

Abstrakt

Byly vyvinuty syntézy dvou sérií pyrimido[4,5-*b*]indolových nukleosidů modifikovaných v poloze 2'. Syntetický postup byl založen na transformaci 2'-hydroxylové skupiny 3',5'-chráněného ribonukleosidu. Klíčový intermediát byl připraven stereoselektivní glykosylací pomocí aniontu známé 4,6-dichloropyrimido[4,5-*b*]indolové nukleobáze a 2,3-*O*-isopropyliden-5-*O*-TBS-chráněné halogenosy, následované deprotekcí v kyselém prostředí a chráněním 3'- a 5'-hydroxylových skupin Markiewiczovým reagentem. Pyrimidoindolový arabinonukleosid byl připraven sekvencí oxidace-redukce 2'-hydroxy stereogenního centra. Syntéza pyrimidoindolového 2'-deoxy-2'-fluororibonukleosidu byla završena stereoselektivní S_N2 fluorací THP-chráněného arabinosidu a následnou deprotekcí kyselou hydrolyzou. Pro testy biologické aktivity pak byly použitím nukleofilní substituce nebo Pd-katalyzovaných cross-couplingových reakcí připraveny dvě série 4-substituovaných arabinonukleosidů a 2'-deoxy-2'-fluororibonukleosidů.