

Abstrakt diplomové práce na téma:

Pikolinamidové deriváty *N*-methyl valinu jako možné katalyzátory v chirální redukci aromatických ketiminů trichlorsilanem.

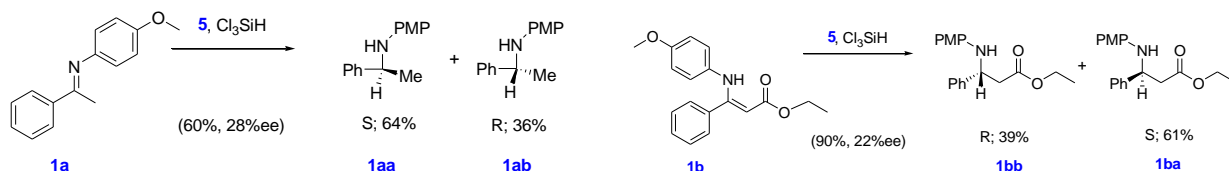
Petr Bešťák, 5. ročník

školitel: Prof. RNDr. Milan Pour, Ph.D.

Katedra anorganické a organické chemie, Farmaceutická fakulta UK v Hradci Králové

Používání opticky aktivních látek je ve farmaceutickém průmyslu čím dál víc rozšířenou praxí, ve smyslu použití účinnějších a/nebo bezpečnějších enantiomerů namísto racemátů. Asymetrická organokatalýza je perspektivou v syntéze chirálních substancí, použitelných například jako léčivé látky nebo meziprodukty v jejich výrobě, kdy je bezesporu efektivnější než následné dělení racemických směsí. Tato konkrétní metoda byla vyvinuta jako atraktivní alternativa postupů, využívajících tranzitní kovy (Pd, Ir, Ti), přičemž zcela eliminuje jejich toxicitu, limitované použití i vysokou finanční nákladnost.

Chirální redukce *N*-aryl ketiminů, např. **1a** nebo **1b**, trichlorsilanem může být katalyzována jak deriváty *N*-methyl valinu **A** (10 mol% ($\leq 92\%$ ee)), tak *N*-pikolinovými deriváty modifikovaného prolinu **B** (10 mol% (80% ee)), v prostředí toluenu za laboratorní teploty s vysokou enantioselektivitou.



Struktura nově připravených látek **5**, **5a**, kombinující strukturu katalyzátorů **A** a **B**, umožňuje srovnání selektivity a efektivity reakcí dříve katalyzovaných jak **A**, tak **B**, za použití katalyzátoru **5**, **5a**. Látky **5**, **5a** se však zdají být méně katalyticky aktivní a enantioselektivní než jednotlivě použité **A** a **B** jak pro chirální redukce aromatických ketiminů **1a**, **1b**, tak aromatických ketonů **2a** trichlorsilanem a allylace aromatických aldehydů **3a** allyltrichlorsilanem.

