

Magyar Kémikusok Egyesülete Csongrád Megyei
Csoportja és a Magyar Kémikusok Egyesülete
rendezvénye

XXXV. KÉMIAI ELŐADÓI NAPOK

Program és előadás-összefoglalók



Szegedi Akadémiai Bizottság Székháza
Szeged, 2012. október 29-31.

Szerkesztette:

Endrődi Balázs

SZTE TTIK Fizikai Kémiai és Anyagtudományi Tanszék

ISBN

978-963-315-099-3

FENANTRIDON ALKALOID ANALOGONOK TOTÁLSZINTÉZISÉNEK ALAPVEGYÜLETEKÉNT HASZNÁLTATOS SZUBSZTITUÁLT BENZILIDÉNACETONOK ELŐÁLLÍTÁSÁNAK MELLÉKREAKCIÓI

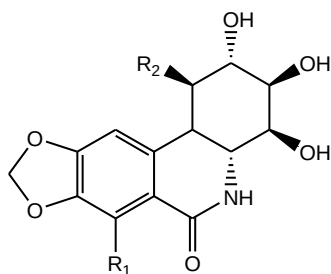
**Varró Gábor¹, Győri Erika¹, Hegedűs László²,
Simon András³ Kádas István¹**

¹ BME, Szerves Kémia és Technológia Tanszék, 1111 Bp. Budafoki út 8.

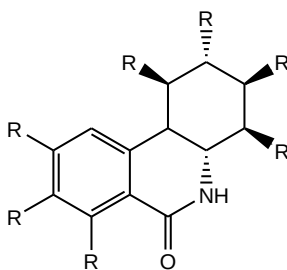
² MTA Szerves Kémiai Technológia Tanszéki Kutatócsoport, 1111 Bp. Budafoki út 8.

³ BME, Szervetlen és Analitikai Kémia Tanszék, 1111 Bp. Szt. Gellért tér 4.

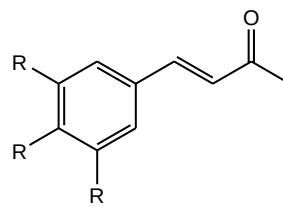
A kiemelkedő rákellenes hatással rendelkező fenantridon alkaloidok (1-4) és várhatóan hatásos analogonjaik (5) totálszintézisének számos előnnyel rendelkező alapvegyületei a jól hozzáférhető aromás aldehidekből régóta ismert úton kapható, a fenil gyűrűn megfelelően szubsztituált benzilidénacetonek (6). Eddigi szintetikus munkánk során mi is ezt az alapvegyületet használtuk ^[1-4]. Ez teszi számunkra is aktuálissá a következőkben ismertetett vizsgálatokat.



1 R₁, R₂ = OH : Pankratistatin
2 R₁ = H, R₂ = OH : 7-dezoxi-pankratistatin
3 R₁, R₂ = H : 7-dezoxi-transz-dihidro-narciklazin
4 R₁ = OH, R₂ = H : transz-dihidro-narciklazin



5 R = H, OH, OCH₃, OAc

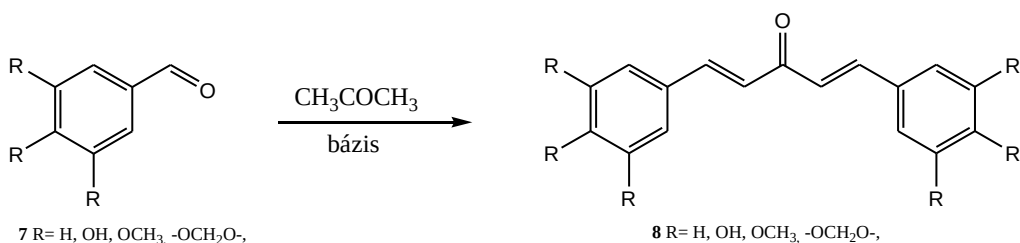


6 R = H, OH, OCH₃, -OCH₂O-,

6 benzaldehidekből kiinduló, egyszerűnek látszó előállítás, amely lényegét tekintve aldol kondenzáció, különösen a benzol gyűrűn többszörösen szubsztituált származékok esetében számos nem várt nehézséggel jár, amelyek az említett, többszörösen szubsztituált esetekben előtérbe lépő, nehezen visszaszorítható melléreakciókkal függenek össze.

Előadásunkban ismertetjük az említett melléreakciókat, e reakciók előtérbe kerülésének valószínűsíthető okait. Ezt követően e melléreakciók felléptének irodalomban megtalálható előzményeit illetve visszaszorításukra tett korábbi próbálkozásokat, és e reakciók elméleti hátterét elemezzük. Végül mindezek figyelembevételével felsoroljuk azokat a szintetikus, illetve preparatív megoldásokat, amelyekkel remélhetően eredményesen áthidalhatók a fellépett nehézségek.

A legfontosabb mellékreakció az aldol kondenzáció során fellépő, a következő ábrán látható dimerszerű melléktermékhez vezető kétszeres kondenzáció:



E zavaró mellékreakció visszaszorítására a szubsztituensektől függően különböző megoldásokat vizsgáltunk. Az előzőekben említett irodalmi, és elméleti háttérlemzés után saját, eddigi preparatív vizsgálatainkról is beszámolunk.

- [1] Szántó,G.,Bombicz,P., Grün,A., Kádas,I. *Chirality* **2008**,20,1120.
- [2] Szántó,G.,Hegedűs,L.,Mattyasovszky,L.,Simon,A.,Simon,Á.,Kádas,I. *Tetr.Lett.* **50**,2857(2009)
- [3] Szántó,G.,Hegedűs,L.,Mattyasovszky,L.,Simon,A.,Simon,Á.,Bitter,I.,Tóth.G.,Tőke,L., Kádas,I. *Tetrahedron* **65**,8412(2009)
- [4] Szántó,G.,Kádas,I.,Kárpáti,T.,Hegedűs,L. *React.Kinet.Mech. Catal.* **99**,85 (2010)