

## СИНТЕЗ И СВОЙСТВА 4-ЗАМЕЩЕННЫХ ПИРОГЛУТАМИНОВЫХ КИСЛОТ

Вигоров А.Ю., Низова И.А., Левит Г.Л., Краснов В.П.

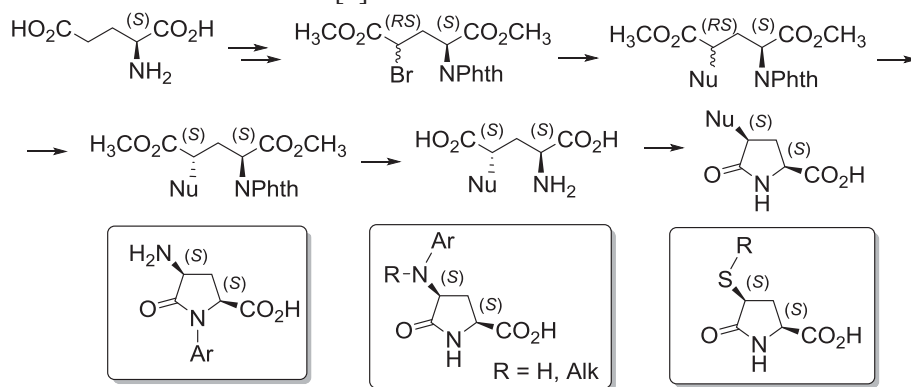
Институт органического синтеза УрО РАН  
620137, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22

C(4)-производные глутаминовой кислоты и ее лактама (пироглутаминовой кислоты) проявляют разнообразную биологическую активность и используются в органическом синтезе в качестве хиральных строительных блоков. Поскольку биологическая активность соединений существенным образом зависит от их стереоконфигурации, получение индивидуальных стереоизомеров хиральных соединений имеет большое значение.

Для синтеза стереоизомеров C(4)-производных пироглутаминовой кислоты применяют: алкилирование лактам-енолятов, получаемых под действием сильных оснований из защищенных пироглутаминовых кислот, замещение гидроксигруппы в 4-гидроксипролине с последующим введением оксогруппы в положение 5, циклизация C(4)-производных глутаминовой кислоты.

Нашим коллективом в течение ряда лет разрабатывается подход к синтезу C(4)-производных глутаминовой и пироглутаминовой кислот, заключающийся в бромировании *N*-фталоил-(*S*)-глутаминовой кислоты с последующей этерификацией, замещении брома различными нуклеофилами, разделении диастереомеров, удалении защитных групп и замыкании лактамного цикла [1].

В докладе будут рассмотрены особенности данного метода синтеза C(4)-производных глутаминовой и пироглутаминовой кислот и приведены данные о их биологической активности [2].



Синтез 4-замещенных пироглутаминовых кислот

1. Krasnov V.P., Nizova I.A., Vigorov A.Yu., et al. // Eur. J. Org. Chem. 2008. P. 1802–1810.

2. Vigorov A.Yu., Krasnov V.P., Nizova I.A., et al. // AIP Conference Proceedings. 2022. Vol. 2390. P. 020087-1–020087-7.

Работа выполнена при поддержке РФФИ, проект № 20-43-660045.