

Szelektivitási lehetőségek 4-amino-piránuronsav származékok szintézise során

Györke Gábor, kémia BSc, IV. évf.

ELTE TTK Kémiai Intézet, Szerves Kémiai Tanszék

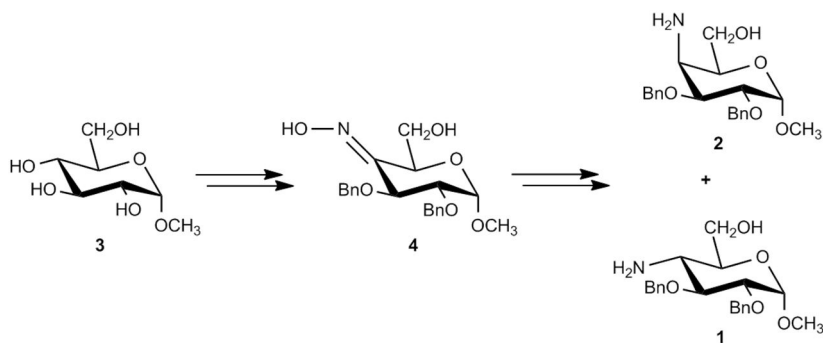
Témavezetők: **Dr. Perczel András** egyetemi tanár
ELTE TTK Kémiai Intézet
Goldschmidtné Gőz Viktória PhD hallgató
ELTE TTK Kémiai Intézet

Gyógyszerkutatásban egyre elterjedtebb módszerek közé tartozik a szervezetben is megtalálható fehérjék részének vagy egészének foldamerekkel való helyettesítése. A foldamereket alkotó monomerek lehetnek például β -aminosavak [1], vagy cukoraminosavak [2] is.

Munkám fő célja a metil-4-amino-4-dezoxi-2,3-di-*O*-benzil- α -D-glükopiranozid (1) és metil-4-amino-4-dezoxi-2,3-di-*O*-benzil- α -D-galaktopiranozid (2) szintézise volt, melyek intermedierei különböző cukoraminosavaknak.

A kiindulási metil- α -D-glükopiranozid (3) 2-es és 3-as helyzetű hidroxilcsoportjainak szelektív védelméhez ortogonális védőcsoport stratégiát alkalmaztam. Ennek első lépéseként a 4,6-*O*-*p*-metoxi-benzilidén védett származékot állítottam elő, majd benzil védőcsoportot vittem be ennek 2,3-as pozíciójába. A *p*-metoxi-benzilidén védelmet kálium-hidrogén-szulfátos savas hidrolízissel eltávolítottam, így a kívánt védett származékhoz jutottam.

Amin prekuzorként az oximot választottuk, amit két lépésben állítottam elő. Az oxim származékból (4) kiindulva csak a lítium-alumínium-hidrides redukció vezetett közvetlenül eredményre a glüko származékot (1) adva közepes, 60%-os termeléssel. A módszer előnye, hogy sztereoszelektív, mely ugyanakkor hátrány is, mert így csak az egyik származékhoz juthatunk.



1. ábra: Az alkalmazott új szintézisút

A megoldást egy új, hidroxilamin származékokon keresztül folytatott kétlépéses szintézis jelentette. A módszer előnye, hogy mindkét kívánt amino származékot a két lépés során kiváló, 89%-os össztermeléssel tudtam előállítani. Ezzel a módszer alkalmas arra, hogy a két kívánt intermedierhez azonos útvonalon jussunk.

[1] S. H. Gellman; *Acc. Chem. Res.*; (1998), 31 (4), 173-180

[2] M. D. P. Risseuw, M. Overhand, G. W. J. Fleet, M. I. Simone; *Tetrahedron: Asymmetry*; (2007), 18, 2001-2010