

III-44

**ОРГАНОКАТАЛИТИЧЕСКИЕ АЛЬДОЛЬНЫЕ РЕАКЦИИ
ГАММА-ПИРОН-2-КАРБАЛЬДЕГИДОВ –
ПУТЬ К СИНТЕЗУ ХИРАЛЬНЫХ БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫХ ВЕЩЕСТВ**

М. В. Смирнов^{1,2}, А. С. Кучеренко¹, С. Г. Злотин¹

¹Институт органической химии им. Н. Д. Зелинского РАН,
119991, Россия, г. Москва, Ленинский просп., 47;

²Московский государственный университет им. М. В. Ломоносова,
119991, Россия, г. Москва, Ленинские горы, 1

E-mail: maksim.smirnov@chemistry.msu.ru

Органокаталитическая асимметрическая альдольная реакция является мощным инструментом для получения хиральных структурных фрагментов (β -гидроксикетоны, *син*- и *анти*диолы), встречающихся в биологически активных соединениях.

Нами было предложено¹ использовать γ -пирон-2-карбальдегид в качестве синтетического эквивалента карбоксильной группы (рис. 1). После проведения с ним альдольной реакции получающиеся хиральные альдоли легко превращаются в 2,4-дигидроксикарбоновые кислоты путем Ru^{III} -катализируемой реакции окислительного фрагментирования γ -пиринового цикла.

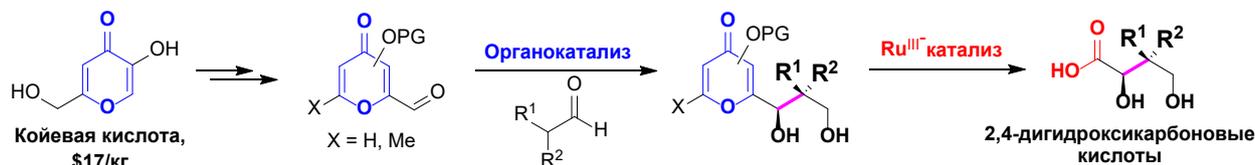


Рисунок 1. Стратегия исследования.

В оптимальных условиях была проведена альдольная реакция γ -пирон-2-карбальдегида с различными альдегидами и кетонами, в результате чего было получено более 20 новых хиральных соединений с хорошими выходами (80–90%) и превосходными значениями *dr* (*анти/син* 81/19 – 99/1) и *ee* (80–98%).

Некоторые из полученных продуктов превращены в хиральные ацилпроизводные 2,4-дигидроксикарбоновых кислот и 2-гидрокси-4-кетокислот. Они были использованы для получения ценных биологически активных веществ, например, осуществлен синтез лекарственного соединения декспантенола (рис. 2).

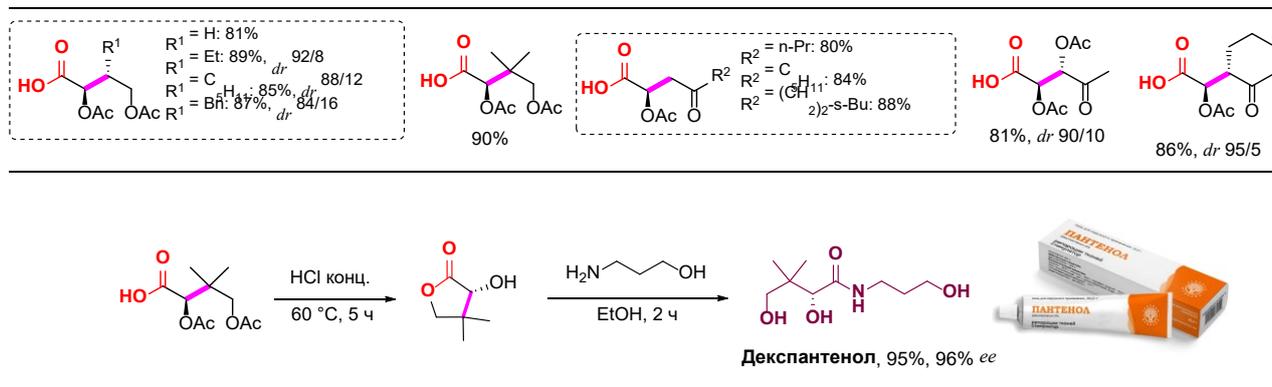


Рисунок 2. Получение 2,4-дигидроксикарбоновых кислот и их производных.

Библиографический список

1. γ -Pyronecarbaldehyde-Based Practical Asymmetric Catalytic Synthesis of Chiral 2,4-Dihydroxycarboxylic Acids and α -Hydroxy- γ -lactones / M. V. Smirnov, A. S. Kucherenko, I. D. Gridnev [et al.] // *Advanced Synthesis & Catalysis*. – 2022. – Vol. 364, Iss. 18. – P. 3245–3262.