

Abstrakt

Nejprve byla sérií syntetických reakcí připravena sada pěti aziridinů 1,6-anhydrohexos mající *D-manno*, *D-allo*, *D-galakto* and *D-talo* konfiguraci. Z 1,6:2,3- a 1,6:3,4-dianhydro- β -D-hexopyranos byly azidolýzou a tosylací připraveny vicinální azidosyláty, které byla následně redukovány za použití NaBH_4 nebo LiAlH_4 . Takto byl zaveden do molekuly aziridinový kruh. Z volných aziridinů byly dále připraveny *N*-substituované epiminy ve výtěžcích 61-67 %.

Fluorace pomocí DAST byla založena na reakci *N*-benzylovaných epiminů majících volnou hydroxyskupinu ve vicinální poloze s diethylaminosulfurtrifluoridem v dichlormethanu, při které se hydroxylová skupina nahradí fluorem a vzniknou vicinální fluoroaziridiny. V žádném z provedených pokusů nereagoval DAST s aziridinovým kruhem. Z devíti různých výchozích cukerných epiminů ale pouze dva poskytly žádané produkty ve výtěžcích okolo 45 %.

Pro reakci s KHF_2 musela být zavedena do molekuly epiminu aktivující nosyllová skupina. Chránicí a současně aktivující 2-nitrobenzensulfonylová skupina byla

připravena účinkem 2-nitrobenzenesulfonyl chloridu ve směsi triethylamin-tetrahydrofuran při teplotě -30 až -40 °C. Výtěžek cílových nosylepiminů se pohyboval v rozmezí 37-93 %.

Otevření aziridinového kruhu *N*-nosylepiminů bylo provedeno použitím hydrogendifluoridu draselného za různých reakčních podmínek. Reakcí přednostně vznikly, v souladu s Fůrstovým-Plattnerovým pravidlem, *trans*-diaxiální isomery vicinálních fluoro amino derivátů 1,6-anhydro- β -D-hexopyranos ve výtěžku 31-90 %. V některých případech byly v reakční směsi přítomny diekvatoriální isomery.

Chránicí 2-nitrobenzenesulfonylová skupina byla odstraněna reakcí s benzenothiolem a uhlíčitánem draselným ve směsi aceton-voda. Odchránění bylo vyzkoušeno pouze na jednom fluoroderivátu.

Struktury všech připravených fluoroderivátů byly potvrzeny NMR spektroskopii.