

# GYTK-ÚNKP

## ÚJ NEMZETI KIVÁLÓSÁGI PROGRAM

Az SZTE Gyógyszerésztudományi Kar  
2022. évi ÚNKP díjazottjainak tudományos előadóülése

SZTE Gyógyszerésztudományi Kar, Szeged

2023. június 30.

Dr. Vasas Andrea (szerkesztő)

<https://doi.org/10.14232/gytk.unkp.2023.af>

Szegedi Tudományegyetem, Gyógyszerésztudományi Kar

Szeged

2023

<https://doi.org/10.14232/gytk.unkp.2023.5>

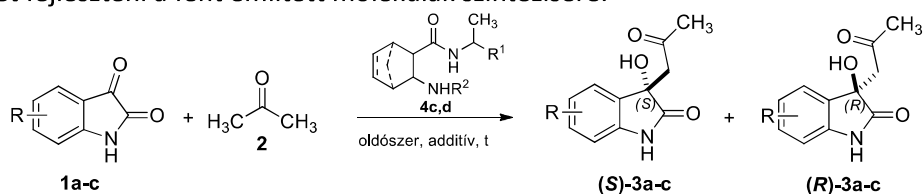
## A5

### Faragó Tünde

SZTE Gyógyszerésztudományi Kar, Gyógyszerkémiai Intézet

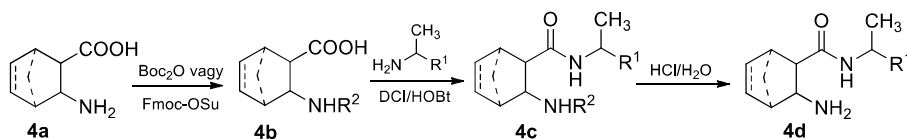
#### Változatosan szubsztituált enantiomertiszta aliciklusos $\beta$ -aminosav származékok szintézise és organokatalitikus alkalmazhatóságának vizsgálata izatin aszimmetrikus aldol reakciójával

A természetes királis vegyületek szintézise régóta nagy kihívást jelent szintetikus szerves kémikusok számára, olyan terület, amely folyamatos fejlesztést igényel. Az indolvázis gyógyszerekre nagy igény mutatkozik, széleskörű alkalmazhatóságuk miatt [1]. A 'zöld' kémia egyre inkább központi szerepet kap a vegyiparban és a gyógyszeriparban egyaránt [2,3]. Az úgynevezett organokatalizátorok alkalmazása több szempontból is jó megoldásnak bizonyulhat, mivel egyszerűbb a használatuk, kevésbé toxikusak, hatékonyabbak, mint a fém és enzim katalizátorok [4,5]. Kutatómunkánkkal az antivirális és tumorellenes hatású oxindol tartalmú vegyületek, gyógyszermolekulák előállítását szeretnénk előremozdítani, miközben a fenntartható jövő képét szem előtt tartva próbáltunk zöldebb módszereket fejleszteni a fent említett molekulák szintézisére.



organokatalizátorok **4c,d**: R<sup>1</sup> = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>, 1-naftil, 2-naftil  
R<sup>2</sup> = H, Boc, Fmoc

a: R = H, b: R = 5-I, c: R = 7-Cl, d: R = 5-F, e: R = 5-NO<sub>2</sub>, f: R = 5-Me, g: R = 4,7-diklór, h: R = 5-Br



Az elmúlt évtizedben az indolvázis gyógyszermolekulák előállítását segítő organokatalizátorok fejlesztése és tesztelése kiemelt figyelemre tett szert, viszont ez idáig kevesen foglalkoztak az aliciklusos  $\beta$ -aminosav származékok ilyen jellegű felhasználásával és vizsgálatával. Jelen munka során a **4b** aliciklusos  $\beta$ -aminosav származékokból kiindulva állítottunk elő **4c,d** új, különbözőképpen szubsztituált organokatalizátorokat. Annak érdekében, hogy tanulmányozhassuk és tovább növelhessük a fent említett vegyületek által kifejtett katalitikus hatást, az izatin acetonnal való aszimmetrikus aldol reakcióját választottuk modell reakcióként. Az általunk szintetizált **4c,d** katalizátorok viszonylag jó hatékonysággal (ee% ~57%) eredményezték az (S)-3-hidroxi-3-alkil-2-oxindol (**3a**) terméket, additív jelenlétében, mindössze 30 perc elteltével. Számos szubsztituált izatint tanulmányoztunk, melyek közül kiváló enantiomerfelesleggel kaptuk az (S)-**3b**, (S)-**3c**, (S)-**3f** és (S)-**3h** aldol terméket. A fenti kutatás másik részét képezi az izatin acetonnal való reakciójának golyósmalomban történő vizsgálata.

#### Irodalmak

- [1] Peddibhotla S. *Curr Bioact Compd* 2009, 5: 20–38
- [2] MacMillan DWC. *Nature* 2008, 455: 304–308.
- [3] Kinsella M, Duggan PG, Lennon CM. *Tetrahedron: Asymmetry* 2011, 22: 1423–1433
- [4] Abbasov ME, Romo D. *Nat Prod Rep* 2014, 31: 1318–1327
- [5] Gavendova M, Lennon CM, Coffey L, Manesiotis P, Kinsella M. *ChemistrySelect* 2019, 4: 8246–8254

**Témavezető:** Dr. Palkó Márta