

# Fluortartalmú biomolekulák. Fluorozott ciklusos $\beta$ -aminosavszármazékok szelektív szintézisei

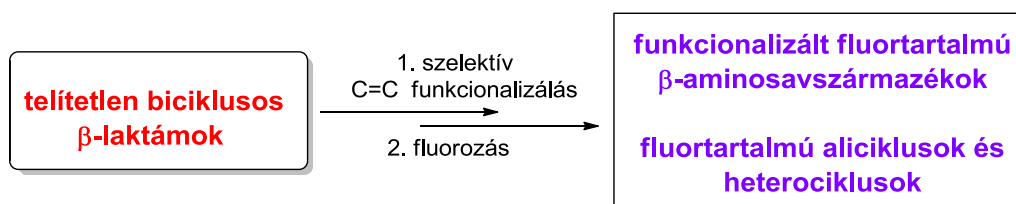


Kiss Loránd

Szegedi Tudományegyetem, Gyógyszerkémiai Intézet, Eötvös u. 6, H-6720, Szeged

A Szegedi Tudományegyetem Gyógyszerkémiai Intézetének egyik kutatási területe a  $\beta$ -aminosavak szintézisei és alkalmazásai. A  $\beta$ -aminosavak bioaktív, természetes eredetű vegyületek kulcselemei, biológiailag értékes  $\beta$ -laktámok prekursorai. Néhány, kismolekulájú ciklusos  $\beta$ -aminosav, mint a ciszpentacin, az oxetin, az orizoximicin, vagy az ikofungipen antifungális illetve baktériumellenes hatással rendelkezik. A konformációsan gátolt  $\beta$ -aminosavak különböző új típusú, biológiailag aktív peptidek építőelemeiként is szolgálnak. Számos antibakteriális, tumor- illetve vírusellenes hatású, komplexebb kémiai szerkezetű vegyület ismert, amelyek ciklusos  $\beta$ -aminosav elemet tartalmaznak. Különböző funkcionizált ciklusos aminosavszármazékok, mint például az oszeltamivir (tamiflu), a zanamivir (relenza), a laninamivir vagy a peramivir antivirális hatású szerek. Ezeknek számos módosított analógjai illetve  $\beta$ -aminosav módosított analógjai is antivirális, antifungális valamint baktériumellenes hatást mutatnak [1].

A fluoratom valamint a C–F kötés sajátos jellemzőinek és tulajdonságainak köszönhetően, ha egy szerves molekulában valamely atomot vagy atomcsoportot fluoratomra cserélünk, ennek következtében nagymértékben megváltozhatnak e molekulának a biológiai tulajdonságai. Mivel a forgalomba kerülő gyógyszer-molekulák mintegy negyede tartalmaz legalább egy fluor atomot a fluortartalmú vegyületek laboratóriumi és ipari szintéziseire egyre növekvő figyelem irányult az elmúlt két évtizedben. Ezen belül, elsősorban a különböző bioaktív és természetes vegyületek fluorozott analógjainak szintézisei nyertek jelentős szerepet [2].



A királis információkban gazdag, multifunkcionizált bioaktív fluorozott vegyületek szintéziseire egyre növekvő igény van, ezért kutatómunkánk célja szelektív illetve sztereokontrollált szintézis stratégiák és technikák felhasználásával fluortartalmú  $\beta$ -aminosavszármazékok illetve funkcionizált fluortartalmú építőelemek szintézise volt. A funkcionizálásokat a megfelelő telítetlen biciklusos  $\beta$ -laktámokból illetve  $\beta$ -aminosavakból kiindulva a gyűrű C=C kötésének szelektív és kontrollált átalakításaival végeztük el.

## Irodalom:

- [1] L. Kiss, F. Fülöp, *Chem. Rev.* **2014**, *114*, 1116.  
[2] J. Wang, M. Sánchez-Roselló, J. L. Aceña, C. del Pozo, A. E. Sorochinsky, S. Fustero, V. A. Soloshonok, H. Liu, *Chem. Rev.* **2014**, *114*, 2432.  
[3] a) M. Nonn, L. Kiss, M. Haukka, S. Fustero, F. Fülöp, *Org. Lett.* **2015**, *17*, 1074. b) L. Kiss, M. Nonn, R. Sillanpää, S. Fustero, F. Fülöp, *Beilstein J. Org. Chem.* **2013**, *9*, 1164. c) L. Kiss, E. Forró, S. Fustero, F. Fülöp, *Org. Biomol. Chem.* **2011**, *9*, 6528. d) L. Kiss, A. M. Remete, M. Nonn, S. Fustero, R. Sillanpää, F. Fülöp, *Tetrahedron* **2016**, *72*, 781. e) L. Kiss, M. Nonn, E. Forró, R. Sillanpää, S. Fustero, F. Fülöp, *Eur. J. Org. Chem.* **2014**, 4070.