

بِسْمِ اللَّهِ الرَّحْمَنِ الرَّحِيمِ



دانشگاه تبریز

دانشکده شیمی

گروه شیمی آلی و بیوشیمی

پایاننامه

برای دریافت درجه کارشناسی ارشد در رشته شیمی آلی

عنوان

سنتز محصولات بایلیس-هیلمن از طریق واکنش پایرون کربالدهید با انواع

کتونها و استرهای مزدوج

استادان راهنما:

دکتر عزیز شهریسا

دکتر رضا تیموری مفرد

استادان مشاور:

۱۳۸۹/۸/۱۰

دکتر علی اکبر انتظامی

دکتر حسن نمازی

پژوهشگر:

مینا اشتاد

تابستان ۱۳۸۹

تعمیرات مدرک علمی زیلا
نسبت مدرک

۱۴۴۹۱۸

تقدیم ہے:

بہ استاد ابرہم مذم

جناب آقای دکتر عزیز شہریسا

بہ خاطر زحمات بی دریغشان

تقدیم بہ:

دو کوہرارز شمنڈ زندگیم

پدر بزرگوار و مادر مہربانم

بہ خاطر زحمات بی دریغ شان در تمام مراحل زندگیم

تقدیم بہ:

یگانہ خواہر و یگانہ برادرم بہ خاطر حضور پر مہر شان

اکنون که به یاری خداوند متعال موفق به گذراندن این مرحله از تحصیل و زندگی گشته‌ام، بر خود لازم می‌دانم قدردان و سپاسگذار تمام کسانی باشم که در طول این دوره از مساعدت ایشان بهره‌مند شده‌ام:

از زحمات بی‌دریغ و تلاش‌های بی‌شائبه اساتید راه‌نمای ارجمندم جناب آقای دکتر عزیز شریسا و جناب آقای دکتر رضایت‌موری مفرد کمال تشکر و قدردانی را دارم.

از اساتید مشاور بزرگوارم جناب آقای دکتر علی اکبر انظامی که افتخار شاگردی در محضر ایشان را داشتم و جناب آقای دکتر حسن غازی ریاست محترم دانشکده شیمی کمال تشکر و قدردانی را دارم.

از مدیریت محترم گروه شیمی آلی جناب آقای دکتر کاظم دیندار صفا به جهت قبول زحمت داور این رساله کمال تشکر و قدردانی را دارم.

از معاونت محترم پژوهشی جناب آقای دکتر نیایی و معاونت محترم آموزشی جناب آقای دکتر خاندان کمال تشکر و قدردانی را دارم.

از تمام کارکنان دانشکده شیمی به ویژه، سرکار خانم کبیری و جناب آقای صفی و آقای نیسی کمال تشکر و قدردانی را دارم.

از تمامی دوستان و هم‌آزمایان گرامی‌های عزیزم خانم دکتر قاسمی، زیرک، پور حسین، عسیمی، الله‌یرودی نسب، نظری، طرفه و آقای نظری به جهت مساعدت‌ها و همکاری‌های ارزنده‌شان و به جهت ایجاد جو صمیمی کمال تشکر و قدردانی را دارم.

از تمام دوستانم در سایر آزمایشگاه‌های پژوهشی دانشکده شیمی به جهت همکاری‌های ارزنده‌شان تشکر و قدردانی می‌نمایم.

نام خانوادگی دانشجو: اشتاد

نام: مینا

عنوان پایان نامه: سنتز محصولات بایلیس-هیلمن از طریق واکنش پایرون کربالدهید با انواع کتونها و استرهای مزدوج

استادان راهنما: دکتر عزیز شهریساو دکتر رضا تیموری مفرد

استادان مشاور: دکتر علی اکبر انتظامی و دکتر حسن نمازی

مقطع تحصیلی: کارشناسی ارشد رشته: شیمی گرایش: آلی دانشگاه: تبریز

دانشکده: شیمی تاریخ فارغ التحصیلی: ۱۳۸۹/۶/۳۰ تعداد صفحه: ۸۶

کلید واژه: $H-4$ پیران- 4 -اون، بایلیس-هیلمن، آکریلات، آلکیل وینیل کتون

چکیده:

هدف اصلی از این کار پژوهشی سنتز برخی از محصولات بایلیس-هیلمن از طریق واکنش آلکیل وینیل کتونها و آکریلات ها با 4 -پایرون- 2 -کربوکسالدئیدها است. برای این منظور 4 -اکسو- 6 -فنیل- $H-4$ پیران- 2 -کربوکسالدئید و 5 -بنزیلوکسی- 2 -کربوکسالدئید- $H-4$ پیران- 4 -اون با آلکیل وینیل کتونها و بوتیل آکریلات در حضور DABCO (1 و 4 -دی آزابی سیکلو [۲و۲و۲]اکتان) به مدت ۱ ساعت وارد واکنش شدند.

مناسب ترین حلال در واکنش آلکیل وینیل کتونها THF می باشد در حالیکه در مورد بوتیل آکریلات مخلوط آب:دی اکسان با نسبت (۱:۱) به عنوان حلال مناسب مورد استفاده قرار گرفت. تمامی محصولات بدست آمده بوسیله کروماتوگرافی لایه نازک روی سیلیکاژل خالص سازی شده و توسط روش های IR, 1H NMR, ^{13}C NMR, CHNs مورد آنالیز قرار گرفتند.

فهرست

عنوان	صفحه
-------	------

فصل اول : بررسی منابع

۱-۱- اهمیت سنتزی و بیولوژیکی ۴-پایرون‌ها و مشتقات هتروسیکل دار آن‌ها.....	۱
۱-۲-۳- هیدروکسی-۴-پایرون‌ها.....	۱
۱-۳- اهمیت و سنتز ترکیبات حامل بخش ۴-پایرون.....	۴
۱-۴- اهمیت بنزو-۷-پایرون‌ها و سنتز آن‌ها.....	۶
۱-۵- اهمیت ۳-پلی فلوئورو آسیل کرمون‌ها و کاربردهای آن در سنتز مشتقات نیکوتینیک اسید.....	۹
۱-۶- واکنش ۳-(پلی فلوئورو آسیل) کرومون‌ها.....	۹
۱-۷- واکنش باایلیس-هیلمن : اهمیت و کاربردهای سنتزی.....	۱۱

فصل دوم : بخش تجربی

۲-۱- خشک کردن حلال‌ها، تهیه و خالص سازی مواد اولیه.....	۲۴
۲-۱-۱- متانول (CH_3OH).....	۲۴
۲-۱-۲- دی کلرومتان (CH_2Cl_2).....	۲۵
۲-۱-۳- منگنز دی اکسید (MnO_2).....	۲۵
۲-۱-۴- اتیل آکریلات، بوتیل آکریلات، متیل وینیل کتون و اتیل وینیل کتون.....	۲۶

- ۲-۲- تهیه تری کتون های مورد نیاز برای سنتز مشتقات ۴-پایرون..... ۲۶
- ۲-۲-۱- سنتز اتیل ۶-فنیل-۲ و ۶-تری اکسو هگزانات (۱)..... ۲۶
- ۲-۳- تهیه مشتقات ۴-پایرون..... ۲۷
- ۲-۳-۱- سنتز ۲-اتوکسی کربونیل ۶-فنیل-۴H-پیران-۴-اون (۲)..... ۲۷
- ۲-۳-۲- سنتز ۲-هیدروکسی متیل ۶-فنیل-۴H-پیران-۴-اون (۳)..... ۲۷
- ۲-۳-۳- سنتز ۲-کربالدئید ۶-فنیل-۴H-پیران-۴-اون (۴)..... ۲۸
- ۲-۳-۴- سنتز ۵-بنزیلوکسی-۲-هیدروکسی متیل-۴H-پیران-۴-اون (کوجیک اسید-بنزیل اتر (۵)) .. ۲۹
- ۲-۳-۵- سنتز ۵-بنزیلوکسی-۲-کربالدئید-۴H-پیران-۴-اون (۶)..... ۳۰
- ۲-۴- تهیه مشتقات بایلیس-هیلمن در ۴-پایرون ها..... ۳۱
- ۲-۴-۱- روش عمومی واکنش ۲-فرمیل-۴-پایرون های (۴) و (۶) با اتیل و بوتیل آکریلات ۳۱
- ۲-۴-۱-۱- سنتز ۲- [هیدروکسی- (۴-اکسو-۶-فنیل-۴H-پیران-۲-ایل) متیل]-آکریلیک اسید-بوتیل
استر (۷)..... ۳۱
- ۲-۴-۱-۲- سنتز ۲- [(۵-بنزیلوکسی-۴-اکسو-۴H-پیران-۲-ایل) هیدروکسی متیل]-آکریلیک اسید
-بوتیل استر (۸)..... ۳۲
- ۲-۴-۱-۳- سنتز ۲- [(۵-بنزیلوکسی-۴-اکسو-۴H-پیران-۲-ایل) هیدروکسی متیل]-آکریلیک اسید
-اتیل استر (۹)..... ۳۳
- ۲-۴-۲- روش عمومی استیلاسیون محصولات افزایشی بایلیس-هیلمن..... ۳۴
- ۲-۴-۲-۱- سنتز ۲- [استوکسی (۵-بنزیلوکسی-۴-اکسو-۴H-پیران-۲-ایل) متیل]-آکریلیک اسید
-اتیل استر (۱۰)..... ۳۵

۲-۴-۳-روش عمومی واکنش ۲-فرمیل-۴-پایرون های(۴)و(۶) با متیل و اتیل وینیل کتون

۳۵.....

۲-۴-۳-۱-سنتز ۵-بنزیلوکسی-۲-[(۱-هیدروکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو)بوتیل]-۴H-پیران-۴-اون

۳۶.....(۱۱)

۲-۴-۳-۲-سنتز ۲-[(۱-هیدروکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو)بوتیل]-۶-فنیل-۴H-پیران-۴-اون(۱۲).....۳۷

۲-۴-۳-۳-سنتز ۵-بنزیلوکسی-۲-[(۱-هیدروکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو)پتیل]-۴H-پیران-۴-اون

۳۸.....(۱۳)

۲-۴-۳-۴-سنتز ۲-[(۱-هیدروکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو)پتیل]-۶-فنیل-۴H-پیران-۴-اون

۳۹.....(۱۴)

۲-۴-۳-۵-سنتز ۲-(۱-استوکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو-بوتیل)-۵-بنزیلوکسی-۴-اکسو-۴H-پیران(۱۵).

۳۹.....

فصل سوم : نتایج و بحث

۳-۱- بررسی واکنش های بیلینس- هیلین در ۲-فرمیل-۴-پایرون ها.....۴۱

۳-۲- بررسی سنتز ۲-[(۱-هیدروکسی-۴-اکسو-۶-فنیل-۴H-پیران-۲-ایل)متیل]-آکرلیک اسید

۴۳..... بوتیل استر(۷)

۳-۳- بررسی سنتز ۲-[(۵-بنزیلوکسی-۴-اکسو-۴H-پیران-۲-ایل)هیدروکسی متیل]-آکرلیک اسید

۴۷..... بوتیل استر(۸)

۳-۴- بررسی سنتز ۲-[(۵-بنزیلوکسی-۴-اکسو-۴H-پیران-۲-ایل)هیدروکسی متیل]-آکرلیک اسید

۵۱..... اتیل استر(۹)

- ۳-۵- بررسی سنتز ۲ -[استوکسی (۵-بنزیلوکسی-۴-اکسو- H -پیران-۲-ایل)متیل]-آکریلیک اسید
 -تیل استر (۱۰)..... ۵۴
- ۳-۶- بررسی سنتز ۵ -بنزیلوکسی-۲-[۱-هیدروکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو]بوتیل- H -پیران
 -۴-اون (۱۱)..... ۵۸
- ۳-۷- بررسی سنتز ۲-[۱-هیدروکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو]بوتیل-۶-فنیل- H -پیران-۴-اون (۱۲)..
 ۶۲
- ۳-۸- بررسی سنتز ۵ -بنزیلوکسی-۲-[۱-هیدروکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو]پتیل- H -پیران
 -۴-اون (۱۳)..... ۶۶
- ۳-۹- بررسی سنتز ۲-[۱-هیدروکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو]پتیل-۶-فنیل- H -پیران-۴-اون (۱۴)
 ۷۰
- ۳-۱۰- بررسی سنتز ۲-(۱-استوکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو)بوتیل-۵-بنزیلوکسی-۴-اکسو- H -
 پیران (۱۵)..... ۷۴
- ۷۹ منابع
- ۸۵ نتیجه گیری
- ۸۶ پیشنهادات
- ضمیمه

فصل اول: بررسی منابع

- شکل ۱-۱: محصولات طبیعی شامل بخش ۴-پایرون..... ۵
- شکل ۱-۲: طرحی از کروماتوگراف حاوی بخش ۴-پایرون..... ۷
- شکل ۱-۳: مولکول‌های فعال بیولوژیکی شامل بخش‌های ایندول و کینولین..... ۲۰

فصل سوم: بحث و نتایج

- شکل ۳-۱: طیف FT-IR(KBr) ترکیب (۷)..... ۴۴
- شکل ۳-۲: طیف $^1\text{H NMR}$ ترکیب (۷) در حلال CDCl_3 ۴۵
- شکل ۳-۳: طیف $^1\text{H NMR}$ بسط یافته ترکیب (۷) در حلال CDCl_3 ۴۶
- شکل ۳-۴: طیف $^{13}\text{C NMR}$ ترکیب (۷) در حلال CDCl_3 ۴۷
- شکل ۳-۵: طیف FT-IR(KBr) ترکیب (۸)..... ۴۸
- شکل ۳-۶: طیف $^1\text{H NMR}$ ترکیب (۸) در حلال CDCl_3 ۴۹
- شکل ۳-۷: طیف $^1\text{H NMR}$ بسط یافته ترکیب (۸) در حلال CDCl_3 ۵۰
- شکل ۳-۸: طیف $^{13}\text{C NMR}$ ترکیب (۸) در حلال CDCl_3 ۵۱
- شکل ۳-۹: طیف FT-IR(KBr) ترکیب (۹)..... ۵۲
- شکل ۳-۱۰: طیف $^1\text{H NMR}$ ترکیب (۹) در حلال CDCl_3 ۵۳
- شکل ۳-۱۱: طیف $^{13}\text{C NMR}$ ترکیب (۹) در حلال CDCl_3 ۵۴
- شکل ۳-۱۲: طیف FT-IR(KBr) ترکیب (۱۰)..... ۵۶

- شکل ۳-۱۳: طیف $^1\text{H NMR}$ ترکیب (۱۰) در حلال CDCl_3 ۵۷
- شکل ۳-۱۴: طیف $^1\text{H NMR}$ بسط یافته ترکیب (۱۰) در حلال CDCl_3 ۵۷
- شکل ۳-۱۵: طیف $^{13}\text{C NMR}$ ترکیب (۱۰) در حلال CDCl_3 ۵۸
- شکل ۳-۱۶: طیف FT-IR(KBr) ترکیب (۱۱)..... ۵۹
- شکل ۳-۱۷: طیف $^1\text{H NMR}$ ترکیب (۱۱) در حلال CDCl_3 ۶۰
- شکل ۳-۱۸: طیف $^1\text{H NMR}$ بسط یافته ترکیب (۱۱) در حلال CDCl_3 ۶۰
- شکل ۳-۱۹: طیف $^{13}\text{C NMR}$ ترکیب (۱۱) در حلال CDCl_3 ۶۲
- شکل ۳-۲۰: طیف FT-IR(KBr) ترکیب (۱۲)..... ۶۳
- شکل ۳-۲۱: طیف $^1\text{H NMR}$ ترکیب (۱۲) در حلال CDCl_3 ۶۴
- شکل ۳-۲۲: طیف $^1\text{H NMR}$ بسط یافته ترکیب (۱۲) در حلال CDCl_3 ۶۵
- شکل ۳-۲۳: طیف $^{13}\text{C NMR}$ ترکیب (۱۲) در حلال CDCl_3 ۶۶
- شکل ۳-۲۴: طیف FT-IR(KBr) ترکیب (۱۳)..... ۶۷
- شکل ۳-۲۵: طیف $^1\text{H NMR}$ ترکیب (۱۳) در حلال CDCl_3 ۶۸
- شکل ۳-۲۶: طیف $^1\text{H NMR}$ بسط یافته ترکیب (۱۳) در حلال CDCl_3 ۶۹
- شکل ۳-۲۷: طیف $^{13}\text{C NMR}$ ترکیب (۱۳) در حلال CDCl_3 ۷۰
- شکل ۳-۲۸: طیف FT-IR(KBr) ترکیب (۱۴)..... ۷۱
- شکل ۳-۲۹: طیف $^1\text{H NMR}$ ترکیب (۱۴) در حلال CDCl_3 ۷۲
- شکل ۳-۳۰: طیف $^1\text{H NMR}$ بسط یافته ترکیب (۱۴) در حلال CDCl_3 ۷۳
- شکل ۳-۳۱: طیف $^{13}\text{C NMR}$ ترکیب (۱۴) در حلال CDCl_3 ۷۴
- شکل ۳-۳۲: طیف FT-IR ترکیب (۱۵)..... ۷۵

شکل ۳-۳۳: طیف $^1\text{H NMR}$ ترکیب (۱۵) در حلال CDCl_3 ۷۶

شکل ۳-۳۴: طیف $^{13}\text{C NMR}$ ترکیب (۱۵) در حلال CDCl_3 ۷۷

صفحه

فهرست شماها

فصل اول: بررسی منابع

- شمای ۱-۱: جایگزینی گروه هیدروکسی موقعیت ۵ در کوچیک اسید..... ۳
- شمای ۱-۲: تبدیل گروه OH کوچیک اسید برای انجام واکنش های کوپل شدن..... ۳
- شمای ۱-۳: واکنش هک و سوزوکی در مشتق تریفلات ۴-پایرون..... ۴
- شمای ۱-۴: جفت شدن استایل..... ۴
- شمای ۱-۵: تولید پلی پروپیونات مشتق شده از ۴-پایرون..... ۶
- شمای ۱-۶: واکنش آلدول ۲ و ۶ دی اتیل-۳ و ۵-دی متیل-۴-پایرون و پروپیونالدهید..... ۶
- شمای ۱-۷: طرحی از کروموم ها حامل بخش ۴-پایرون..... ۷
- شمای ۱-۸: سنتز ساختار های شامل کروموم ها..... ۸
- شمای ۱-۹: سنتز DTC و ۲ و ۳ و ۶ کروموم ها..... ۹
- شمای ۱-۱۰: واکنش ۳-(پلی فلوئوروآسیل) کروموم ها..... ۱۰
- شمای ۱-۱۱: نقش DABCO به عنوان کاتالیزگر در واکنش بایلیس-هیلمن..... ۱۱
- شمای ۱-۱۲: واکنش بایلیس-هیلمن..... ۱۲
- شمای ۱-۱۳: مکانیسم واکنش بایلیس-هیلمن در حضور DABCO..... ۱۲
- شمای ۱-۱۴: تری متیل آمین آبدار به عنوان حد واسط واکنش بایلیس-هیلمن..... ۱۲

- شماى ۱-۱۵: نمونه هاى واكنش بايلىس-هيلمى.....۱۳
- شماى ۱-۱۶: واكنش بايلىس-هيلمى كاتاليز شده با DABCO.....۱۴
- شماى ۱-۱۷: نمونه هاى از مايعات يونى بكار رنده در فرايند بايلىس-هيلمى.....۱۴
- شماى ۱-۱۸: نمونه هاى سنتز پيريميدين هاى استخلاف دار از محصولات بايلىس-هيلمى.....۱۵
- شماى ۱-۱۹: آناليز تهيه پيريميديو [2-1,b] كوئينازولين.....۱۶
- شماى ۱-۲۰: سنتز كوئينازولين ها از محصولات بايلىس-هيلمى.....۱۷
- شماى ۱-۲۱: سنتز تراهيروپيريميدين-۲-اون ها از محصولات بايلىس-هيلمى.....۱۸
- شماى ۱-۲۲: مكانيسم تشكيل حلقه پيريميدين.....۱۹
- شماى ۱-۲۳: سنتز مشتقات ايندوليل، كينولين.....۲۰
- شماى ۱-۲۴: سنتز ۱-۵-دى آريل پيرازول ها.....۲۱
- شماى ۱-۲۵: سنتز پيرول هاى چند استخلافى از محصولات بايلىس-هيلمى.....۲۲
- شماى ۱-۲۶: سنتز تراهيرو پيريدىن هاى استخلاف دار از محصولات بايلىس-هيلمى.....۲۳

فصل سوم: بحث و نتايج

- شماى ۳-۱. مراحل سنتزى ۲-فرميل-۶-فنيل-۴-پايرون (۴).....۴۲
- شماى ۳-۲. مراحل سنتزى ۵-بنزيلوكسى-۲-فرميل-۴-پايرون (۶).....۴۲
- شماى ۳-۳. واكنش تهيه MnO_2 در آزمايشگاه.....۴۲
- شماى ۳-۴: شرايط واكنش بايلىس-هيلمى.....۴۳

- شمای ۳-۵ : واکنش سنتز ۲-[هیدروکسی-(۴-اکسو-۶-فنیل-۴H-پیران-۲-ایل)متیل]-
 آکرلیک اسید-بوتیل استر (۷)..... ۴۴
- شمای ۳-۶: واکنش سنتز ۲-[۵-بنزیلوکسی-(۴-اکسو-۴H-پیران-۲-ایل)هیدروکسی متیل]-
 آکرلیک اسید-بوتیل استر (۸)..... ۴۸
- شمای ۳-۷: واکنش سنتز ۲-[۵-بنزیلوکسی-(۴-اکسو-۴H-پیران-۲-ایل)هیدروکسی متیل]-
 آکرلیک اسید-اتیل استر (۹)..... ۵۲
- شمای ۳-۸: واکنش سنتز ۲-[استوکسی (۵-بنزیلوکسی-(۴-اکسو-۴H-پیران-۲-ایل)متیل)-
 آکرلیک اسید-اتیل استر (۱۰)..... ۵۵
- شمای ۳-۹ : واکنش سنتز ۵-بنزیلوکسی-۲-[۱-هیدروکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو)بوتیل]-
 ۴H-پیران-۴-اون (۱۱)..... ۵۹
- شمای ۳-۱۰: واکنش سنتز ۲-[۱-هیدروکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو)بوتیل]-۶-فنیل-۴H-پیران-
 ۴-اون (۱۲)..... ۶۲
- شمای ۳-۱۱: واکنش سنتز ۵-بنزیلوکسی-۲-[۱-هیدروکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو)پتیل]-
 ۴H-پیران-۴-اون (۱۳)..... ۶۶
- شمای ۳-۱۲: واکنش سنتز ۲-[۱-هیدروکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو)پتیل]-۶-فنیل-
 ۴H-پیران-۴-اون (۱۴)..... ۷۰
- شمای ۳-۱۳: واکنش سنتز ۲-(۱-استوکسی-۲-متیلیدن-۳-اکسو-بوتیل)-۵-بنزیلوکسی-
 ۴-اکسو-۴H-پیران (۱۵)..... ۷۴

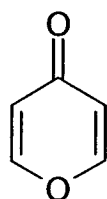
اختصارات

DABCO	او۴-دی آزا بی سیکلو[۲و۲و۲]اكتان
THF	تترا هیدرو فوران
DME	دی متوکسی اتان
DMAP	۴-دی متیل آمینوپیریدین
NBS	<i>N</i> -برموسوکسینیمید
DBU	او۸-دی آزا بی سیکلو[۵و۴و۰]آن دک-۷-ان
DMF	<i>N,N</i> -دی متیل فرمامید

فصل اول: بررسی منابع

۱-۱- اهمیت سنتزی و بیولوژیکی ۴-پایرون ها و مشتقات هتروسیکل دار آنها:

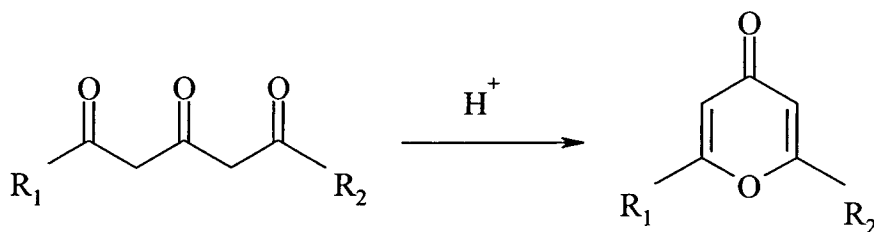
۴-پایرون ها (۴H-پیران-۴-اون ها) دسته دیگری از ترکیبات هتروسیکل اکسیژن دار می باشند. بررسی ها حاکی از بیرنگ بودن و کریستالی بودن ۴H-پیران-۴-اون با نقطه ذوب 32°C است. ساختار این سیستم ها مشابه با سیستم های کربونیل دار α و β غیر اشباع می باشد [۱،۲].



4H-pyran-4-one

(4-pyrone)

۴-پایرون ها را می توان به روش های مختلف سنتز نمود. حلقه زایی مشتقات ۳و۵-تری کتون ها در شرایط اسیدی از جمله مهم ترین این روش ها برای سنتز ترکیبات ۲و۶-دی استخلاف دار ۴-پایرون ها شناخته شده است [۳،۴].



$R_1, R_2 = \text{Ph, Aryl, COOEt, Heterocycl, ...}$

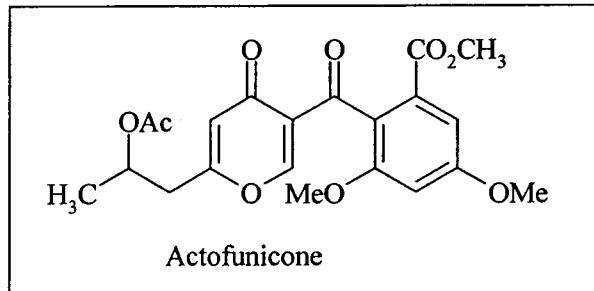
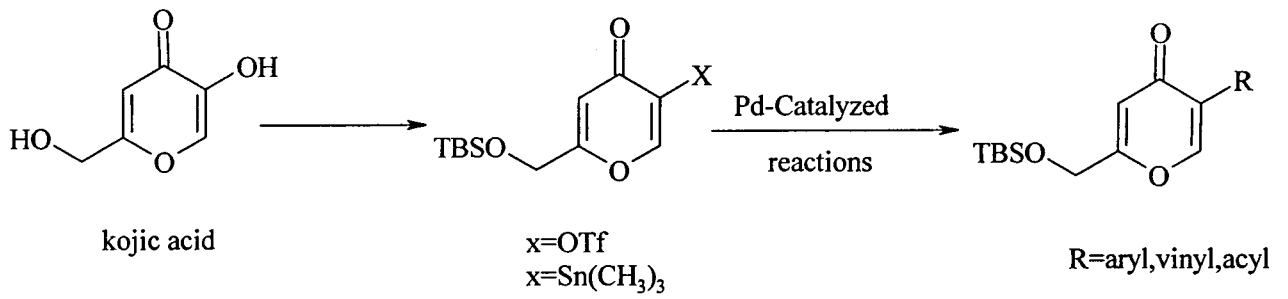
۱-۲-۳- هیدروکسی-۴-پایرون ها

۳-هیدروکسی-۴-پایرون ها دسته مهمی از ترکیبات فعال بیولوژیکی بشمار می آیند [۵]. واحد ۴-پایرون در تنوع وسیعی از محصولات بیولوژیکی طبیعی جالب، قابل مشاهده است. تعدادی روش برای سنتز ۴-

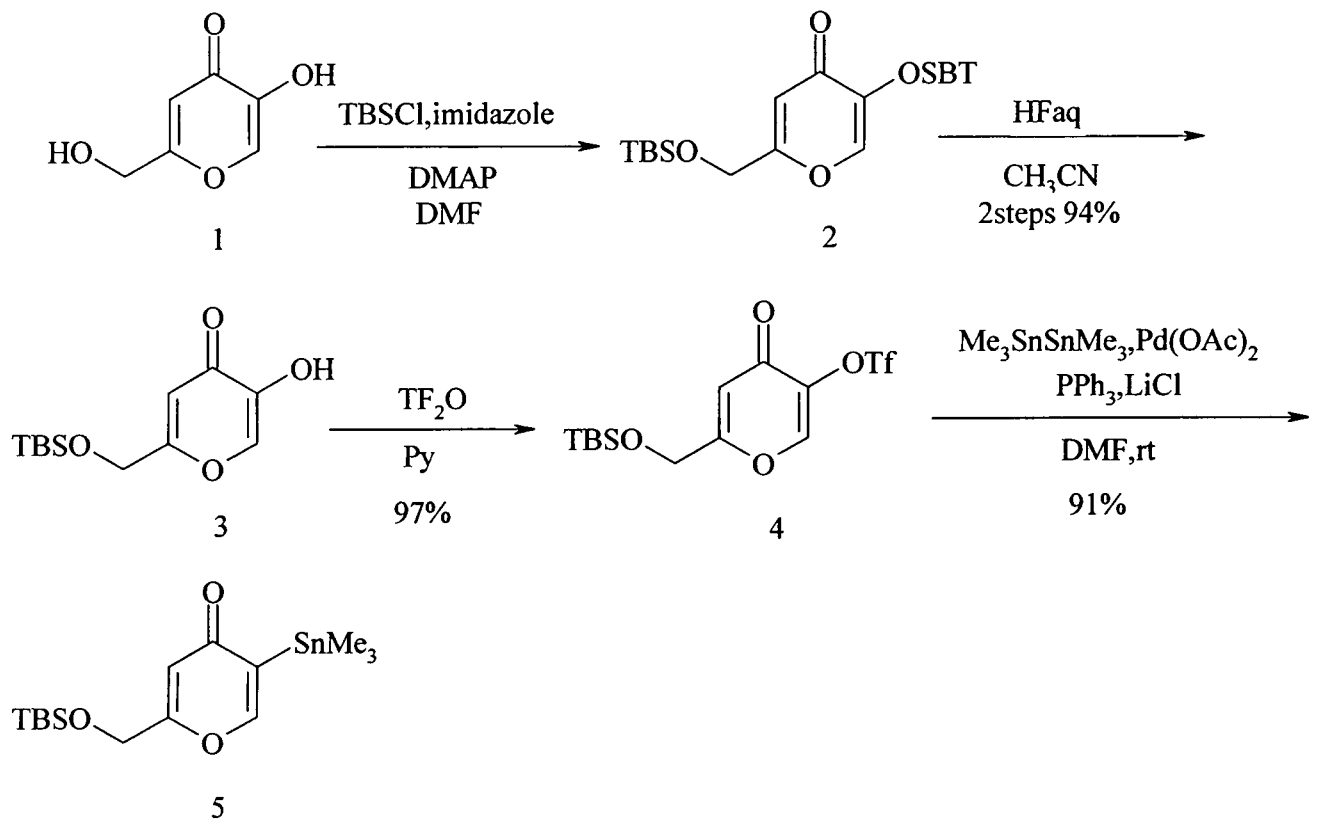
پایرون ها وجود دارد که اغلب آنها شامل حلقه زایی با حد واسط اسیدی یک پیش ماده تری کتوننی مناسب است. کوچیک اسید بطور موثر به عنوان سینتن در سنتز ۴-پایرون های استخلاف دار در موقعیت ۵ بکار نمی رود. چنانچه گروه هیدروکسی موقعیت ۵ با گروهی دیگر جایگزین گردد، ماده جدیدی برای سنتز ترکیبات ۴-پایرون استخلاف دار در موقعیت ۵ حاصل خواهد شد.

در شمای ۱-۱ نمونه ای از تبدیل گروه هیدروکسی موقعیت ۵ کوچیک اسید به گروه عاملی دیگر مشاهده می شود [۹،۷،۶].

- ترکیب داخل کادر که مشتق شده از کوچیک اسید می باشد، فعالیت ضدقارچی بر علیه کانیدیا آلبیکانس^۱ که گونه ای از قارچ های مخمر عفونت زا در بدن انسان است، را نشان می دهد. این ماده در واقع اثر دارویی شناخته شده مایکونازول^۲ را تقویت می کند. برای سنتز این ماده از روشی استفاده شده است که در آن با تبدیل گروه OH موقعیت ۵ کوچیک اسید به گروه تریفلات می توان انواع واکنش های جفت شدن آروماتیک ها را در این موقعیت عملی ساخت. شمای (۱-۲)، نیز تبدیل های گروه OH به گروه های عاملی دیگر را نشان می دهد [۶-۸].



شماي ۱-۱: جایگزینی گروه هیدروکسی موقعیت ۵ در کوجیک اسید



شماي ۱-۲: تبدیل گروه OH کوجیک اسید برای انجام واکنش های کوپل شدن