**Синтез** ***гем*-дифторированных *N*-Boc аминов из *N*-Boc иминов через дифторированные фосфониевые соли**

***Ложкин Г.А.1,2, Трифонов А.Л. 2* *и Дильман А.Д.2***

*Студент, 4 курс специалитета*

*1Московский государственный университет имени М.В. Ломоносова,
химический факультет, Москва, Россия*

*2Институт органической химии имени Н.Д. Зелинского Российской Академии Наук, лаборатория №8, Москва, Россия*

*E-mail:* *lozhkin.grisha@mail.ru*

α-Дифторалкилированные амины и амиды являются ценными соединениями в области медицинской химии: препараты на их основе уже применяются для лечения некоторых заболеваний (рис. 1). Разработка новых синтетических подходов к получению данных соединений является актуальной задачей ввиду ограниченности существующих методов.



Рис.1 Примеры препаратов на основе α-дифторалкилированных аминов и амидов

В данной работе нами был предложен подход к получению *гем*-дифторированных *N*-Boc аминов **1** путём трёхкомпонентной сборки, используя двухстадийный однореакторный процесс, не требующий соединений металлов (схема 1). [1] На первой стадии метода были получены фосфониевые соли **2** через присоединение фторированного илида **3** к *N*-Boc альдиминам **4**. На второй стадии фторированные радикалы **5**, полученные путём восстановления промежуточных фосфониевых солей **2** в фотокатализируемом цикле, присоединяются к алкенам **6** с последующим переносом атома водорода.

В оптимальных условиях были получены 18 примеров с выходами от 40 до 80% с варьированием *N*-Boc иминов и алкенов, несущих электроноакцепторный заместитель. Так, были получены производные метилакрилата, акрилонитрила, винилфенилсульфона и акриламидов. Этот метод был применен для модификации антигистаминного препарата дезлоратадина с образованием продукта **7** с выходом 71%.

Также нами была показана возможность удаления защитной *трет*-бутоксикарбонильной группы, с получением соответствующих аммониевых солей.



Схема 1. Синтез *гем*-дифторированных *N*-Boc аминов

*Работа выполнена при поддержке гранта РНФ, проект №23-43-00026.*

**Литература**

1. Lozhkin G.A., Trifonov A.L. and Dilman A.D. Synthesis of gem-Difluorinated *N*-Boc Amines from *N*-Boc Imines via Difluorinated Phosphonium Salts // Submitted.