

Egyszerű módszer propellán elektrofil aktiválására savakkal

Gergely Kristóf Tamás, 3. évf. kémia BSc

Témavezető: Dr. Tolnai Gergely László egyetemi adjunktus
ELTE Szerves Kémiai Tanszék

A biciklo[1.1.1]pentán vázrészlet a benzolgyűrű bioizosztere. Emiatt a tulajdonsága miatt gyógyszermolekulákba beépíthető, ezzel javítva annak biológiai hatását, vagy fizikokémiai tulajdonságait. [1] A biciklo[1.1.1]pentán-aminoknak, mint szintetikus építőelemeknek az ismert előállítási módszerei érélyes körülmények között, több lépésben történnek. [2]

Munkám során egy olyan előállítási utat dolgoztam ki, amivel egyszerűen állíthatók elő ezek az építőelemek, egy lépésben. Lewis-savakkal történő aktiválás során az [1.1.1]propellán reagál a kiválasztott aminnal egy lépésben. A szintetizált biciklo[1.1.1]pentán-amint kromatográfiásan tisztítjuk.

A kutatómunkám elején az [1.1.1]propellán és a morfolin reakcióját vizsgáltam. Eredetileg bór-trifluorid éterátot használtam Lewis-savként. A reakció nem-szelektív, a biciklusos gyűrű felnyílhat a reakció során 4-(3-metilenciklobutil)morfolint képezve. Ennek a mellékterméknek a visszaszorítása érdekében trimetilszilil-triflátot, majd 2,4,6-kollidínium-triflátot alkalmaztam, mint Lewis-sav. A morfolin után nyíltláncú, heterociklusos és aromás gyűrűt tartalmazó aminokkal és anilinszármazékokkal végeztem reakciókat. A munkám során előállítottam 5 db biciklo[1.1.1]pentán-amint és 5 db (3-metilenciklobután)-amint, amelyek közül több eddig nem szerepel az irodalomban.

[1] Meanwell, N. A., *Journal of Agricultural and Food Chemistry*, 71 (47), 18087-18122 (2023)

[2] Ma, X., Nhat Pham, L., *Asian Journal of Organic Chemistry*, 9 (1), 8-22 (2020)