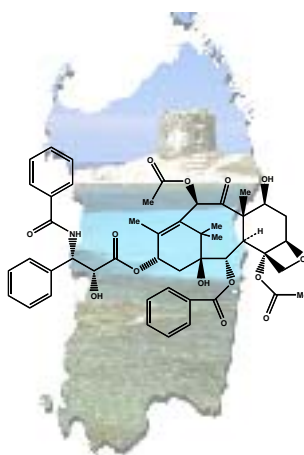




SardiniaChem2004

GIORNATA DI STUDIO DEDICATA ALLA CHIMICA ORGANICA
DELLE MOLECOLE BIOLOGICAMENTE ATTIVE

31 Maggio 2004, Aula Magna della Facoltà di Scienze - Sassari



COMITATO ORGANIZZATORE:

*Giampaolo Giacomelli, Univ. Sassari; Giovanna Delogu CNR Sassari;
Salvatore Cabiddu, Univ. Cagliari; PierPaolo Piras, Univ. Cagliari*

HANNO CONTRIBUITO ALLA REALIZZAZIONE DEL CONVEGNO:

*UNIVERSITA' di Sassari-Dipartimento di Chimica; CNR-Istituto di Chimica
Biomolecolare, sez. Sassari; UNIVERSITA' di Cagliari; AGILENT TECHNOLOGIES,
ITALIA, S.p.A. - Agenzia Sardegna; DEPECO s.r.l.; Apparecchiature Scientifiche;
DIAGEN s.a.s.; JASCO s.r.l.; SIGMA-ALDRICH s.r.l.*

**ALLILAZIONE, MEDIATA DA DIETILZINCO, DI BIFENILI DI ORIGINE
NATURALE MEDIANTE COMPLESSI Pd-ETENILCICLOPROPANI**

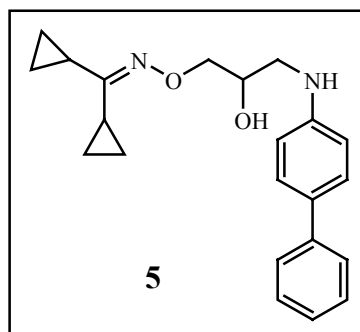
Dettoni, Maria Antonietta^a; Ollivier, Jean^b; Fabbri, Davide^a;

Delogu, Giovanna^a and Salaün, Jacques^b

^aCNR-Istituto di Chimica Biomolecolare, Sez. di Sassari, trav. La Crucca 3, 07040 Sassari.

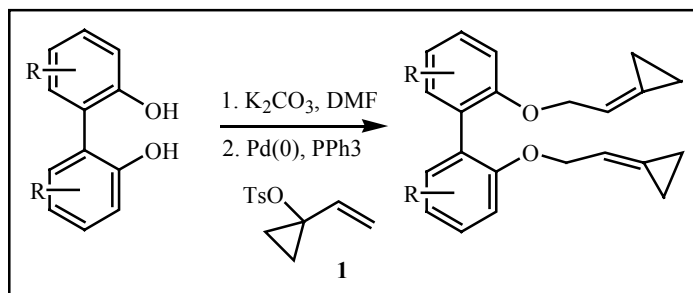
^bLaboratoire des Carbocycles, UMR 8615, Institut de Chimie Moléculaire et des Matériaux,
Bât. 420, Université de Paris-Sud, 91405 Orsay, France.

I composti bifenilici che presentano nella propria struttura piccoli carbocicli (es. ciclopropani, ciclobutani e ciclopentani) esplicano importanti attività biologiche. Grazie alle interessanti proprietà farmaceutiche ed agrochimiche dell'unità ciclopropanica e alle sue potenzialità come *building blocks* lo scheletro bifenil-ciclopropanico rappresenta un'interessante unità sintetica. Sebbene la letteratura riporti numerosi analoghi sintetici dell'unità bifenil-ciclopropanica utilizzati nella preparazione di inibitori della fosforodiesterasi (PDE-IV) e di agenti fungicidi, pur tuttavia, la più importante applicazione di tale struttura interessa la sintesi di nuovi recettori antagonisti molecolari (composto **5**)¹.

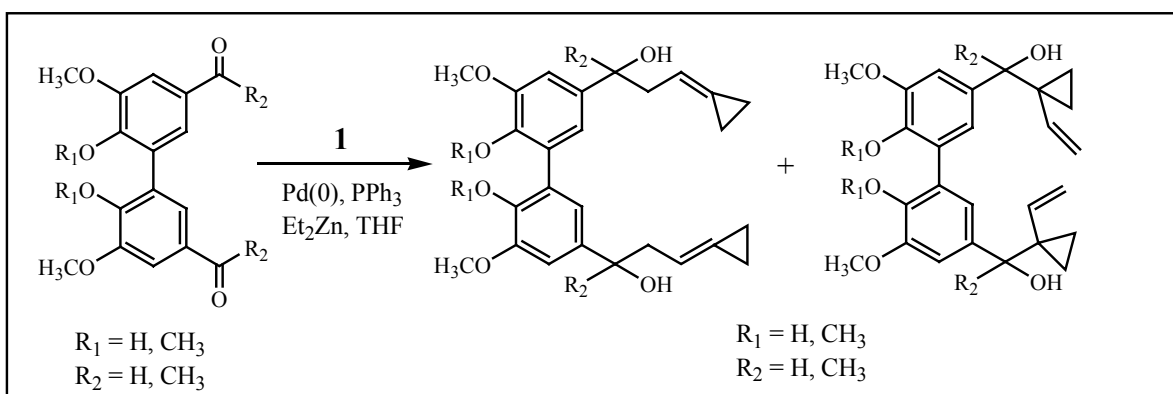


Recentemente ci siamo occupati, in collaborazione con il gruppo di ricerca francese, dell'allilazione Pd(0) catalizzata, di 2,2'-diidrossibifenili mediante etenilciclopropil solfonati (es. **1**) che permette la preparazione di 2,2'-bis(ciclopropilideneetossi)bifenili in buone rese (Schema 1)².

Schema 1



In questo contesto, al fine di sintetizzare una nuova classe di bifenili a simmetria C_2 legati ad opportune unità ciclopropaniche, sono stati preparati i derivati sostituiti alle posizioni 5,5' sia con il 3-ciclopropilidenepropan-1-olo e sia con il (1-etenilciclopropil)carbinolo. La reazione di sostituzione elettrofila γ e α , ad opera di carbonili di bifenili naturali derivati dalla vanillina e dall'acetovanillone, sull' 1-etenilciclopropil solfonato in presenza di Palladio(0) e dietilzinc,³ ha fornito i regioisomeri 5,5'-di(3-ciclopropilidene-1-idrossipropil)bifenile e 5,5'-di[1-(1-etenilciclopropil)-1-idrossi metil]bifenile (Schema 2)⁴.



Schema 2

Ricerca svolta nell'ambito dell'accordo bilaterale CNR-CNRS 2000-2003.

Bibliografia

1. a) Wright, S.W.; Harris, R.R.; Kerr, J.S.; Green, A.M.; Pinto, D.J.; Bruin, E.M.; Collins, R.J.; Dorow, R.L.; Montagna, L.R.; Sherk, S.R.; Covington, M.B.; Nurnberg, S.A.; Welch, P.K.; Nelson, M.J.; Magolda, R.L.; *J. Med. Chem.* 1992, 35, 4061-4068; b) Koppe, T.; Mederski, W.K.R.; Osswald, M.; Schwarz, M. *Tetrahedron Lett.* 1995, 36, 377-380.
2. Delogu, G.; Salaün, J.; de Candia, C.; Fabbri, D.; Piras, P.; Ollivier, J. *Synthesis* 2002, 2271.
3. Ollivier, J.; Girard, N.; Salaün, J. *Synlett* 1999, 1539.
4. Dettori, M.A.; Ollivier, J.; Piras, P.P.; Fabbri, D.; Delogu, G.; Salaün, J. *Lett. Org. Chem.*, 2004, submitted.