

## Abstrakt

Klíčový intermediát 6-amino-7-jodo-7-deazapurin 3'-deoxy-3'-fluororibonukleosid byl syntetizován přes vícekrokových sekvenčních reakcích, které byly zahájeny z komerčně dostupné D-xylózy a 6-chloro-7-deazapurinu. Syntetická strategie byla založena na fluorace cukru a následná glykosylace s odpovídající nukleobází. Fluorace 5-chráněného-1,2-isopropylidinu xylózy s odlišnými chránicími skupinami v pozici 5 vždy vedla k eliminaci produktu. Později bylo zjištěno, že isopropylidin vnucuje konformaci, která nepreferuje substituci. Během rozsáhlé optimalizace bylo zjištěno, že DAST je optimálním fluoračním činidlem. Fluorace byla prováděna na 2,3-nechráněné xylózy, která následně byla použita na glykosylace. Po několika neúspěšných pokusů o "protection group free" glykosylace, Vorbrüggenova glykosylace byla úspěšná a bylo získáno 3'-fluoro nukleosid s dobrým výtěžkem. Při použití Vorbrüggenovy glykosylace je potřeba ochránit OH skupinu na C2 benzoylem. Ochráněný nukleosid následně byl aminován a odchráněn pomocí roztoku NH<sub>3</sub> a 1,4-dioxanu. Získaný klíčový intermediát byl použit na syntézu malou série 6-amino-7-hetaryl nukleosid pomocí Pd-katalyzované Suzuki reakce ve vodném prostředí. Série 6-amino-7-hetaryl-7-deazapurin-3-fluororibonukleosidy byla nasytetizována a otestována pro její biologické účinky.

## Klíčová slova

Nukleosidy, 7-deazapuriny, fluorované nukleosidy,