

B4

doi: 10.14232/fgykf.2018.b4

A junkuenin B félszintetikus származékainak előállítása és a vegyületek antiproliferatív hatásának vizsgálata

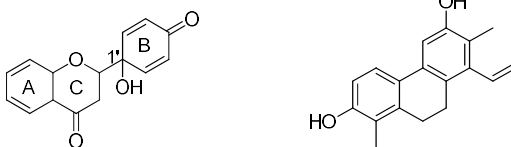
Bús Csaba,¹ Kúsz Norbert,¹ Kulmány Ágnes,² Zupkó István,² Tóth Barbara,¹
Hohmann Judit,¹ Hunyadi Attila,¹ Vasas Andrea¹

¹ Szegedi Tudományegyetem, Interdiszciplináris Kiválósági Központ, Farmakognóziai Intézet, 6720 Szeged, Eötvös u. 6.

² Szegedi Tudományegyetem, Interdiszciplináris Kiválósági Központ, Gyógyszerhatástani és Biofarmáciai Intézet, 6720 Szeged, Eötvös u. 6.

A junkuenin B a fenantrének közé tartozó, növényi eredetű, aromás metabolit. A fenantrének szerkezeti és biológiai sokszínűségüknek köszönhetően jelentős tudományos érdeklődést váltottak ki az elmúlt években. Számos kutatócsoport számolt be többek között a vegyületek *in vitro* citotoxikus, antiproliferatív, gyulladáscsökkentő és antimikrobiális hatásáról.

A protoflavonok a flavonoidok egy különleges csoportját alkotják, szerkezeti jellemzőik a nem aromás B gyűrű, és egy hirdoxilcsoport kapcsolódása a C-1' szénatomhoz (1. ábra). Számos természetes és félszintetikus vegyület vizsgálata során mértek ígéretes antiproliferatív aktivitást; farmakofórként a *para*-kinol szerkezetű B gyűrűt azonosították.



1. ábra A protoflavonok és a junkuenin B szerkezete

Nagyszámú fenantrén, köztük a junkuenin B is fenolos hidroxilcsoportokat tartalmaz, amelyek révén oxidációs reakciókban protoflavonszerű *para*-kinol gyűrűt tartalmazó vegyületek keletkezhetnek. Kísérleteink célja ilyen fenantrénszármazékok előállítása és farmakológiai vizsgálata volt.

A reakciókhoz speciális oxidálószereket [bisz-trifluoroacetoxy-jodobenzol (PIFA) és diacetoxy-jodobenzol (PIDA)] alkalmaztunk különböző reakciókörülmények között. A

reakciókeverékek tisztítását szilárd fázisú extrakcióval, közepes nyomású-, és nagyhatékonyságú folyadékkromatográfiás módszerrel (MPLC, HPLC) végeztük. A vegyületek szerkezetének meghatározása 1D és 2D NMR spektroszkópiai módszerekkel történt.

Munkánk eredményeként 11 vegyületet állítottunk elő, többségük *para*-kinol gyűrűvel rendelkezik. Számos anyag mutatott ígéretes *in vitro* antiproliferatív hatást.

Köszönetnyilvánítás: A kutatást az Emberi Erőforrások Minisztériuma UNKP-18-3 kódszámú Új Nemzeti Kiválóság Programja és a 20391-3/2018/FEKUSTRAT, valamint az NKFIH (K128963) támogatta.

Témavezető: Dr. Vasas Andrea