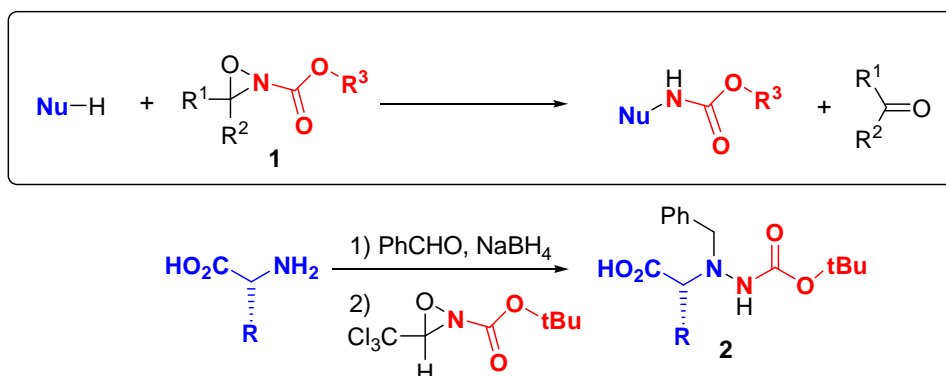


PROPOSITION DE STAGE

Amination électrophile par les oxaziridines : application à la création de liaison

C—N

L'amination électrophile est une réaction importante de la synthèse organique dans laquelle un azote électrophile (NH_2^+) est transféré à un nucléophile (Nu^-) pour former un composé azoté Nu-NH_2 , ce qui est particulièrement utile lors de la formation de liaisons C—N à partir de carbanions¹. Parmi les équivalents synthétiques de NH_2^+ développés¹, les N-alkoxy carbonyl oxaziridines **1** que nous avons conçues occupent une place de choix^{1, 2}. Elles sont capables de transférer dans des conditions très douces un azote porteur d'un excellent groupe protecteur à divers nucléophiles (azotée, carboné, sulfuré, phosphoré...)² avec une efficacité remarquable pour former, par exemple, les hydrazines énantiopures protégées **2** à partir des amines chirales correspondant.



Au cours du stage, de nouvelles oxaziridines seront préparées et leur réactivité vis-à-vis de divers nucléophiles carbonés sera étudiée afin d'accéder à des amines protégées. Des applications vers la synthèse de produits azotés bio-actifs sont envisagées.

Les techniques habituelles de chimie organique seront appliquées ainsi que la mise en œuvre systématique des méthodes spectroscopiques (RMN, spectrométrie de masse ...)

Références :

- 1) Revues récentes : Electrophilic α -amination of carbonyl compounds, E. Erdik *Tetrahedron*, **2004**, 60, 8747-8782 ; Asymmetric Electrophilic α -Amination of Carbonyl Groups, C. Greck, B. Drouillat, C. Thomassigny *Eur. J. Org. Chem.* **2004**, 1377-1385.
- 2) N-Alkyloxycarbonyl-3-Aryl-Oxaziridines: Their Preparation, Structure, and Utilization as Electrophilic Amination Reagents, J. Vidal, S. Damestoy, L. Guy, J.-C. Hannachi, A. Aubry, A. Collet *Chem. Eur. J.*, **1997**, 3, 1691-1709.
- 3) Electrophilic Amination of Amino Acids with N-Boc-Oxaziridines: Efficient Preparation of N-orthogonally diprotected Hydrazino Acids and Piperazic Acid Derivatives, J.-C. Hannachi, J. Vidal, J.-C. Mulatier, A. Collet *J. Org. Chem.*, **2004**, 69, 2367-2373.