

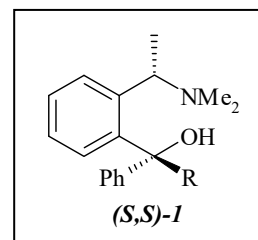
ХИРАЛЬНЫЕ *ОРТО*-ЗАМЕЩЕННЫЕ 1- АРИЛЭТАНАМИНЫ В АСИММЕТРИЧЕСКОМ СИНТЕЗЕ.

И.Н.Шишкина, В.М.Демьянович

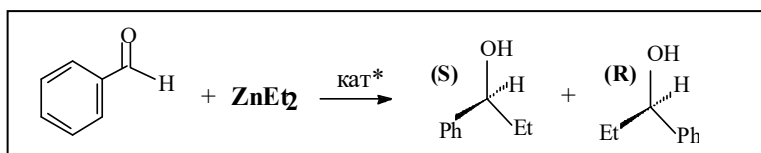
Химический факультет МГУ имени М.В.Ломоносова, кафедра органической химии

Синтез хиральных энантимерно чистых соединений (ХС) остается одной из актуальных проблем современной органической химии в связи с тем, что постоянно возрастают потребности в них, особенно теперь, когда в фармакологии четко наметился так называемый “chiral switch”, т.е. переход от использования рацемических к энантимерно чистым лекарственным препаратам.

В настоящее время на первое место в получении ХС вышел асимметрический синтез, эффективность которого определяется доступностью исходного оптически активного вещества и возможностью получения его в виде обоих энантимеров. Одним из таких соединений является 1-фенилэтанамин. Нами разработан метод функционализации его диметильного производного через стадию *орто*-литоирования с последующей конденсацией с различными электрофилами и получены *орто*-замещенные амины, среди которых наиболее полезными оказались δ -аминоспирты (**1**).



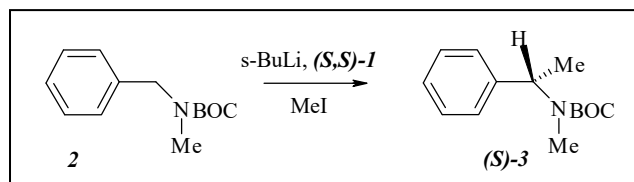
(S,S)-1 показали высокую асимметризирующую активность как лиганды в каталитическом энантиоселективном присоединении $ZnEt_2$ к бензальдегидам - был



получен нерацемический 1-фенилпропанол с *ee* до 92%.

(S,S)-1 также проявили хорошую активность в

качестве хиральных вспомогательных реагентов в асимметрическом депротонировании-алкилировании N-вос-бензиламинов. Так при метилировании **2** были получены **(S)-3** с *ee* 53-67%, сопоставимой со спартеином (*ee* 69%).



При использовании **(R,R)-1**, был получен **(R)-3**. Таким образом, аминоспирты, синтезированные из **(S)-** или **(R)-1**-фенилэтанаминов позволяют получать оба энантиомера целевого соединения.