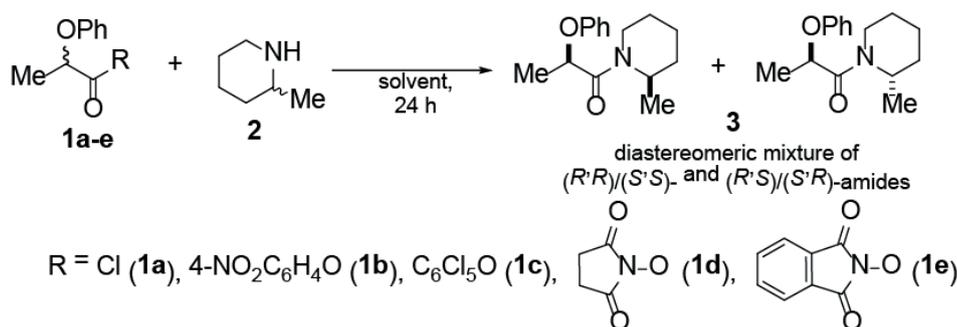


КИНЕТИЧЕСКОЕ РАЗДЕЛЕНИЕ 2 ПИПЕКОЛИНА АКТИВИРОВАННЫМИ ЭФИРАМИ (RS)-2-ФЕНОКСИПРОПИОНОВОЙ КИСЛОТЫ

Вакаров С.А., Левит Г.Л., Краснов В.П.

Институт органического синтеза им. И.Я. Постовского УрО РАН,
620990, Россия, Екатеринбург, ул. С. Ковалевской/Академическая, 22/20
e-mail: savakarov@ios.uran.ru

Ранее мы разработали методы получения индивидуальных энантиомеров гетероциклических ариламинов в результате кинетического разделения (КР) их рацематов хлорангидридом (R)-1a.^{1,2} Однако этот реагент оказался неэффективен для КР рацемических алкиламинов. В настоящей работе мы провели взаимное КР (RS)-2-пипеколина (2) и активированных эфиров (RS)-2-феноксипропионовой кислоты 1b-e в ходе диастереоселективного ацилирования в толуоле при +20°C. Реакция амина (RS)-2 и эфиров (RS)-1b-e приводила к смеси (R,S)/(S,R)- и (R,R)/(S,S)-диастереомеров амидов 3. Соотношение образующихся диастереомеров, равное фактору селективности (s), определяли методом ГЖХ. Показано, что ацилирование сукцинимидил-2-феноксипропионатом (1d) протекает наиболее селективно (s 14). С целью выбора оптимального растворителя, ацилирование рацемического амина 2 рацемическим эфиром 1d проведено в C₆H₅Cl, CH₂Cl₂, CHCl₃, CCl₄, MeAc, MeCN, EtOAc, ТГФ, Et₂O, MeOH. Наилучший стереохимический результат получен в CHCl₃ (s 19).



Полученные данные свидетельствуют о перспективности использования сукцинимидил-2-феноксипропионата (1d) в качестве хирального разделяющего агента для КР рацемических гетероциклических алкиламинов.

Литература

1. Vakarov S.A., Gruzdev D.A., Chulakov E.N. et al. Tetrahedron: Asymmetry, 2016, 27, 1231.
2. Вакаров С.А., Груздев Д.А., Чулаков Е.Н., Левит Г. Л., Краснов В.П. Изв. АН. Сер. хим., 2019, 4, 841.

Работа выполнена при финансовой поддержке РФФИ, проект 18-33-00027 мол_а.