

Nuove Metodologie d'Accesso alla Diversita' Molecolare: Sintesi di Biomolecole e Loro Insieme per un Utilizzo in Agricoltura e Terapia

Luciana Auzzas[§], Luigi Pinna[#] and Gloria Rassus[§]

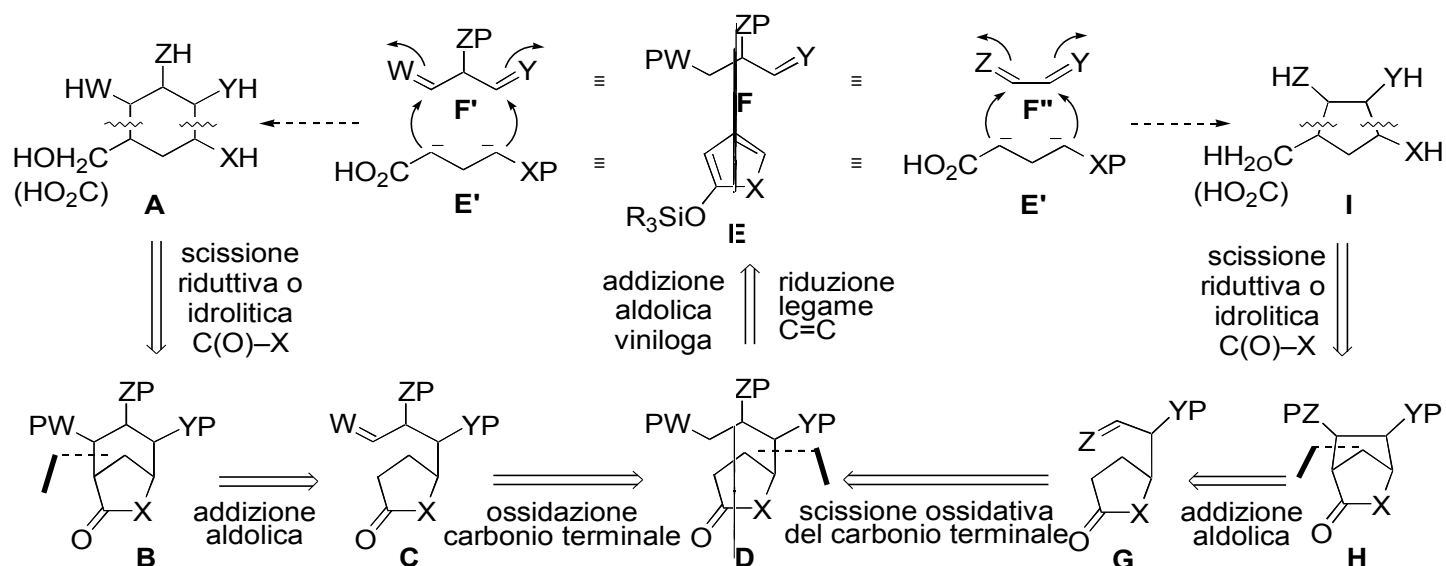
§Istituto CNR per l'Applicazione delle Tecniche Avanzate ai Problemi Agrobiologici, Via Vienna, 2

I-07100 Sassari, Italy; #Dipartimento di Chimica, Università degli Studi di Sassari, Via Vienna, 2

I-07100 Sassari, Italy

La nostra metodologia totalmente sintetica ed altamente flessibile indirizzata alla costruzione di piccole molecole organiche chirali, sia individuali, sia in miscela fra loro, prevede l'utilizzo di una triade omogenea di reagenti nucleofili eterociclici contenenti, rispettivamente, ossigeno, azoto e zolfo: il 2-(*ter*-butildimetilsililossi)furano (TBSOF), l'*N*-(*ter*-butilossicarbonil)-2-(*ter*-butildimetilsililossi)pirrolo (TBSOP) e il 2-(*ter*-butildimetilsililossi)tiofene (TBSOT) (Schema 1).

Schema 1



X = O, N, S; Y, Z, W = O, N

Questi reagenti sililossidienici, se posti a reagire con opportuni precursori elettrofilici (aldeidi ed immine) in presenza di appropriati promotori acidi di Lewis, forniscono regioselettivamente, secondo una reazione di addizione aldolica di tipo Mukaiyama viniloga, addotti γ -omologati, la cui componente eterociclica si presta bene per successive manipolazioni sui vari centri reattivi.¹

Recentemente l'applicazione della nostra metodologia sintetica ha permesso l'accesso ad un insieme di carba-zuccheri chirali non racemi e loro varianti strutturali.

I carba-zuccheri, chiamati anche pseudozuccheri, fanno parte della famiglia dei mimetici di carboidrati, molecole queste che hanno attirato un notevole interesse da parte dei chimici organici e dei chimici farmaceutici. A causa della stretta parentela con i carboidrati, queste piccole molecole, posseggono e mostrano elevatissima attività come inibitori delle glicosidasi.

Il punto centrale della sintesi totale di questa classe di composti è stato lo sfruttamento del duplice carattere nucleofilo dei sintoni della triade siliossilidienica. Il piano sintetico ha previsto una specie di percorso cicloadditivo realizzato in modo sequenziale con una reazione aldolica viniloga incrociata seguita da una reazione aldolica intramolecolare (Schema 2)².

Schema 2

Riferimenti Bibliografici

1. G. Rassu, F. Zanardi, L. Battistini, G. Casiraghi. *Chem. Soc. Rev.*, **2000**, 29, 109-118
2. G. Rassu, L. Auzzas, L. Pinna, F. Zanardi, L. Battistini, and G. Casiraghi. *Org. Lett.*, **1999**, 1, 1213-1215.