

Синтез хиральных 2-(1-диметиламиноэтил)фениларилкетонов

Мараев Михаил Викторович

студент

Кузнецова Анастасия Александровна

аспирант

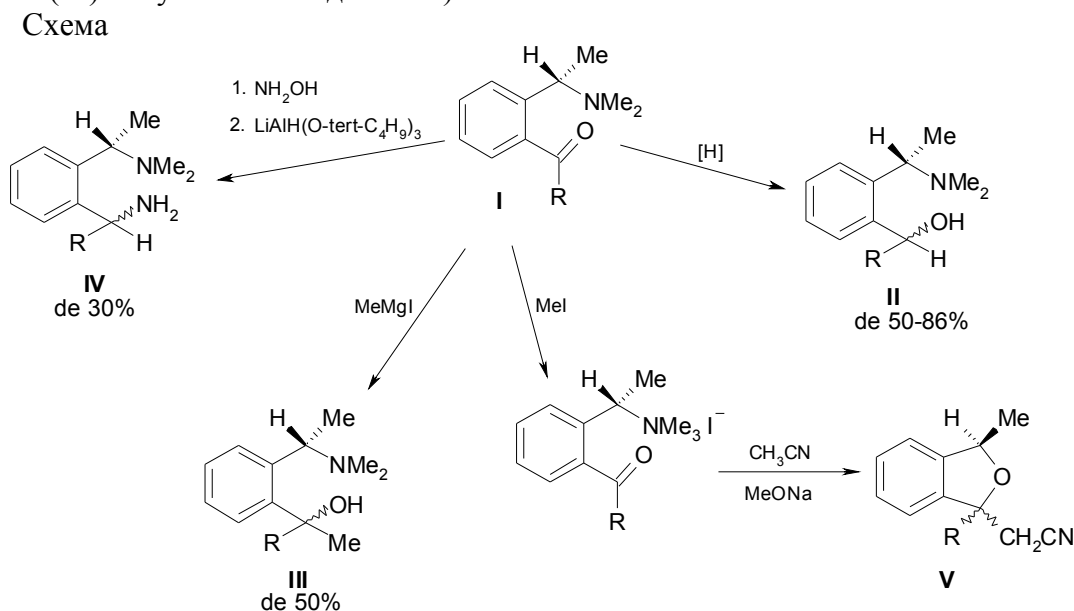
Московский государственный университет им. М.В. Ломоносова, Москва, Россия

E-mail: borvia@yandex.ru

Получение оптически активных соединений, несмотря на значительные успехи в последние два десятилетия, остается важной проблемой современной органической химии. Ее решение сводится к поиску как новых хиральных реагентов для расщепления и асимметрического синтеза, так и легко доступных в виде обоих энантиомеров предшественников более сложных структур.

На кафедре органической химии МГУ разработан метод функционализации 1-фенилэтиламина через стадию орто-литиирования и синтезирована большая серия хиральных δ -аминоспиртов (АС), которые проявили высокую асимметризирующую способность в реакциях присоединения по C=O[1] связи, а также послужили исходными веществами для синтеза хиральных 1,3-дигидроизобензофуранов (фталанов, {ФН}) [2], фрагмент которых входит в состав некоторых лекарственных препаратов, используемых для лечения старческого слабоумия. Однако полученные АС и ФН имеют ограниченные синтетические возможности из-за отсутствия реакционноспособных групп.

Нами разработан метод синтеза хиральных 2-(1-диметиламиноэтил)-фениларилкетонов литированием (S)-(-)-N,N-диметил-1-фенилэтиламина и последующей конденсацией Li-производного с ацилхлоридами при -78°C . Получены аминокетоны I, строение которых доказано методами ИК- и ^1H ЯМР-спектроскопии, а аминокетона Ia дополнительно методом РСА. Некоторые кетоны были использованы для синтеза вторичных (II) и третичных аминоспиртов (III), диамина (IV), а также функционально замещенных фталанов (V) (схема; приведены значения диастереомерной чистоты (de) полученных соединений).



$\text{R}=\text{C}_6\text{H}_4\text{-X}$: X=H (a); o-Me, m-Me, p-Me, p-*tert*-Bu, o-F, p-F; 2,4-Me₂-C₆H₃

Литература

1. V.M.Demyanovich, I.N.Shishkina, N.S.Zefirov. Chirality.2004.V.16. № 8. P.486-492.
2. И.Н.Шишкина, А.А.Кузнецова, А.С.Бородков, В.М.Демьянович, К.А.Потехин, Н.С.Зефирова. Доклады РАН. 2005. Т.405. №2. С.213-217.