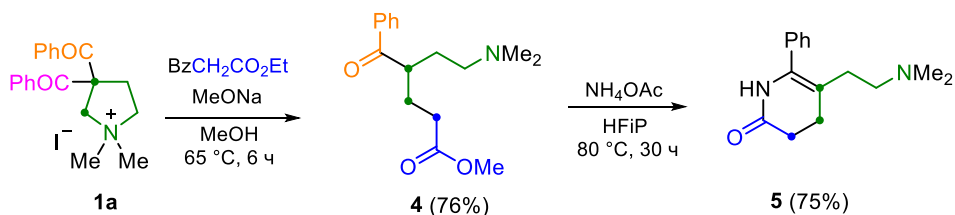
Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

Поиск новых методов синтеза биологически активных соединений является одним из краеугольных камней органического синтеза. В данной работе мы предложили способ получения фармакофорного скелета 2-аминоэтилпиридина, обладающего сродством к дофаминовым и никотиновым ацетилхолиновым рецепторам, из легкодоступных четвертичных аммониевых солей 3-бензоилпирролидинов **1**.

Использование пирролидинов в качестве исходных субстратов позволяет легко ввести в конечную структуру различные заместители сразу в несколько положений. Так, нагревание смеси кватернатов пирролидинов **1** и метиленактивных соединений в присутствии карбоната цезия в изопропанол при 80 °С приводит к образованию 1,5-дикетонов **2** с выходами от 38% до количественных. Нагревание последних в присутствии ацетата аммония позволяет получить пиридины **3** с выходами от 68 до 82%.



Помимо синтеза пиридинов данный подход удалось применить для получения не менее интересных 3,4-дигидропиридонов **5**. Так, нагревание раствора кватерната пирролидина **1a** с этил бензоилацетатом в метаноле в присутствии метилата натрия приводит к кетозэфиру **4**, нагревание которого с ацетатом аммония ведет к образованию дигидропиридона **5** с выходом 55% на две стадии.



Работа выполнена при финансовой поддержке Российского Научного Фонда (Грант 22-73-10008).