

ХРОНИКА



МЕЖДУНАРОДНАЯ КОНФЕРЕНЦИЯ  
ПО ОРГАНИЧЕСКОМУ СИНТЕЗУ  
BALTICUM ORGANICUM SYNTHETICUM (BOS 2000)

Конференция состоялась 26–29 июня 2000 г. на базе Вильнюсского университета при поддержке химических обществ Литвы, Латвии и Эстонии. В ее работе приняли участие представители 19 стран. Наиболее активное участие в работе конференции приняли ученые Литвы (27 участников) и Латвии (24 участника). По материалам конференции издан сборник тезисов докладов, а пленарные лекции в виде обзоров будут опубликованы в журнале *Synlett*. Этой конференции было посвящено два номера журнала "Химия гетероциклических соединений", в которых опубликованы работы ученых стран Балтийского моря.

Синтез гетероциклических соединений так или иначе был отражен в некоторых пленарных (заслушано 15) и в большинстве стендовых (представлено 57) докладов. Большую часть работы по организации конференции за границей проводил профессор **В. Снечук** (V. Snieckus, Queen's University) из Канады. Он был душой конференции и приветствовал ее участников на английском, литовском и эстонском языках. Его помощниками были химики из фирмы DuPont доктора **Й. Дунчия** (J. V. Duncia) и **Я. Пести** (J. Pesti). Трудно переоценить организационную работу "всей литовской команды" во главе с проф. **Э. Буткусом**.

Трехдневную сессию пленарных докладов начал проф. **А. Эшенмозер** (A. Eschenmoser, The Scripps Research Institute, La Jolla; Eidgenössische Technische Hochschule, Zürich), который в своем выступлении Chemical Etiology of Nucleic Acid Structure попытался дать ответ на вопрос, почему природа избрала рибофуранозильный тип нуклеиновых кислот. Автор представил данные о синтезе разных систем гексопиранозил-, пентапиранозил- и тетрафуранозилолиго- нуклеотидов и изучении их способности спаривания по модели Уатсона–Крика. Оказывается, что избранная природой РНК слабее связывается и вместе с тем легче гидролизуется, чем соответствующие пиранозные олигонуклеотиды. Возможно, это один из ответов на поставленный выше вопрос.

Проф. **В. Снечкус** образно подчеркнул роль Р. Нойори в органической химии, сравнивая химические названия (BINAP – синоним NOYORI) и активность катализаторов Нойори ( $k_{\text{Нойори}} > k_{\text{энзимы}}$ ). Сам проф. **Р. Нойори** (R. Noyori, Nagoya University) в докладе Lessons from the Oldest Organometallic Compounds представил новые данные по изучению механизма катализируемой 3-экзо(диметил-амино)изоборнеолом [(2*S*)-DAIB] высокостереоселективной реакции этилирования различных ароматических, ненасыщенных и некоторых насыщенных альдегидов диэтилцинком с образованием (*S*)-спиртов.

В двух докладах по стереоселективному синтезу были использованы альтернативные подходы: химический и микробиологический. Результаты исследований по созданию более энантиоселективных гидролаз с использованием мутагенеза липазы из *Bacillus thermocatenulanatus* были представлены в докладе Discovering Stereoselective Hydrolases for Organic Synthesis проф. **Р. Казлаускасом** (R. J. Kazlauskas, McGill University, Montreal). Доклад проф. **Э. Ведыса** (E. Vedejs, University Michigan, Ann Arbor) Enantioselective Acyl Transfer Using Chiral Phosphine Catalysts был посвящен созданию катализаторов, способных решить проблему взаимодействия липаз со стерически затрудненными субстратами. В качестве эффективных катализаторов получены фосфины ряда *P*-арил-фосфабицикло[3.3.0]октана. Авторы доказали целесообразность комбинирования фосфинов с липазами в реакциях энантиоселективного ацилирования мезо-1,2-диолов по методу параллельного кинетического расщепления. Основная часть синтетической работы проведена двумя молодыми латвийскими химиками О. Даугулисом и Э. Рознером.

Вопросы химии переходных металлов были рассмотрены в докладе New Results in Pd- and Ni-Catalyzed Reactions of Carbon–Carbon and Carbon–Heteroatom Bond Formation проф. **И. Белецкой** (МГУ, Москва), представившей новые данные по катализируемым палладием и никелем реакциям образования связей углерод–углерод, углерод–фосфор, углерод–селен, углерод–азот и углерод–переходный металл. Лекция по химии гидридов иридия A Journey in Organometallic Synthesis была представлена проф. **Л. Васка** (L. Vaska, Clarkson University, New York). Проф. **М. Беллер** (M. Beller, Rostock University) живо и attraktivно представил лекцию Advances and adventures in oxidation reactions о своих работах по исследованию механизма окисления олефинов кислородом в присутствии каталитического количества  $K_2[OsO_2(OH)_4]$ .

Широкую популярность в синтезе новых гетероциклических систем получили реакции метатеза олефинов и мультикомпонентные реакции. Профессор **А. Беретт** (A. G. M. Barrett, Imperial College, London) иллюстрировал свой доклад Alkene Metathesis in the Synthesis of Small Molecules and Macromolecules яркими примерами синтеза  $\beta$ -лактамов и применения метода метатеза в комбинаторном синтезе на твердой фазе, а также использования модифицированных катализаторов Грабса на полимерных носителях. Возможности метода мультикомпонентных реакций (MCR) синтеза различных гетероциклических систем были рассмотрены проф. **И. Уги** (I. Ugi, Technical University, München) в докладе The Preparative Advantages of the MCR-Chemistry. Роли каскадных реакций, продуктами которых являются хиральные циклопропановые соединения, полученные с помощью хиральных вспомогательных групп, был посвящен доклад проф. **А. де Мейере** (A. de Meijere, Göttingen Universität).

В пленарном докладе проф. **М. Лоона** (M. Loop, Технический университет, Таллин) Tartaric Acid in the Synthesis of Enantiomeric Compounds обобщены результаты по использованию винной кислоты в синтезе оптически активных производных в ряду циклопентанов. Винная кислота в качестве хирального лиганда успешно использована (ее  $>95\%$ ) для окисления функционально замещенных циклопентанов,  $\alpha$ -окисления кетонов и  $\beta$ -оксикетонов. Доклад Three Neighbours: Carbon, Silicon, Germanium. Chemical and Biological Similarities

and Differences проф. Э. Лукевица (E. Lukevics, Латвийский институт органического синтеза) был посвящен синтезу германий- и кремнийсодержащих гетероциклических соединений и их карбоциклических аналогов, исследованию биологической активности, выявлению сходств и различий в их химическом поведении и фармакологических свойствах. Использование (+)-(1*S*,5*S*)-бицикло[3.3.1]нонан-2,6-диона в стерео- и энантиоселективном синтезе других каркасных и гетероциклических систем (оксатрициклодеканов и хиральных метаноциклоокта[*b*]индоллов) продемонстрировал доклад Sterecontrolled Synthesis and Reactions of Bicyclo[3.3.1]nonanes проф. Э. Буткуса (E. Butkus, Вильнюсский университет).

В работе конференции приняли участие представители ряда известных фармацевтических фирм, что дало возможность реализовать главную цель этого форума – создать условия для научного сотрудничества как на академическом, так и на промышленном уровнях. Так, докт. Р. Янг (R. Young, Merck Fross, Canada) представил поучительную историю создания нового противоастматического лекарства из ряда антагонистов лейкотриена D<sub>4</sub>, а докт. Г. Бек (G. Beck, Aventis Pharma, Germany) остановился на опыте его фирмы по синтезу хиральных лекарственных средств.

В рамках конференции проводилась панельная дискуссия для выявления академической и производственной точек зрения. Проф. В. Снечук (Канада) выбрал две основные темы для дискуссии: органический синтез – независимая дисциплина 21-го века и изменяющийся мир поиска лекарств. Лидерами дискуссии из академической среды выступили А. Эшенмозер (США) и Р. Нойори (Япония), со стороны производителей Г. Бек (Германия) и Р. Янг (Канада). Активно участвовали И. Белецкая (Россия), Р. Дутхалер (Швейцария), Р. Казлаускас (Канада), М. Лооп (Эстония), И. Уги (Германия), М. Беллер (Германия) и Э. Ведейс (США). Проф. А. Эшенмозер назвал следующее столетие эрой молекулярной инженерии. Касаясь материалов дискуссии, хочется привести некоторые из высказанных идей и пожеланий:

- органический синтез претерпел революцию 30 лет назад, после того, как его посчитали умершим, будущее за Балтийскими странами (Р. Янг);
- специалист будущего – химический биолог (А. Эшенмозер);
- производство начинается с катализатора в пределах 1:100 – 1:1000 (Р. Дутхалер);
- синтез – не наука, а технология (А. Эшенмозер);
- мы нуждаемся в новых технологиях и академической литературе (М. Беллер).

В работе конференции активно участвовало молодое поколение химиков Эстонии, Литвы и Латвии. Организаторами отмечено (приз – ценный трехтомник по органической химии) стендовое выступление латвийского докторанта из Стокгольмского университета В. Лиепиньша (руководитель проф. Я. Беквелл (J. Bäckwell)).

Финансовую поддержку конференции обеспечили следующие компании и организации: ACS International Activities Committee, Aventis Pharmaceuticals, Inc., Boehringer-Ingelheim Pharma, Carbogen Laboratories, DuPont Pharmaceuticals Co., Laboratories Fournier S.A., Merck Frosst Canada, Pfizer central research, Sandwich, UK, Sepracor, Canada, Sigma-Aldrich Corporation, SmithKline Beecham, SPECS & BIOSPECS BV, Springer Verlag, Strem Chemical Co., Thieme Publishing, Wyeth-Ayerst Pharmaceutical Company.

**П. Трапениерис,**

Латвийский институт органического синтеза

**С. Тумкявичюс,**

Вильнюсский университет