

## Enancjoselektywna organokatalityczna addycja heteronukleofilii do $\alpha$ -trifluorometylo- $\beta$ -nitrostyrenów

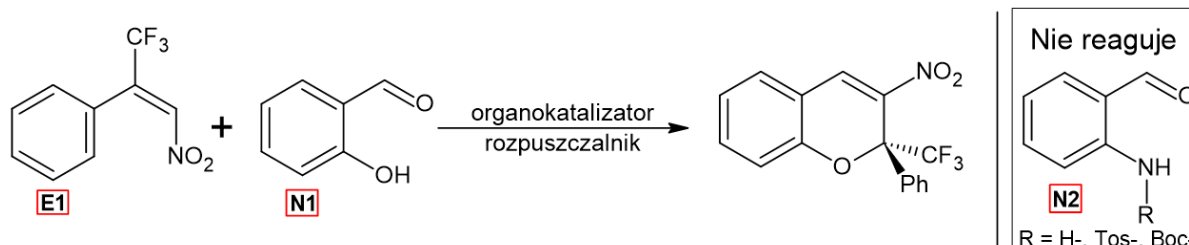
Piotr Herbetko

Kierownik: **dr hab. Piotr Kwiatkowski**

Opiekun: **mgr Paweł Gawroński**

Nitroalkeny, z uwagi na wysoką reaktywność, są użytecznymi akceptorami Michaela [1]. Na szczególną uwagę zasługują mniej reaktywne  $\beta,\beta$ -dipodstawione nitroalkeny, a zwłaszcza te z podstawnikiem  $-\text{CF}_3$ , ponieważ z nich można otrzymać produkty z czwartorzędowym centrum stereogenicznym posiadającym grupę trifluorometylową, co jest bardzo istotne przy projektowaniu nowych farmaceutyków np. chiralnych analogów GABA [2].

Głównym zadaniem było poszukiwanie jak najbardziej efektywnego organokatalizatora reakcji  $\alpha$ -trifluorometylo- $\beta$ -nitrostyrenu (**E1**) z aldehydem salicylowym (**N1**), testując przy tym również różne rozpuszczalniki i warunki. W wyniku tej reakcji powstaje pochodna 3-nitro-2H-chromenu, ponieważ addukt Michaela następnie cyklizuje. Produkty tego typu są istotne, ponieważ mogą zostać dalej wykorzystane w syntezie cząsteczek bioaktywnych [3]. Dotychczas nie udało się przekroczyć nadmiaru enancjomerycznego powyżej 70%. Jednocześnie zbadano, czy możliwa jest analogiczna reakcja z *o*-aminobenzaldehydem i jego zabezpieczonymi pochodnymi ( $-\text{Tos}$ ,  $-\text{Boc}$ , **N2**). Otrzymano te wspomniane aldehydy **N2** i okazało się, że ich reakcja z **E1** nie przebiega, nawet w warunkach podwyższonego ciśnienia.



Niepowodzenia w reakcji z **N2** skłoniły do sprawdzenia innych *N*-donorów Michaela. Przebadano kilka *N*-nukleofilii np.  $\text{PhNH}_2$ ,  $\text{BnNH}_2$ ,  $\text{PhC(=NH)CF}_3$ , benzhydryd, pirazol i okazało się, że monitorując przebieg tych reakcji na TLC we wszystkich przypadkach zaobserwowano zanik **E1**. Do sprawdzenia reakcji w wariacie enancjoselektywnym wybrano benzhydryd i niestety wstępne próby wykazały, że nadmiar enancjomeryczny tej reakcji jest bardzo niski. Kontynuowane są badania odnośnie tej reakcji, jak i próby enancjoselektywne z innymi nukleofilami.

Literatura:

[1] Chiliveru P., Raju A., Nagender P., Eur. J. Org. Chem. 2025, 28, e202401168.

[2] Sushovan P. i in., Adv. Synth. Catal. 2023, 365, 2789.

[3] Barkov A. Yu. i in., Chem. Heterocycl. Compd. 2016, 52, 814.