



SardiniaChem 2006

GIORNATA DI STUDIO DEDICATA ALLA CHIMICA ORGANICA
DELLE MOLECOLE BIOLOGICAMENTE ATTIVE

5 Giugno 2006, Complesso Universitario di Monserrato, Cagliari



COMITATO ORGANIZZATORE:

Salvatore Cabiddu - Università di Cagliari, Giovanna Delogu - CNR Sassari,
Pier Paolo Piras - Università di Cagliari, Giampaolo Giacomelli - Università di Sassari

HANNO CONTRIBUITO ALLA REALIZZAZIONE DEL CONVEGNO:

UNIVERSITÀ DI CAGLIARI; UNIVERSITÀ DI SASSARI-Dipartimento di Chimica; CNR-Istituto di
Chimica Biomolecolare, Sezione di Sassari; SIGMA-ALDRICH Srl; EXACTA+OPTTECH Sardegna S.r.l.,
CARLO ERBA REAGENTI; VWR INTERNATIONAL s.r.l.

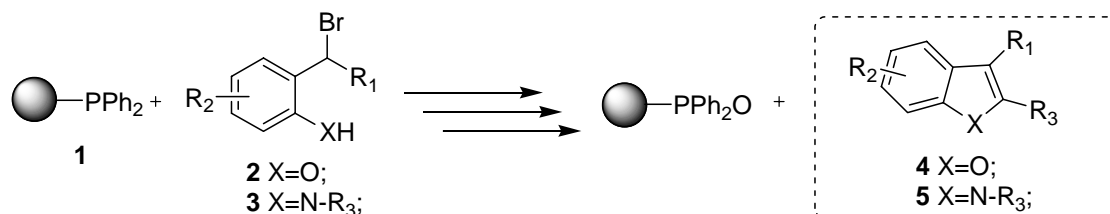
SINTESI DI LIBRERIE DI BENZOFURANI E INDOLI MEDIANTE STRATEGIA “CATCH AND RELEASE”

Lidia De Luca, Giampaolo Giacomelli and Giammarco Nieddu²

Dipartimento di Chimica, Università degli Studi di Sassari, via Vienna 2, I-07100, Sassari

L'importanza della sintesi organica in fase solida è in continua crescita parallelamente al concetto di chimica combinatoriale, che ha acquistato grande attenzione nella comunità scientifica accademica e industriale. L'impiego dei metodi combinatoriali è stato perfezionato col tempo diventando sempre più efficace e ha dato così accesso a concetti come “strutture privilegiate” e alla sintesi di librerie di composti farmacologicamente e biologicamente attivi². I sistemi benzofuranici e indolici sono presenti in un'ampia gamma di molecole, sia di origine naturale che sintetica, che mostrano svariate attività biologiche. In questo ambito, l'applicazione di strategie sintetiche combinatoriali come la metodologia “catch and release” può essere particolarmente efficace, in quanto i prodotti intermedi del processo vengono immobilizzati in forma attivata sulla resina, e per successivo trattamento con determinati reattivi si ottiene contemporaneamente la derivatizzazione e il rilascio del prodotto finale in soluzione.

In questo contesto viene descritto l'uso di sali di fosfonio legati ad un supporto solido per la sintesi di benzofurani mono-, di- e trisostituiti e indoli tetrasostituiti attraverso “catch and release strategy”. In base a questo metodo la resina trifenilfosfin-polistirenica **1** viene caricata con *o*-idrossibenzilbromuri **2**, e con *o*-acilamidebenzilbromuri **3**, in DMF sotto irraggiamento con microonde. Il successivo trattamento della resina ottenuta con cloruri acilici fornisce benzofurani **4** ed indoli **5** in buone rese e in maniera regiospecifica.



² gmrnd@uniss.it

² a) De Luca, L.; Giacomelli, G.; Porcheddu, A.; Salaris, M.; Taddei, M. *J. Comb. Chem.* **2003**, *5*, 465. b) De Luca, L.; Giacomelli, G.; Porcheddu, A.; Ruda, A. *J. Comb. Chem.* **2004**, *6*, 105. c) De Luca, L.; Giacomelli, G.; Porcheddu, A. *J. Comb. Chem.* **2005**, *7*, 905.