

однореакторный метод синтеза 5-амино-1,2,4-тиадиазолов (4), исходя из *N*-замещенных амидинов (6) в среде ДМСО при комнатной температуре, обеспечивающий выходы целевых продуктов на уровне литературных данных [4], имеющих значительный потенциал применения в медицинской химии [5].

#### Список литературы

1. Bolotin D. S., Bokach N. A., Kukushkin V. Y. // *Coord. Chem. Rev.* 2016. Vol. 313. P. 62–93.
2. Crayen // *Chem. Ber.* 1891. Vol. 24. P. 385–393.
3. Ağırbaş H., Dürüst Y., Karahasanoğlu A. // *Phosphorus, Sulfur and Silicon.* 1996. Vol. 114. P. 173–178.
4. Chai L., Lai Z., Xia Q. et al. // *European Journal of Organic Chemistry.* 2018. Vol. 31. P. 4338–4344.
5. Simpson G. L., Bertrand S. M., Borthwick J. A. et al. // *Journal of Medicinal Chemistry.* 2018. Vol. 61. P. 3918–3929.

\* Исследование выполнено при финансовой поддержке РФФИ в рамках научного проекта № 19-33-600-64.

УДК 546.271:547.1-32-304.2:547.5

А. А. Телегина<sup>1,2</sup>, Д. А. Груздев<sup>1,2</sup>,  
Г. Л. Левит<sup>2</sup>, В. А. Ольшевская<sup>3</sup>,  
В. П. Краснов<sup>1,2</sup>

<sup>1</sup>Уральский федеральный университет  
им. первого Президента России Б. Н. Ельцина,  
620002, Россия, г. Екатеринбург, ул. Мира, 19,  
angelina.teleginaa@gmail.com,

<sup>2</sup>Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского УрО РАН,  
620108, Россия, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, 22,

<sup>3</sup>Институт элементоорганических соединений им. А. Н. Несмеянова РАН,  
119991, Россия, г. Москва, ул. Вавилова, 28

### СИНТЕЗ НОВОЙ ПЛАНАРНО-ХИРАЛЬНОЙ АМИНОКИСЛОТЫ НА ОСНОВЕ НИДО-КАРБОРАНА\*

**Ключевые слова:** карборан, планарная хиральность, аминокислота, деборирование.

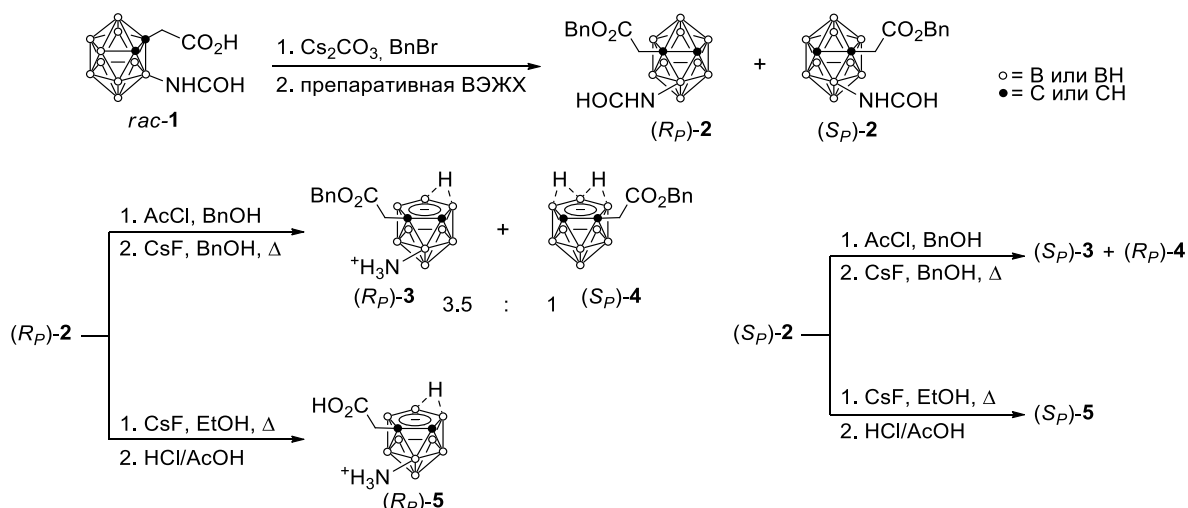
Производные полиэдрических дикарба-клозо-додекаборанов и нидо-ундекаборанов (карборанов) представляют значительный интерес для

современной медицинской химии. К ним относятся потенциальные агенты для бор-нейтронозахватной терапии рака [1–3]. Борсодержащие аналоги биомолекул, способные избирательно накапливаться в опухолевых клетках, могут быть получены на основе производных карборанов, в структуре которых присутствуют карбоксильная и аминогруппы.

(3-Формамино-1,2-дикарба-кклозо-додекаборан-1-ил)уксусная кислота (**1**) обладает свойством планарной хиральности, поскольку ее молекула содержит три различных заместителя при одной грани карборана, и существует в виде двух стереоизомеров. Ранее мы получили (*R<sub>P</sub>*)- и (*S<sub>P</sub>*)-энантиомеры бензилового эфира **2** (*ee* > 99 %), исходя из кислоты **1**, и определили их абсолютную конфигурацию [4].

Мы провели удаление формильной группы энантиомерно чистых соединений (*R<sub>P</sub>*)-**2** и (*S<sub>P</sub>*)-**2** и последующее деборирование под действием CsF в бензиловом спирте. Реакция приводила к смеси продуктов деборирования **3** и **4** в соотношении 3.5:1. Препаративный выход аминоэфиров (*R<sub>P</sub>*)-**3** и (*S<sub>P</sub>*)-**3** составил 64 и 56 % соответственно (*ee* > 98 % по данным ВЭЖХ на хиральной неподвижной фазе).

Деборирование производных (*R<sub>P</sub>*)-**2** и (*S<sub>P</sub>*)-**2**, содержащих формамино-группу при атоме В(3), протекало с высокой региоселективностью. Последовательная обработка энантиомеров **2** CsF в этаноле и смесью концентрированной соляной и уксусной кислот приводила к свободным аминокислотам (*R<sub>P</sub>*)-**5** и (*S<sub>P</sub>*)-**5** (общий выход до 85 %). Строение и чистота соединений **3–5** подтверждены набором физико-химических методов (спектроскопия ЯМР <sup>1</sup>H, <sup>11</sup>B и <sup>13</sup>C, ВЭЖХ, масс-спектрометрия высокого разрешения, элементный анализ).



Таким образом, нами впервые получены энантиомеры планарно-хиральной аминокислоты **5** на основе *нидо*-карборана, а также ее бензильного эфира **3**. Данные соединения представляют интерес в качестве строительных блоков для получения энантиочистых карборансодержащих производных биомолекул, а также хиральных лигандов.

#### Список литературы

1. Barth R. F., Mi P., Yang W. // Cancer Commun. 2018. Vol. 38, № 1. Art. 35.
2. Luderer M. J., De La Puente P., Azab A. K. // Pharm. Res. 2015. Vol. 32, № 9. P. 2824–2836.
3. Boron-Based Compounds: Potential and Emerging Applications in Medicine / eds. by Hey-Hawkins E., Viñas Teixidor C. 1-st edition. Wiley, 2018. 496 p.
4. Gruzdev D. A., Ustinova V. O., Chulakov E. N. et al. // J. Organomet. Chem. 2018. Vol. 876, № 1. P. 50–56.

\* Работа выполнена в рамках тем государственного задания АААА-А19-119012490007-8 и АААА-А19-119011790130-3 при финансовой поддержке РФФИ (проект № 18-33-00027 мол\_а).

УДК 547.749

**Ю. А. Титова, И. Г. Овчинникова,  
О. В. Федорова, Г. Л. Русинов, В. Н. Чарушин**

*Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского УрО РАН,  
620108, Россия, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, 22,  
titova@ios.uran.ru*

### **4-ГИДРОКСИПРОЛИНСОДЕРЖАЩИЙ КРАУНОФАН – НОВЫЙ ЭФФЕКТИВНЫЙ ХИРАЛЬНЫЙ ИНДУКТОР РЕАКЦИИ БИДЖИНЕЛЛИ\***

**Ключевые слова:** краунофан, поданды, гидроксипролин, асимметрический синтез, реакция Биджинелли.

Использование  $C_2$ -симметричных диолов и диаминов в качестве хиральных органокатализаторов в асимметрическом синтезе является одним из основных трендов последнего десятилетия. Наличие в таких катализаторах нескольких координационных центров, способных к обратимому образованию ковалентных и нековалентных (ионных, водородных и др.) связей с реагентами, обеспечивает оптимальное расположение последних в переходных состояниях и в конечном счете высокую энантиоселективность реакций [1].