

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

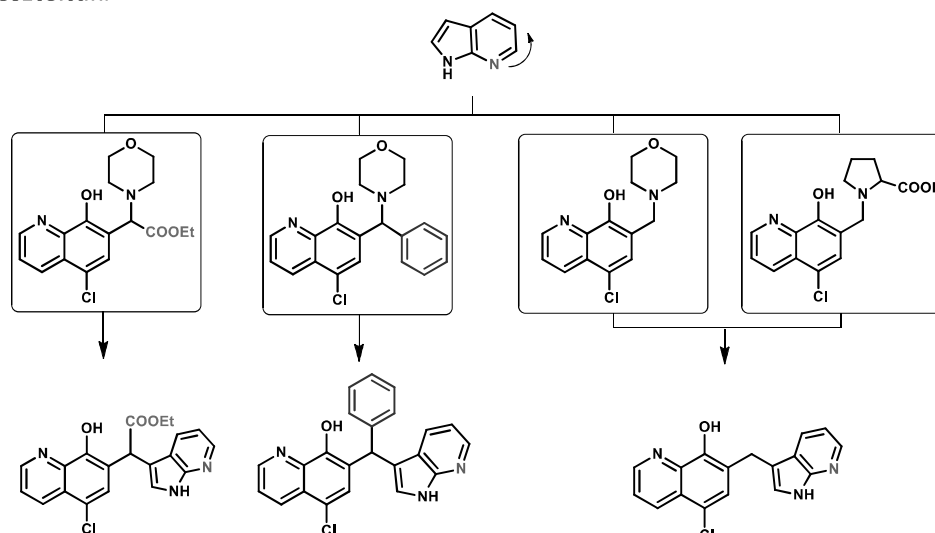
B4

Hegedűs Dóra

SZTE Gyógyszerésztudományi Kar, Gyógyszerkémiai Intézet

8-hidroxikinolin és indol vázat tartalmazó biokonjugátumok szintézise

Irodalmi feljegyzések alapján az enyhe reakciókörülmények között is új C-C kötés kialakítására alkalmas Mannich-reakció kiindulási anyagának tekinthető 8-hidroxikinolin számos biológiai szempontból releváns szerkezet építőeleme [1,2]. Az Intézetben végzett korábbi kutatómunka eredményeként 3-szubsztituált indol származékok előállítását valósították meg direkt aza-Friedel-Crafts reakció révén [3]. Elsődleges célul tűztük ki a Mannich-reakció kiterjesztéseként 5-klór-8-hidroxikinolin vázat tartalmazó prekursor előállítását, majd továbbalakíthatóságának vizsgálatát indollal, illetve 7-azaindollal. A tervezett prekursor előállítása 5-klór-8-hidroxikinolin, morfolin és etil-glioxilát reagáltatásával valósult meg, oldószerként toluolt alkalmazva, mikrohullámú körülmények között. A terméket diizopropil-éterrel való átkristályosítást követően megfelelő tisztasággal izoláltuk. A kívánt biokonjugátumok szintézise *orto*-kinon metid köztiterméken keresztül történt a prekursor vegyület és az indol, illetve 7-azaindol reakciója révén. A prekursor vegyület aldehid-, illetve amin komponensének változtatásával az átalakulásra gyakorolt hatást vizsgáltuk, ezen származékok továbbalakítását indollal, 7-azaindollal teszteltük.



Kutatómunkánk eredményeként a Mannich-reakció kiterjesztését 8-hidroxikinolin vázat tartalmazó prekursor vegyületet állítottunk elő, mely továbbalakítása révén indol vázat tartalmazó biokonjugátumok szintézisét valósítottuk meg.

Irodalom

- [1] Pagett LO, Ed. Encyclopedia of Reagents for Organic Synthesis: Wiley, UK, 19919; Vol. 4, p. 21982.
- [2] Saadeh HA, Sweidan KA, Mubarak MS. Recent advances in the synthesis and biological activity of 8-hydroxyquinolines. *Molecules* 2020; 25: 4321–4347
- [3] Szatmári I, Sas J, Fülöp F. Catalyst-free coupling of indole derivatives with 3,4-dihydroisoquinoline and related compounds. *Tetrahedron Lett.* 2013; 54: 5069–5071

Köszönetnyilvánítás

A munka a Kulturális és Innovációs Minisztérium ÚNKP-22-3 kódszámú Új Nemzeti Kiválóság Programjának a Nemzeti Kutatási, Fejlesztési és Innovációs Alapból finanszírozott szakmai támogatásával készült.

Témavezető: Prof. Dr. Szatmári István