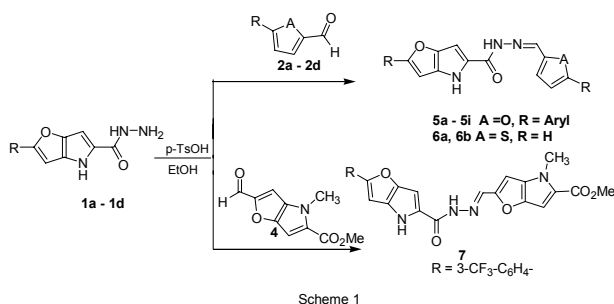


LIBLICE 2006 – DODATKY

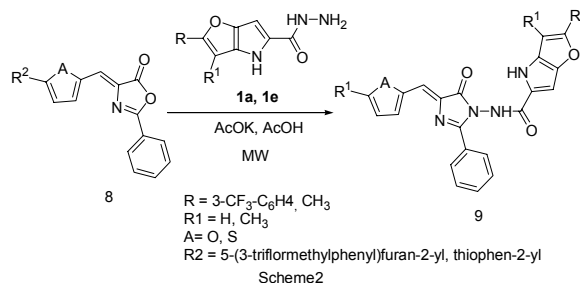
MICROWAVE-ASSISTED REACTIONS OF SUBSTITUTED FURO[3,2-*b*]PYRROLE-5-CARBOXYHYDRAZIDES AND THEIR BIOLOGICAL ACTIVITYRENATA GAŠPAROVÁ^a, MARTIN MONCMAN^a, DANIEL ZBOJEK^a, KATARÍNA KRÁĽOVÁ^b, and ALŽBETA KRUTOŠÍKOVÁ^a

^a Department of Chemistry, Faculty of Natural Sciences, University of St. Cyril and Methodius, Námestie Jozefa Herdu 2, SK-917 01 Trnava, Slovakia; ^b Institute of Chemistry, Faculty of Natural Sciences, Comenius University, Mlynská dolina CH-2, SK-842 15 Bratislava, Slovakia
gasparor@ucm.sk, kralova@fns.uniba.sk

The microwave-assisted reactions of substituted furo[3,2-*b*]pyrrole-5-carboxhydrazides **1** with 5-arylfuran-2-carboxaldehydes **2**, thiophene-2-carboxaldehyde **3** and methyl 2-formyl-4-methylfuro[3,2-*b*]pyrrole-5-carboxylate **4** has been studied (Scheme 1).



Reactions of **1** with 4-substituted 1,3-oxazol-5(4*H*)-ones **8** led to imidazole derivatives **9** (Scheme 2). The effects of hydrazones **5-7** on inhibition of photosynthetic electron transport in spinach chloroplasts and chlorophyll content in the anti-algal suspensions of *Chlorella vulgaris* were investigated³.



The authors are grateful to the VEGA Grant Agency of Slovak Ministry of Education for financial support by way of project: No. 1/3584/06

REFERENCES

- Krutošiková A., Ramsden C.A., Dandárová M., Lyčka A.: *Molecules* 2, 69 (1997).
- Krutošiková A., Dandárová M., Bobošik V.: *Collect. Czech. Chem. Commun.* 59, 473 (1994).
- Gašparová R., Zbojtek D., Lácová M., Král'ová K., Gatjal A., Horváth B., Krutošiková A.: *Cent. Eur. J. Chem.* 3, 622 (2005).

ISOFLAVONOIDY V ČELEDI *Cannabaceae*RADKA KOBLOVSKÁ^a, LADISLAV KOKOŠKA^b, BOŘIVOJ KLEJDUS^c a OLDŘICH LAPČÍK^a

^a Ústav chemie přírodních látek, FPBT VŠCHT v Praze, Technická 5, 166 28 Praha 6, ^b Ústav tropického a subtropického zemědělství, Česká zemědělská univerzita v Praze, Kamýčká 129, 165 21 Praha 6, ^c Ústav chemie a biochemie, Mendlova zemědělská a lesnická univerzita, Zemědělská 1, 613 00 Brno
oldrich.lapcik@vscht.cz

Isoflavonoidy jsou biologicky aktivní sekundární metabolity produkované v omezeném počtu rostlinných taxonů. Fylogenetické vztahy mezi producenty isoflavonoidů jsou dosud nejasné. Isoflavonoidy jsou rozšířeny zejména v čeledi Fabaceae (okolo 1000 známých struktur), mezi další klasické producenty patří čeledi Iridaceae a Moraceae.

V této studii jsme zjišťovali výskyt nejjednodušších isoflavonoidů ve dvou ekonomicky významných zástupcích čeledi *Cannabaceae* – chmelu otáčivém (*Humulus lupulus*) a konopí setém (*Cannabis sativa*). Spektrum stanovených látek zahrnovalo jak volné isoflavony (daidzein, genistein, formononetin, isoformononetin, biochanin A, prunetin) tak glykosidy (daidzin, genistin, ononin, sissotrin). Vzorčky chmelu odrůd Orion a Magnum a konopí Manitoba poison a Duke foot byly po odběru lyofilizovány, umlety na tříštinovém mlynku a extrahovány 70% methanolem. Extrakty byly analyzovány technikami HPLC-MS-SIM a HPLC-ELISA. Oba metodické přístupy potvrdily výskyt jak volných isoflavonů tak glykosidů v rozsahu jednotek až stovek mikrogramů na kg suché váhy.

Isoflavonoidy byly již dříve nalezeny v pivu^{1,2}, ale jejich původ v této komoditě byl nejasný. Mazur³ detegoval daidzein a genistein v několika vzorcích ječmene. Naše data ukazují, že část isoflavonoidů v pivu může pocházet z chmelu. Nado to se jedná o první popis výskytu isoflavonoidů v čeledi *Cannabaceae*.

Studie vznikla s podporou grantů GAČR 525/06/0864 a MSM6046137305.

LITERATURA

- Lapcik O., Hill M., Hampl R., Wähälä K., Adlercreutz H.: *Steroids* 63, 14 (1998).

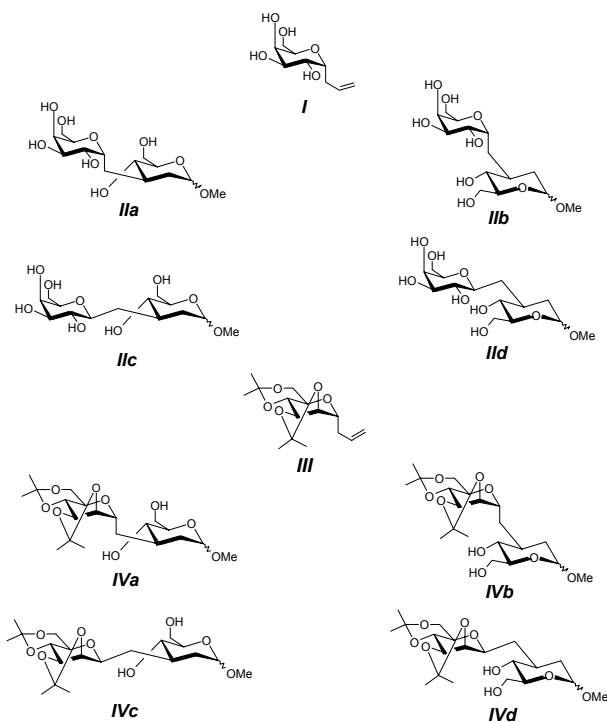
- Clarke D. B., Barnes K. A., Lloyd A. S.: *Food Add. Contam.* 21, 949 (2004).
- Mazur W., Adlercreutz H.: *Pure&Appl. Chem.* 70, 1759 (1998).

SYNTÉZA (1→3)-C-DISACHARIDŮ

KAMIL PARKAN, ONDŘEJ VICH a LADISLAV KNIEŽO

*Ústav chemie přírodních látek, Vysoká škola chemicko technologická, Technická 5, 166 28 Praha 6
parkank@vscht.cz*

Během několika posledních let je věnováno veliké úsilí k nalezení nových syntetických cest směřujících k C-disacharidům, jež jsou analoga přírodních disacharidů¹. V naší laboratoři byl nedávno vypracovaný nový způsob stereoselektivní syntézy (1→3)-C-disacharidů², založený na enantioselektivní hetero-Dielsově-Alderově reakci. Efektivitu tohoto postupu demonstrujeme v této práci, kde z jediné, snadno dostupné výchozí látky, tj. galaktopyranosylpropenu **I** lze stereoselektivně a v dobrých výtěžcích připravit čtyři diastereoisomerní (1→3)-C-disacharidy **II a-d**. Zatím předběžné výsledky potvrzují, že stejným přístupem lze z chráněného manopyranosylpropenu **III** připravit podobnou čtveřici diastereoisomerů **IV a-d**. Dostupnost nových (1→3)-C-disacharidů **II a-d**, resp. **IV a-d** umožní jednak podrobně studovat jejich vlastností a jednak je využít jako prekursory pro syntézu dalších látek s předpokládanými biologickými účinky.



Tato práce byla podporována MŠMT, v rámci výzk. záměru VZ. 6046137305.

LITERATURA

- Dondoni A., Marra A.: *Chem. Rev.* 104, 2557 (2004).
- Vich O., Kniežo L., Dvořáková H., Raich I., Valenta Š.: *Collect. Czech. Chem. Commun.* 70 2086, (2005).

SYNTÉZA C-ANALOGŮ PŘÍRODNÍHO 3-O-(β -D-GLUKOPYRANOSYL)-FAGOMINU

LUKÁŠ WERNER, LADISLAV KNIEŽO a ONDŘEJ VÍCH

*Ústav chemie přírodních látek, Technická 5, 166 28 Praha 6
wernerl@vscht*

Polyhydroxylované piperidiny^{1,2} patří do větší skupiny látek označovaných jako iminocukry a představují vlastně analogy pyranos. A je to právě náhrada pyranosového kyslíku za dusík co způsobuje, že jsou tyto sloučeniny schopny silně interagovat v aktivním místě glykosidas a projevují se jako jejich inhibitory. Jelikož se glykosidasy účastní mnoha biologicky důležitých procesů, jako jsou např. trávení, posttranslační modifikace glykoproteinů nebo katabolismus glykokonjugátů v lysosomech, mají látky, které jsou schopny ovlivňovat tyto procesy značný terapeutický potenciál.

Fagomin, který lze považovat za deoxyderivát známějších iminocukrů nojirimycinu a 1-deoxynojirimycynu, byl izolován z řady přírodních materiálů. V některých zdrojích jsou kromě fagominu 1 bsazeny i jeho stereoisomery a glukosidy.

Jeho biologická aktivita není tak široká jako u deoxynojirimycinu a nojirimycinu, ale přesto bylo prokázáno, že fagomin a 3-*epi*-fagomine vykazují inhibiční aktivitu vůči savčí střevní α -glucosidase and β -galactosidase. Dále bylo zjištěno, že má silný antihyperglycemický účinek v streptozocinem vyvolané diabetes u myši a zesiluje sekreci insulinu.

Zatím však není úplně jasné, jestli glykosidy fagominu (i dalších iminosacharidů) slouží v přírodních materiálech jenom jako zásoby iminosacharidů, které se z nich *in vivo* enzymaticky uvolňují, anebo hrají i jinou roli. Např. bylo prokázáno, že inhibiční aktivita fagominu vůči glykosidasam v případě 3-O-(β -D-glucopyranosyl)-fagominu a 4-O-(β -D-glucopyranosyl)-fagominu zaniká. Na druhé straně inhibiční studie různě glukosylovaných 1-deoxynojirimycinů prokázaly, že např. 3-O-(α -D-glucopyranosyl)-1-deoxynojirimycin si vůči krysí střevní sucrase zachovává stejnou inhibiční aktivitu jako samotný 1-deoxynojirimycin a vůči α -glucosidase z rýže se jeho inhibiční aktivita dokonce mírně zvyší.

Aby bylo možné získat více informací o úloze glykosylovaných iminosacharidu v těchto procesech rozhodli jsme se syntetizovat některé jejich C-glykosidy. V těchto případech je glykosydická vazba nahrazena C-C vazbou, která není enzymaticky hydrolyzovatelná a nemůže tedy uvolňovat fagomin v podmínkách *in vivo*.

V této práci prezentujeme stereoselektivní syntézu 3-*deoxy*-3-(α -D-glucopyranosylmethyl)-D-fagominu a jeho stereoisomeru 3-*deoxy*-3-(α -D-glucopyranosylmethyl)-L-fagominu.

LITERATURA

1. Current Topics in Medicinal Chemistry 2003, 5.
2. Afarinkia K., Bahar A.: Tetrahedron: Asymmetry 16, 1239 (2005).



Sborník abstraktů

Konference
Pokroky v organické, bioorganické
a farmaceutické chemii

41. Konference

4. – 6. prosince 2006