

A gyűrűben egy kettős kötést tartalmazó aliciklusos β -aminosavak régió- és sztereoszelektív funkcionálizálásával mono- és dihidroxiszubsztituált aminosavakat állítottunk elő. A dihidroxivegyületek oxidatív gyűrűnyitását követő redukív aminálással regioizomer azepingyűrűs β -aminosavakat nyertünk.

Ciklopentánvázis β - és γ -laktámok régió- és sztereoszelektív funkcionálizálásai során epoxidok nátriumazidos felnyitását követően karbonukleozid prekursorokat nyertünk. Az azidok triazolá történő átalakítása során több esetben jelentős különbségeket tapasztaltunk. Pinán alapú kémiával számos adenin, citozin és uracilvázis karbociklusos nukleozid szintézisét is megoldottuk. A szintéziseket valamennyi esetben enantiomer vegyületekkel is végrehajtottuk.

Izoxazolingyűrűvel kondenzált 2-aminociklopentánkarbonsav származékokat állítottunk elő, racém és enantiomertiszta formában, nitril oxidok régió- és sztereospecifikus cikloaddíciójával. Többszörösen funkcionizált 1,2,3-triazol-szubsztituált 2-aminociklopentánkarbonsav származékokat nyertünk a megfelelő laktámok, vagy aminosav származékok szelektív funkcionálizálásával. Régió- és diasztereoszelektív módszereket dolgoztunk ki fluorozott 2-aminociklohexánkarbonsav származékok előállítására. Valamennyi funkcionizálás alapja a gyűrűs aminosav kettős kötésének átalakítása.

Karén alapú aminodiolszármazékaink jó katalizátornak bizonyultak az aldehid dietilcink addíciós reakcióban.

A cikloalkénvázis béta aminosavszármazékok szelektív cikloaddíciós reakciójával nagyszámú sztereoizomer izoxazolin származékot szintetizáltunk. Az izoxazolinok nikkal katalizált redukív gyűrűfelnyitása multiszubsztituált, öt asszimetriacentrumot tartalmazó béta aminosavakhoz vezetett. Ciklohexénvázis béta aminosavak sztereoszelektív epoxidálásával, majd ezt követő régioszelektív azid nyitással tetraszubsztituált béta aminosav izomereket nyertünk, melyek további funkcionizálásra adnak lehetőséget.

Áramlásos reaktorban fejlesztettünk ki egy új katalitikus eljárást: A szilárd hordozós peptidszintézis során a gyantára kötött peptid optimalizálás után kiválóan alkalmas asszimetrikus aldol reakció és aldehidek nitroolefinekre történő enantioszelektív addíciójára. A gyanta újrafelhasználható, a reakció méretnövelhető és környezetkímélő eljárásnak bizonyult.

A modern foldamer kutatások legújabb eredményeit összefoglaló kritikai közleményben ismertettük.

A szubsztituált ciszpentacinszármazékok új szintézisét dolgoztuk ki norbornénvázis béta-aminosavak és béta-laktámok dihidroxilálásán, majd oxidatív gyűrűnyitásán keresztül. A képződő dialdehyd könnyen Wittig reakcióba vihető. A diendo, vagy

diexo konfiguráció a szubsztituensek térbeliségét kontrollálja. A 3-aminociklopentán-1,2,3-trikarbonsav öt diasztereomerének szintézisét oldottuk meg a diendo és diexoszubsztituált norbornénvázaz aminosavak erélyes oxidációjával majd az azt követő izomerizációs reakciókkal. Új retro-Diels-Alder stratégiát dolgoztunk ki néhány heterociklus enantiomerjeinek előállítására. Az eljárás az enantiomerek dominó típusú gyűrűzárásán, majd az azt kivető mikrohullámmal segített RDA reakción alapul.

Áramlásos reakciókban az azid-alkin cikloaddíció új megvalósítását valósítottuk meg rézpor jelenlétében, kiváló hozamokkal, méretnövelhető módon.

Az eredményekből összesen 54 közlemény, három összefoglaló közlemény, két szabadalmi bejelentés született.

Több esetben közleményeink folyóiratok címlapjára is kerültek. Összefoglaló cikkeinkből a *Chem. Soc. Rev.*, **2012**, *41*, 687-702 és *Chem. Rev.* **2014**, *114*, 1116-1169 közleményünk emelhető ki. Az alkalmazott peptidszintetikus eljárás-technikánkat valamint deuterált morfinszármazék szintéziseinket szabadalmi bejelentésben is védtük.

Kiemelkedően fontos eredménynek tartom, hogy a munka során a következő PhD hallgatók szerezték meg a PhD fokozatot: Tasnádi Gábor (2011), Nonn Melinda, Ötvös Sándor, Sípos László (2013), Maria Cherepanova, Csillag Kinga Karola, Schönstein László (2014). Abszolutóriumot szerzett hallgatók: Magyar Tímea és Sas Judit. PhD hallgatók, akik még jelenleg is folytatják munkájukat: Fekete Beáta, Kardos Márton, Megyesi Rita, Szloszár Alíz.



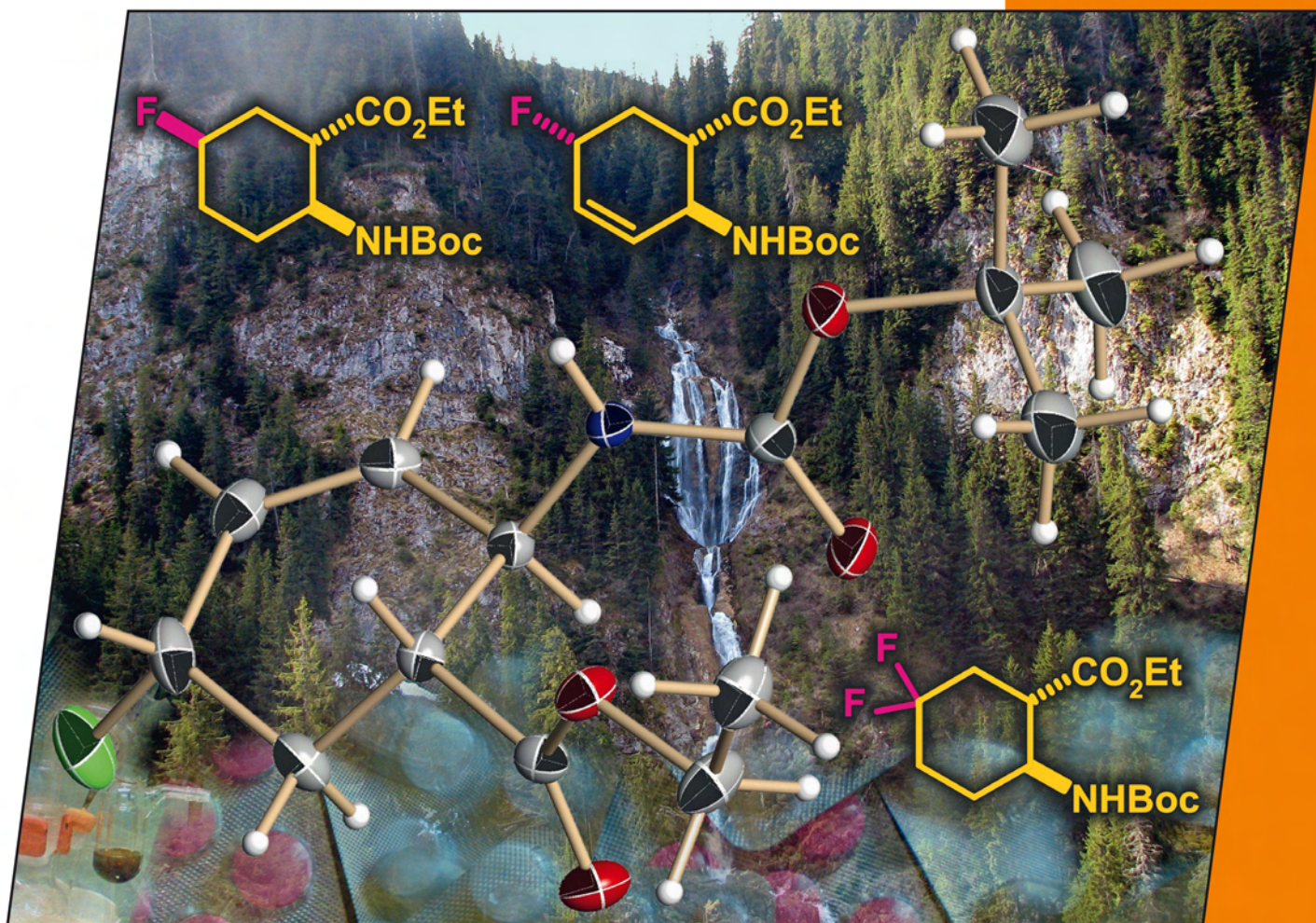
EurJOC

European Journal of
Organic Chemistry

26/2011
2nd September Issue



IYC 2011
International Year of
CHEMISTRY



Cover Picture

Ferenc Fülöp et al.

Selective Synthesis of Fluorinated Alicyclic β -Amino Ester Stereoisomers

Microreview

Marcel Mayor et al.

Phenyl–Acetylene Bond Assembly

 WILEY-VCH

www.eurjoc.org

A Journal of

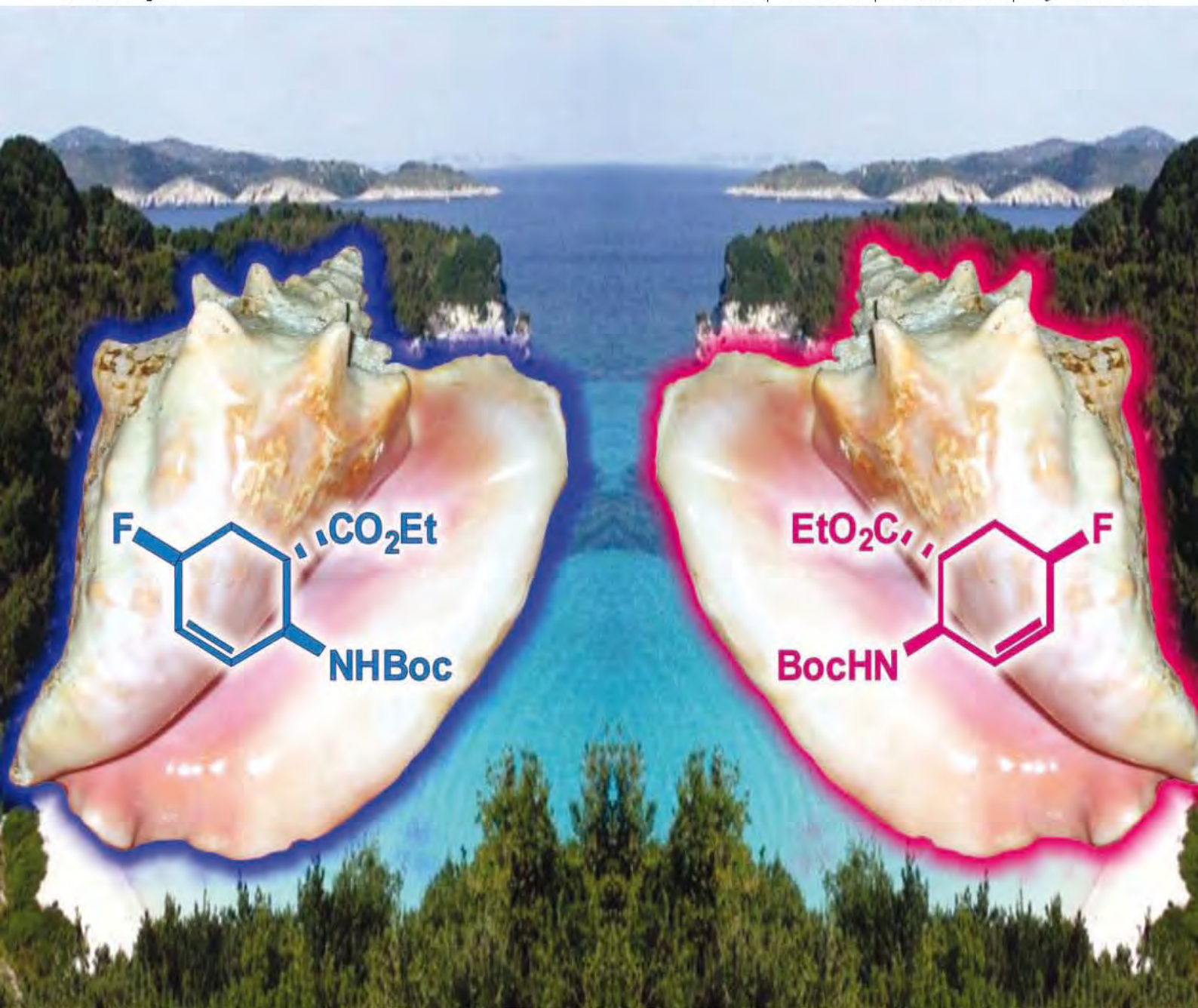


ChemPubSoc
Europe

Organic & Biomolecular Chemistry

www.rsc.org/obc

Volume 9 | Number 19 | 7 October 2011 | Pages 6449–6852



ISSN 1477-0520

RSC Publishing

FULL PAPER
Ferenc Fülöp *et al.*
Regio- and diastereoselective
fluorination of alicyclic β -amino acids



International Year of
CHEMISTRY
2011



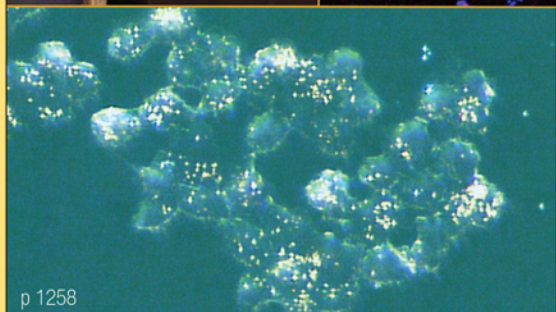
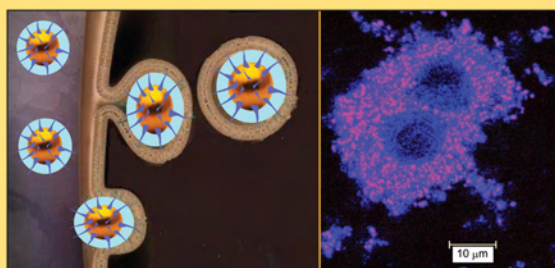
1477-0520(2011)9:19;1-P

CHEMICAL REVIEWS

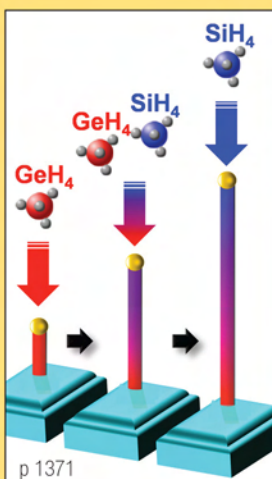
JANUARY 22, 2014

VOLUME 114 NUMBER 2

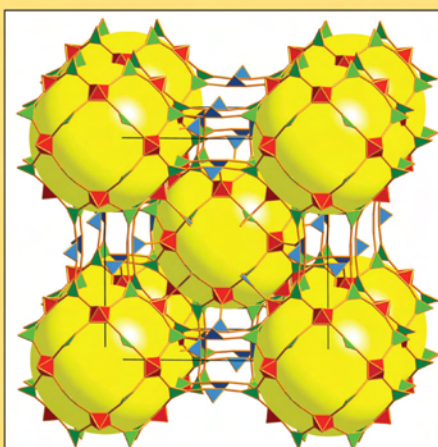
pubs.acs.org/CR



p 1258



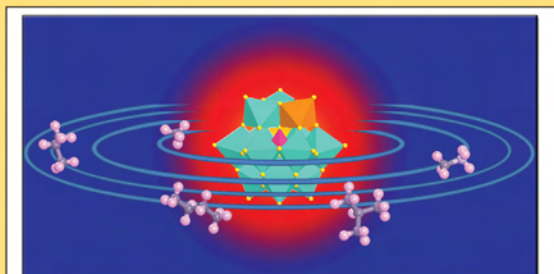
p 1371



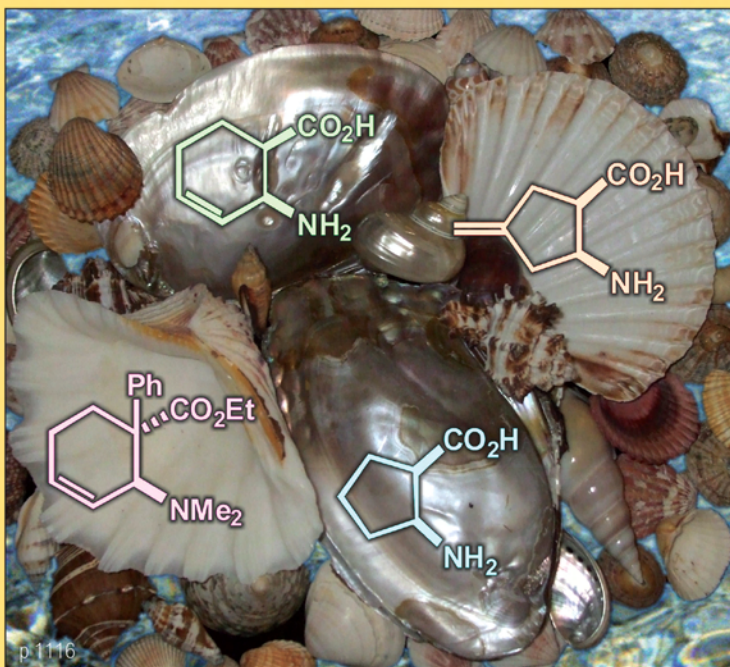
p 1343



p 1207



p 981



p 1116



ACS Publications

MOST TRUSTED. MOST CITED. MOST READ.

www.acs.org