

6000/89

9755

53.671/PA

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

K I V O N A T

58712

Eljárás 2-oxabiciklo [2.2.1]heptán-származékok és a vegyü-
leteket tartalmazó gyógyászati készítmények előállítására
SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT, BERLIN,

NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

A ~~nemzetközi~~ bejelentés napja: 1989. 09. 07.

Elsőbbsége: 1988. 09. 07. (P 38 30 878.9),

NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/DE89/00585

A nemzetközi közzététel száma: WO 90/02740

A találmány (I) általános képletű 2-oxabiciklo-
[2.2.1]heptán-származékokra, azok enantiomerjeire, sóira,
ciklodextrinnal alkotott komplexeire és liposzómákkal kap-
szulázott formájára vonatkozik.

Az (I) általános képletben

A $-(CH_2)_n-$, (E)- vagy (Z)- $CH=CH-$ vagy $-C\equiv C-$ csoport
vagy oxigén- vagy kénatom;

~~n~~ értéke 0-7,

B hidrogénatom, ~~1-10 szénatomos~~ alkilcsoport, $-OR^2$,
 $-COOR^3$ általános képletű csoport, halogénatom,
cianocsoport, azidocsoport, ~~(a), (b), (c), (d), (e),~~
~~(f) vagy (g) általános képletű csoport, 5- vagy 6-~~
~~tagu~~ heterogyűrűs csoport, amely legalább egy
nitrogén-, oxigén- vagy kénatomot tartalmaz;
 R^1 oxogénatom, közvetlen kötés vagy metilén-csoport;

- R^2 ~~hidrogénatom, 1-10 szénatomos~~ alkilcsoport, X csoporttal helyettesített ~~6-12 szénatomos~~ arilcsoport vagy X csoporttal helyettesített ~~7-16 szénatomos~~ aralkilcsoport;
- R^3 ~~hidrogénatom, 1-10 szénatomos~~ alkilcsoport, ~~5-6 szénatomos~~ cikloalkilcsoport, ~~6-12 szénatomos~~ arilcsoport vagy ~~7-16 szénatomos~~ aralkilcsoport;
- X ~~hidrogénatom, 1-5 szénatomos~~ alkilcsoport, halogénatom, cianocsoport, azidocsoport, nitrocsoport, trifluor-metil-csoport, ~~(t)~~, $-OR^2$ vagy $-COOR^3$ általános képletű csoport;
- R^4 ~~oxazolidin-2-yl~~ vagy ~~(w)~~ ~~képletű~~ csoport, $-COOR^5$ általános képletű csoport, amelyben R^5 hidrogénatom, adott esetben halogénatommal, fenilcsoporttal, ~~1-4 szénatomos~~ alkoxycsoporttal vagy di~~1-4 szénatomos~~ alkil-amino-csoporttal helyettesített ~~1-10 szénatomos~~ alkilcsoport, ~~5-6 szénatomos~~ cikloalkilcsoport, ~~7-16 szénatomos~~ aralkilcsoport, X-csoporttal helyettesített fenilcsoport vagy ~~6-12 szénatomos~~ arilcsoport vagy ~~5-6-tagú~~ heterogyűrűs csoport, amely legalább egy nitrogén-, oxigén- vagy kénatomot tartalmaz, vagy $-CONHR^6$ általános képletű csoport, amelyben R^6 hidrogénatom, ~~1-10 szénatomos~~ alkanoilcsoport, ~~1-10 szénatomos~~ alkánszulfonilcsoport vagy $-CONR^2R^3$ vagy ~~(w)~~ általános képletű csoport, amelyben r értéke 2 vagy 3, vagy morfolino-karbonil-csoport;

Z $-(CH_2)_p-$ vagy $-CH=CR^7-$ általános képletű csoport, amelyben p értéke 0-5, (E)- $CH=CH-$ vagy $-C\equiv C-$ csoport;

W közvetlen kötés, $-O-CO-$, $NH-CO-$, $\begin{array}{c} \diagup C - O \diagdown \\ || \\ NH \end{array}$ képletű csoport, szabad vagy funkcionálisan átalakított

$\begin{array}{c} CH_3 \\ | \\ C- \\ | \\ OH \end{array}$ csoport, amelyben a hidroxicsoporth alfa- vagy

béta-állásu lehet;

D közvetlen kötés, ~~(x)~~ vagy $-NR^2-$ általános képletű csoport, ~~(y)~~ képletű vagy $-NH-SO_2-$ csoport,

~~4-5 szénatomos egyenes szénláncu telített alkilén-~~
~~csoport, elágazó láncu telített vagy egyenes vagy~~
~~elágazó szénláncu 2-5 szénatomos telítetlen alkil-~~
~~lénecsoporth, amely adott esetben fluoratómmal helyet-~~
~~tesített; s értéke 2-4,~~

E közvetlen kémiai kötés, $-C\equiv C-$ csoport vagy $-CH=CR^7-$ általános képletű csoport, amelyben

R^7 hidrogénatom, ~~1-5 szénatomos alkilcsoport~~, ha-
logénatom vagy trifluor-metil-csoport;

R^8 hidrogénatom, ~~1-10 szénatomos alkilcsoport~~, ~~3-10~~
~~szénatomos cikloalkilcsoport~~, adott esetben X-cso-
porttal helyettesített ~~7-16 szénatomos aralkilcso-~~
port, adott esetben X-csoporttal helyettesített ~~6-12~~
~~szénatomos arilcsoport~~ vagy ~~5- vagy 6-tagu hetero-~~
gyűrűs csoport, amely legalább egy nitrogén-,
oxigén- vagy kénatomot tartalmaz, vagy, ha E közvet-

ext is
folytatók
szedni?

len kötést jelent, ~~1-8 szénatomos~~ alkoxicsoport, ~~(h), (i), (j), (k), (l), (m), (n), (o), (p), (q), (r), (s)~~, ~~-O-Si(B³)₃~~ vagy ~~-O-(CH₂)_s-L-(CH₂)_o-X~~ általános képletű csoport, morfolino-, pirrolidino-, piperidino- vagy imidazol-1-il-csoport; a képletekben -(X)_p jelentésében, amennyiben p értéke 2 vagy 3, X azonos vagy különböző lehet, o értéke 0-5, B¹ és B² azonos vagy különböző és a halogénatom kivételével jelentésük megegyezik B jelentésével,

a B³ csoportok azonosak vagy különbözőek, és ~~1-4 szénatomos~~ alkilcsoportot, fenilcsoportot, vagy ~~7-16 szénatomos~~ aralkilcsoportot jelentenek;

L oxigén- vagy kénatom.

A találmány szerinti vegyületek TXA₂-antagonisták, és vérnyomáscsökkentő, valamint hörgőtágító hatású gyógyszerati készítmények hatóanyagaiként alkalmazhatók.

6000/89

53.671/PA



A

KÖZZÉTÉTELI
PÉLDÁNY

58712

S.B.G. & K.
BUDAPESTI NEMZETKÖZI ÜGYVÉDI
ÉS SZABADALMI IRODA
1061 BUDAPEST, DALSZÍNHÁZ U. 10.
TELEFON: 183-3733

NS20

C
CO7D 307/93, ~~401/00~~, 405/00,
407/00, 413/00, 409/06.

~~CO7F 7/18~~

AG1K 31/34

Eljárás 2-oxabiciklo [2.2.1]heptán-származékok és a vegyü-
leteket tartalmazó gyógyászati készítmények előállítására

SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT, BERLIN,

NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

Feltalálók: KLAR Ulrich,

VORBRÜGGEN Helmut,

REHWINKEL Hartmut,

THIERAUCH Karl-Heinz,

STÜRZEBECHER Claus Steffen,

BERLIN, NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

A nemzetközi bejelentés napja: 1989. 09. 07.

Elsőbbsége: 1988. 09. 07. (P 38 30 878.9),

NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/DE89/00585

A nemzetközi közzététel száma: WO 90/02740

A találmány (I) általános képletű 2-oxabicyclo-
[2.2.1]heptán-származékokra - a képletben

- A $-(CH_2)_n-$, (E)- vagy (Z)- $CH=CH-$, $-C\equiv C-$ csoport
vagy oxigén- vagy kénatom,
- n értéke 0-7,
- B hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkilcsoport, $-OR^2$,
 $-COOR^3$ általános képletű csoport, halogénatom,
cianocsoport, azidocsoport, (a), (b), (c), (d),
(e), (f) vagy (g) általános képletű csoport,
1-5 szénatomos egyenes szénláncu telített alkilén-
csoport, elágazó láncu telített vagy egyenes vagy
elágazó szénláncu 2-5 szénatomos telítetlen alki-
lencsoport, amely adott esetben fluoratommal he-
lyettesített,
s 2-4,
- E közvetlen kémiai kötés, $-C\equiv C-$ csoport vagy
 $-CH=CR^7-$ általános képletű csoport, amelyben
 R^7 hidrogénatom, 1-5 szénatomos alkilcsoport,
halogénatom vagy trifluor-metil-csoport,
- R^8 hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkilcsoport, 3-10
szénatomos cikloalkilcsoport, adott esetben X cso-
porttal helyettesített 7-16 szénatomos aralkilcso-
port, adott esetben X csoporttal helyettesített
6-12 szénatomos arilcsoport vagy 5- vagy 6-tagu
heterogyűrűs csoport, amely legalább egy nitrogén-,
oxigén- vagy kénatomot tartalmaz, vagy, ha E köz-
vetlen kötést jelent, 1-8 szénatomos alkoxics csoport,

(h), (i), (j), (k), (l), (m), (n), (o), (p), (q), (r), (s), $-O-Si(B^3)_3$ vagy $-O-(CH_2)_3-L-(CH_2)_o-X$ általános képletű csoport, morfolino-, pirrolidino-, piperidino- vagy imidazol-1-il-csoport, a képletekben $-(X)_p$ jelentésében, amennyiben p értéke 2 vagy 3, X azonos vagy különböző lehet,

o értéke 0-5;

5- vagy 6-tagu heterogyűrűs csoport, amelyben legalább egy nitrogén-, oxigén- vagy kénatomot tartalmaz,

R^1 oxigénatom, közvetlen kötés vagy metiléncsoport,
 R^2 hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkilcsoport, X csoporttal helyettesített 6-12 szénatomos arilcsoport vagy X csoporttal helyettesített 7-16 szénatomos aralkilcsoport,

R^3 hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkilcsoport, 5-6 szénatomos cikloalkilcsoport, 6-12 szénatomos arilcsoport vagy 7-16 szénatomos aralkilcsoport,

X hidrogénatom, 1-5 szénatomos alkilcsoport, halogénatom, cianocsoport, azidocsoport, nitrocsoport, trifluor-metil-csoport, (t), $-OR^2$ vagy $-COOR^3$ általános képletű csoport,

R^4 (u) vagy (v) képletű csoport, $-COOR^5$ általános képletű csoport, amelyben R^5 hidrogénatom, adott esetben halogénatommal, fenilcsoporttal, 1-4 szénatomos alkoxycsoporttal vagy di(1-4 szénatomos)alkil-amino-csoporttal helyettesített 1-10 szénatomos

- alkilcsoport, 5-6 szénatomos cikloalkilcsoport, 7-16 szénatomos aralkilcsoport, X csoporttal helyettesített fenacilcsoport vagy 6-12 szénatomos arilcsoport vagy 5-6-tagu heterogyűrűs csoport, amely legalább egy nitrogén-, oxigén- vagy kénatomot tartalmaz, vagy $-\text{CONHR}^6$ általános képletű csoport, amelyben R^6 hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkanoilcsoport, 1-10 szénatomos alkánszulfonilcsoport vagy $-\text{CONR}^2\text{R}^3$ vagy (w) általános képletű csoport, vagy morfolino-karbonil-csoport, t értéke 2 vagy 3,
- Z $-(\text{CH}_2)_p-$ vagy $-\text{CH}=\text{CR}^7-$ általános képletű csoport, (E) $-\text{CH}=\text{CH}-$ vagy $-\text{C}\equiv\text{C}-$ csoport, p értéke 0-5,
- W közvetlen kötés, $-\text{O}-\text{CO}-$, $-\text{NH}-\text{CO}-$ képletű csoport, szabad vagy funkcionálisan átalakított hidroximetilén-csoport, vagy szabad vagy funkcionálisan
- $$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ | \\ \text{C} \\ | \\ \text{OH} \end{array}$$
- átalakított $-\text{C}-$ csoport, amelyben a hidroxicsoporthoz alfa- vagy béta-állásu lehet,
- D közvetlen kötés, (x) vagy $-\text{NR}^2-$ általános képletű csoport, (y) képletű csoport, vagy $-\text{NH}-\text{SO}_2-$ csoport,
- B^1 és B^2 azonos vagy különböző és a halogénatom kivételével jelentésük megegyezik B jelentésével,

a B^3 csoportok azonosak vagy különbözőek, és 1-4 szénatomos alkilcsoportot, fenilcsoportot vagy 7-16 szénatomos aralkilcsoportot jelentenek,

L oxigén- vagy kénatom, és amennyiben R^5 hidrogénatomot jelent, a vegyületek fiziológiásan elviselhető bázisokkal alkotott sóira, alfa-, béta- vagy gamma-ciklodextrinnel alkotott komplexeire, valamint liposzómákkal kapszulázott (I) általános képletű vegyületekre vonatkozik.

Az 5- vagy 6-tagu heterogyűrűs csoport meghatározás olyan heterogyűrűs csoportokat jelent, amelyek legalább egy heteroatomot, előnyösen nitrogénatomot, oxigénatomot vagy kénatomot tartalmaznak, és mono- vagy biciklusosak. Példaként a 2-furil-, 3-furil-, 2-tienil-, 3-tienil-, 2-piridil-, 3-piridil-, 4-piridil-, kinolil- vagy izokinolil-csoportot említhetjük.

R^2 , R^3 , R^5 , R^8 és B jelentésében alkilcsoportként az egyenes vagy elágazó szénláncu 1-10 szénatomos alkilcsoportok jönnek számításba, ilyenek például a metil-, etil-, propil-, izopropil-, butil-, izobutil-, terc-butil-, pentil-, izopentil-, neopentil-, heptil-, hexil- vagy decilcsoport.

Az alkilcsoportok R^2 , R^3 , R^5 , R^8 és B jelentésében halogénatommal, hidroxicssoporttal, 1-4 szénatomos alkoxicssoportokkal, 6-12 szénatomos arilcsoportokkal, amelyek halogénatommal lehetnek helyettesítve, di(1-4 szénatomos)alkil-amino- és tri(1-4 szénatomos)alkil-ammónium-csoportokkal

lehetnek helyettesítve. Előnyösek az egyszeresen helyettesített alkilcsoportok.

A helyettesítők közül példaként a fluor-, klór- vagy brómatomot, a fenil-, dimetil-amino-, dietil-amino-, metoxi- és etoxicsoportot említjük.

R^2 , R^3 , R^5 , R^8 és B jelentésében előnyös alkilcsoportok az 1-4 szénatomosak, így például a metil-, etil-, propil-, izobutil- és butilcsoport.

R^7 jelentésében az alkilcsoport 1-5 szénatomos, egyenes vagy elágazó szénláncu, mint amilyeneket már R^2 jelentéseként megemlítettünk.

R^7 jelentéseként előnyös alkilcsoport a metil- és etilcsoport.

6-12 szénatomos arilcsoportként R^2 , R^3 , R^5 és R^8 jelentésében például a következő csoportok jönnek szóba: fenilcsoport, difenilcsoport, 1-naftil- és 2-naftil-csoport, amelyek 1-3 halogénatommal, egy fenilcsoporttal, 1-3,

1-4 szénatomos alkilcsoporttal, klór-metil-, fluor-metil-, trifluor-metil-, karboxil-, 1-4 szénatomos alkoxi- vagy hidroxicsoporttal lehetnek helyettesítve. A fenilcsoport előnyösen 3- és 4-helyzetében, például fluor- vagy klóratommal, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal vagy trifluor-metil-csoporttal, vagy 4-helyzetben hidroxicsoporttal helyettesített.

A cikloalkilcsoportok R^3 és R^5 jelentéseként 5 vagy 6 szénatomosak. A gyűrűk 1-4 szénatomos alkilcsoportokkal lehetnek helyettesítve. Ilyen például a ciklopentil-, ciklo-

hexil- vagy metil-ciklohexil-csoport.

R^8 jelentéseként a cikloalkilcsoport a gyűrűben 3-10, előnyösen 3-6 szénatomot tartalmazhat. A gyűrűk 1-4 szénatomos alkilcsoportokkal lehetnek helyettesítve. Példaként a ciklopropil-, ciklobutil-, ciklopentil-, ciklohexil-, metil-ciklopentil- és metil-ciklohexil-csoportot említhetjük.

R^2 , R^3 , R^4 és B^3 jelentésében a 7-16 szénatomos aralkilcsoport olyan előzőleg már említett 1-4 szénatomos alkilcsoportot képvisel, amely egy fenilhelyettesítővel helyettesített, például benzil- vagy fenetilcsoport, és ezek a csoportok 1-3 halogénatommal, fluor-metil- vagy trifluor-metil-csoporttal szintén helyettesítettek lehetnek.

A meghatározásokban említett 1-4 illetve 1-5 illetve 1-8 szénatomos alkilcsoportok egyenes vagy elágazólan-
cuak lehetnek, mint ahogy arra már az alkilcsoportokkal kapcsolatban is utaltunk.

D jelentésében az alkilén-csoport egyenes vagy elágazó szénláncu, telített vagy telítetlen alkilén-csoport lehet, előnyös a telített, legfeljebb 5 szénatomos csoport, amely adott esetben fluoratómmal helyettesített lehet. Példaként a metilén-, fluor-metilén-, etilén-, 1,2-propilén-, etil-etilén-, trimetilén-, tetrametilén-, pentametilén-, 1-metil-tetrametilén- és 1-metil-trimetilén-csoportokat említjük.

A hidroxics csoportok W jelentésében funkcionálisan átalakított formában, így éterezett vagy észterezett formá-

ban is jelen lehetnek, a szabad vagy átalakított hidroxicsoport alfa- vagy béta-állásu, előnyösek a szabad hidroxicsoportok.

Éter- és acilcsoportokként a szakember számára ismert csoportok jönnek szóba. Előnyösek a könnyen lehasítható étercsoportok, így például a tetrahidropiranyl-, tetrahidrofuranil-, vagy tribenzil-ezilil-csoport. Acilcsoportként például az acetil-, propionil-, butiril- vagy benzoilcsoportot említhetjük.

A halogénatom B, X és R^5 jelentésében fluor-, klór- és brómatomot képvisel.

R^6 jelentésében az 1-10 szénatomos alkanoilcsoport vagy 1-10 szénatomos alkánszulfonilcsoport megfelel a már említett azonos hosszúságú alkilcsoportoknak, azzal az eltéréssel, hogy ezek egy karboxicsoporthoz vagy szulfocsoport-hoz kapcsolódnak. Előnyösek az 1-4 szénatomos alkanoil- illetve alkánszulfonilcsoportok.

Az R^5 helyén hidrogénatomot tartalmazó szabad savakkal sóképzésre azok a szervetlen és szerves bázisok alkalmasak, amelyekről a szakember tudja, hogy fiziológiásan elviselhető sókat képeznek. Ilyenek az alkálifém-hidroxidok, például a nátrium- és kálium-hidroxid, az alkáliföldfém-hidroxidok, például a kalcium-hidroxid, ammónia, aminok, például az etanolamin, dietanol-amin, trietanol-amin, N-metil-glükamin, morfolin, trisz(hidroxi-metil)-metil-amin és hasonlóak.

Előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyekben

- A $-(CH_2)_n-$ általános képletű csoport, ebben n értéke 0-2, vagy $-C\equiv C-$ csoport,
- B hidrogénatom ($n = 1-2$ esetén), 1-4 szénatomos alkilcsoport, fenilcsoport, p-halogén-fenil-, különösen p-fluor-fenil-csoport, difenil-csoport,
- Z $-(CH_2)_p-$ általános képletű csoport, ebben $p = 0-2$, (E)- $CH=CH-$, $-C\equiv C-$ csoport vagy $-CH=CR^7$ általános képletű csoport,
- W közvetlen kötés vagy $-CH(OH)-$, $-O-CO-$ vagy $-NH-CO-$ csoport,
- D közvetlen kötés vagy egyenes szénláncu vagy 1-2 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített 1-3 szénatomos alkilén-csoport, $-N(R^2)-$ általános képletű vagy $-NH-SO_2-$ képletű csoport,
- E közvetlen kötés vagy $-C\equiv C-$ csoport,
- R⁸ hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, 5-6 szénatomos cikloalkilcsoport, 1-7 szénatomos alkoxi-csoport, adott esetben p számú halogén-, különösen fluoratómmal, cianocsoporttal, hidroxicssoporttal, trifluor-metil- vagy fenilcsoporttal helyettesített benzil-oxi-csoport, adott esetben p' számú halogén-, előnyösen fluoratómmal, cianocsoporttal, hidroxicssoporttal vagy fenilcsoporttal helyettesített anilinocsoport, adott esetben p számú halogén-,

előnyösen fluoratommal, cianocsoporttal, hidroxicssoporttal vagy fenilcsoporttal helyettesített 5- vagy 6-tagu heterogyűrűs csoport, amely egy vagy 2 heteroatomot, így nitrogén- vagy oxigénatomot tartalmaz és mono- vagy biciklusos lehet, mint azt már R^8 jelentésében egyenként megemlítettük, ilyenek például a morfolino-, pirrolidino-, piperidino-, imidazol-1-il-, (j), (k), (m), (n), (p), (q), (r) vagy (s) általános képletű csoport, amelyekben az $-(X)_p$ képletekben, amennyiben p jelentése 2 vagy 3, X azonos vagy különböző lehet,

o értéke 0-5,

p értéke 0-5,

p' értéke 1-5,

X halogénatom, különösen fluoratom, cianocsoport, hidroxicssoport, trifluor-metil-csoport vagy fenilcsoport,

B^1 és B^2 azonos vagy különböző, és hidrogénatom, p számú X csoporttal helyettesített fenilcsoport vagy ciklopentil- vagy ciklohexilcsoport,

R^1 metilén-csoport és

R^4 $-COOR^5$ általános képletű csoport, amelyben R^5 hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport, vagy adott esetben halogénatommal (fluoratommal) helyettesített 7-8 szénatomos aralkilcsoport vagy (w) általános képletű csoport, amelyben t értéke 2 vagy 3.

Az A, n, B, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , X, p, R^5 , R^6 , t, Z, R^7 , W, D, s, E, o, B^1 , B^2 , B^3 és L jelentésének a példákban szereplő kombinációi különösen előnyösek.

A találmány szerinti (I) általános képletű vegyületeket a következőkben ismertetett módon állíthatjuk elő:

A) Egy (II) és egy (III) általános képletű vegyületet reagáltatunk

/[A] reakcióvázlat, a képletekben

A, B, Z és R^1 jelentése a fenti,

Hal bróm- vagy klóratom,

W, D, E közvetlen kötés, ha

R^8 adott esetben halogénatommal, trifluor-metil-csoporttal, nitrocsoporttal, cianocsoporttal vagy fenilcsoporttal helyettesített benzil-, fenil-, benzil-oxi-, 2-fenil-oxi-etoxi- vagy naftil-metil-oxi-csoport,

Z' $-(CH_2)_p$ - általános képletű csoport, amelyben p értéke 1, vagy

R^9 adott esetben halogénatommal, trifluor-metil-csoporttal, nitrocsoporttal, cianocsoporttal vagy fenilcsoporttal helyettesített benzil-, fenil-, 2-fenil-oxi-etil- vagy naftil-metil-csoport,

D és E közvetlen kötés, ha Z' $-(CH_2)_p$ - általános képletű csoport, amelyben p értéke 0, R^8 (n) általános képletű csoport, amelyben o értéke 1-5, és p' értéke 0-5, és W hidroximetilén-csoportot jelent,

D és E közvetlen kötés, ha Z' $-CH=CH-$ csoport, R^8 1-10

- szénatomos alkilcsoport vagy 7-16 szénatomos aralkilcsoport és W hidroximetilén-csoport,
- D egyenes vagy elágazó szénláncu 2-5 szénatomos telített alkilcsoport,
- E $-C\equiv C-$ csoport, ha Z' $-CH=CH-$ vagy $-CH=CH-$ csoport,
- R^8 1-10 szénatomos alkilcsoport,
- R^4 $-COOR^5$ általános képletű észtercsoport./
- B) Egy (II) általános képletű vegyületet oxidálunk, a keletkezett (IV) általános képletű vegyületet egy (V) általános képletű vegyülettel reagáltatjuk, majd az így kapott (VI) általános képletű vegyületet redukáljuk.
- /[B] reakcióvázlat, a képletekben
- A, B, Z és R^1 jelentése a fenti,
- D adott esetben alkilcsoporttal helyettesített alkilcsoport,
- E közvetlen kötés, $-C\equiv C-$ csoport vagy adott esetben helyettesített fenoxicssoport,
- R^8 hidrogénatom vagy alkilcsoport,
- R^4 $-COOR^5$ általános képletű észtercsoport,
- R^{11} hidrogénatom vagy brómatom,
- Z'' (E)- $CH=CH-$ vagy $-C\equiv C-$ csoport,
- W hidroximetilén-csoport./
- C) Egy (II) általános képletű vegyületet a B) eljárás szerint (IV) általános képletű vegyületté oxidálunk, majd egy H_2N-R^{10} általános képletű aminnal reagáltatunk.

/ [C] reakcióvázlat, a képletekben

A, B, Z és R^1 jelentése a fenti,

Z' $-(CH_2)_p-$ általános képletű csoport, amelyben p értéke 0,

W, D és E közvetlen kötés,

R^8 $-CH=N-O-CH(C_6H_5)_2$ vagy $-CH=N-NH-CO-NH-$ fenil-csoport,

R^4 $-COOR^5$ általános képletű észtercsoport és

R^{10} $-O-CH(B^1)B^2$ általános képletű vagy $-NH-CO-NH-$ fenil csoport, és B^1 és B^2 azonos vagy különböző és hidrogénatomot, p számú X csoporttal helyettesített fenilcsoportot vagy ciklopentil- vagy ciklohexilcsoportot jelent./

D) Egy (II) általános képletű alkoholt halogénezünk, majd a kapott (VII) általános képletű vegyületet egy $H-R^8$ általános képletű vegyülettel reagáltatjuk.

/ [D] reakcióvázlat, a képletekben

A, B, Z, R^1 és X jelentése a fenti,

Z'' $-(CH_2)_p-$ általános képletű csoport, amelyben p értéke 1,

W, D, E közvetlen kötés,

R imidazol-1-il-, pirrolidino-, piperidino-, morfolinocsoport, X csoporttal egyszerűen helyettesített anilino- vagy fenoxi-csoport,

R^4 $-COOR^5$ általános képletű észtercsoport./

- E) Egy (II) általános képletű alkoholt a D) eljárás szerint (VII) általános képletű vegyületté alakítunk, majd egy $H-R^8$ általános képletű vegyülettel reagáltatunk.

/[E] reakcióvázlat, a képletekben

A, B, R^1 , Z, Z'', W, D, E és R^8 jelentése a D) eljárásnál megadott, és

R^4 (w) általános képletű csoport, amelyben t értéke 2 vagy 3./

- F) Egy (II) általános képletű alkoholt (VIII) általános képletű aminná alakítunk, majd az amint egy $Hal-W-D-E-R^8$ általános képletű vegyülettel reagáltatjuk.

/[F] reakcióvázlat, a képletekben

Hal klór- vagy brómatom,

W közvetlen kötés vagy $-CO-$ csoport,

D közvetlen kötés vagy $-SO_2-$ csoport,

E közvetlen kötés,

R^8 az (I) általános képletnél megadott,

A, B, Z, R^1 és R^4 jelentése a fenti,

Z' $-(CH_2)_p-$ általános képletű csoport, amelyben p értéke 0,

W közvetlen kötés vagy $-NH-CO-$ képletű csoport,

D közvetlen kötés vagy $-NH-SO_2-$ csoport,

E közvetlen kötés és

R^8 1-10 szénatomos alkilcsoport, 7-16 szénatomos aralkilcsoport, cikloalkilcsoport vagy arilcso-

port, mint ahogy azt a leírás elején megadtuk, vagy adott esetben 1-5 X csoporttal helyettesített aromás, karbociklusos vagy heterociklusos, mono- vagy biciklusos csoport, mint ahogy azt a fentiekben már megneveztük./

A (II) általános képletű kiindulási vegyületeket az 1a)-11) példákban vagy az utánuk következő, például a 274a)-274m), 276a)-276u) és 327a) példákban megadott előírások szerint állíthatjuk elő. A (II) általános képletű kiindulási vegyületek előállításának közbeni termékei a (IX) általános képletű laktolok, valamint enantiomerjeik, amelyekben A és B jelentése a fenti és a THP tetrahidropiranilcsoport, a TBDPS terc-butil-difenil-szilil-csoport, a 274m) példában megadott utmutatás szerint, a 17a)-17g) és 1f)-11) példák analógiájára enantiomer Corey-laktonból állíthatók elő. A (IX) általános képletű laktolok aztán a 274m) és következő, 274l)-274. példák szerint, valamint a 276f) és következő, 276e)-276. példa szerint alakíthatók (II) általános képletű vegyületekké.

A -COOR^5 általános képletű észter elszappanosítása például alkálifém- vagy alkáliföldfém-karbonáttal vagy -hidroxiddal alkoholban vagy valamely alkohol vizes oldatában történhet. Alkoholként az alifás alkoholok, például a metanol, etanol, butanol és hasonló, előnyösen a metanol jöhet szóba. Az alkálifém-karbonátok és -hidroxidok közül például a kálium- és nátriumsókat említhetjük, azonban a káliumsók az előnyösek.

Az egyes eljárási lépések reakciókörülményeit a következőkben adjuk meg:

1. (II) $\longrightarrow$ (I) /A) eljárás/

A (II) általános képletű vegyületet vizes alkálifém- vagy alkáliföldfém-hidroxid-oldat jelenlétében, fázistranszfer katalizátorok, például tetrabutil-ammónium-hidrogén-foszfát vagy -szulfát alkalmazásával reagáltatjuk a (III) általános képletű vegyülettel, mint szerves fázissal, vagy a (III) általános képletű vegyület valamely közömbös, vízzel nem elegyedő szerves oldószerrel készült oldatával 20-100°C-on, 1-8 óra hosszát.

2. (II) $\longrightarrow$ (IV) /B) eljárás/

A (II) általános képletű vegyületet ismert módon, például Swern vagy Collins szerint vagy piridinium-dikromáttal illetve -klór-kromáttal oxidáljuk oldószerben, például metilén-kloridban, dietil-éterben, tetrahidrofuranban, benzolban vagy toluolban -80 és -50°C közötti hőmérsékleten (Swern) illetve +30°C-on (az egyéb oxidációs eljárások esetében), 10 perc és 24 óra közötti, előnyösen 30 perc és 2 óra közötti ideig.

(IV) $\longrightarrow$ (VI) /B) eljárás/, (VI) $\longrightarrow$ (I) /B) eljárás/

A (IV) általános képletű vegyület és az (V) általános képletű foszfonát reakcióját, valamint az utána következő redukciót és hidrogén-bromid eliminálását a 28 45 770 számú német szövetségi köztársaságbeli nyilvánosságra hozott szabadalmi bejelentésben ismertetett módon végezzük.

3. (IV) $\longrightarrow$ (I) /C) eljárás/

A (IV) általános képletű vegyületet a H_2N-R^{10} általános képletű vegyülettel, illetve annak hidrokloridjával alkoholos, előnyösen etanolos oldatban, katalitikus (ekvimoláris) mennyiségű szerves bázis, például piridin, DABCO, DBN, DBU, trietil-amin, DMAP és hasonlók jelenlétében, 20 és $100^{\circ}C$, előnyösen 40 és $60^{\circ}C$ közötti hőmérsékleten, 2-24, előnyösen 5-10 órán át reagáltatjuk.

4. (II) $\longrightarrow$ (VII) /D) eljárás/

A (II) $\longrightarrow$ (VII) reakcióban bromozószerként a tionil-bromid, CBr_4 illetve hexabrom-etán/trifenil-foszfin rendszer jön szóba, és a reakciót bázis, például piridin, kollidin vagy anilin jelenlétében végezzük 0 - és $80^{\circ}C$ közötti, előnyösen 20 és $50^{\circ}C$ közötti hőmérsékleten, 30 perctől 2 óráig terjedő ideig. Oldószerként közömbös szerves oldószereket, így például metilén-kloridot, dietil-étert vagy kloroformot alkalmazunk.

5. (VII) $\longrightarrow$ (I) /D) és E) eljárás/

A (VII) általános képletű bromid és a $H-R^8$ általános képletű vegyület reakcióját vagy a $H-R^8$ általános képletű vegyület feleslegében vagy közömbös szerves oldószer, például toluol hozzáadásával 60 és $120^{\circ}C$, előnyösen 80 és $100^{\circ}C$ közötti hőmérsékleten, 2-28, előnyösen 2-12 órán át végezzük. Amennyiben a $H-R^8$ általános képletű vegyület egy fenol, még deprotonálószer, például nátrium-hidridet, butil-

-lítiumot vagy nátrium-metanolátot és adott esetben rézsót is kell a rendszerhez adnunk.

6. (II) $\longrightarrow$ (VIII) /F) eljárás/

A (II) általános képletű vegyület oxidációját előnyösen Jones-reagenssel vagy piridinium-klór-kromáttal végezzük az említett reagensekkel való munkához szükséges reakciókörülmények között. Ezután a kapott vegyületet a szokásos módon tionil-kloriddal kloriddá alakítjuk, fázis-transzfer-katalizátor jelenlétében vizes nátrium-azid-oldattal reagáltatjuk, és a megfelelő példában leírtak szerint (VIII) általános képletű vegyületté alakítjuk.

7. (VIII) $\longrightarrow$ (I) /F) eljárás/

A (VIII) általános képletű vegyületet és a Hal-WDE-R⁸ általános képletű vegyületet az ilyen reakcióval kapcsolatban említett példában leírt módon reagáltatjuk.

A találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek sóját úgy állítjuk elő, hogy a savat közömbös oldószerben, így például metanolban vagy vízben vagy vizes oldószerben oldjuk, hozzáadjuk a sóképző komponenst, például a trisz(hidroxi-metil)-amino-metánt, és aztán az oldószert lepároljuk. A ciklodextrin-komplexet a WO 87/05294 számú nemzetközi szabadalmi bejelentésben ismertetett eljárással állítjuk elő.

Liposzómákat a "Pharmazie in unserer Zeit 11, 98 (1982) irodalmi helyen közölt eljárással kapunk.

Az (I) általános képletű vegyületek minden sztereoizomer alakja a találmány tárgyát képezi.

Az új TXA2-antagonisták biológiai hatása és alkalmazási területe:

A jelen találmány szerinti vegyületek a kardiovaszkuláris rendszer, a gyomor, a hasnyálmirigy, a máj és vese megbetegedéseinek gyógykezelésére alkalmasak. Vérnyomáscsökkentő és hörgőtágító hatást fejtenek ki. A trombocita-aktiválás gátlására képesek. Ennek megfelelően az (I) általános képletű új TXA2-antagonisták értékes gyógyszer-hatóanyagok. Ezen felül a hasonló hatásspektrumu megfelelő TXA2-antagonista vegyületekhez viszonyítva nagyobb specifitást és szelektivitást mutatnak (a hiányzó részleges agonizmus miatt), lényegesen hosszabb ideig hatnak és stabilabbak.

Az új TXA2-antagonisták az erre a vegyületcsoportra jellemző tulajdonságokat mutatják, így például csökkentik a perifériás artériák, a koszorúsér és a tüdő ereinek ellenállását, csökkentik a tüdőben a vérnyomást, csökkentik a szisztémás vérnyomást anélkül, hogy a pulzustérfogot és a koszorúséren áthaladó véráram csökkenne, javítják a vese és más perifériás szerv vérellátását, növelik az agyon áthaladó vér mennyiségét, gátolják a trombociták aktiválását és feloldják a trombusokat, gátolják a hörgőszűkületet, gátolják a gyomorsavkiválasztást, védik a szív, gyomor- és bélnyálkahártya, máj, hasnyálmirigy és vese sejtjeit és emellett még antiallergiás hatásuk is. Ezért az új TXA2-antagonisták elvileg alkalmasak a szélütés kezelésére, a szív ko-

szorúsérrel kapcsolatos megbetegedéseinek, így a koszorúsér-trombózis megelőzésére és gyógyítására, a szivinfarktus, perifériás artériák megbetegedéseinek kezelésére, más tromboemboliás megbetegedések és arterioszklerózis, a központi idegrendszer isémiás rohama és más, az agy vérellátással kapcsolatos zavarainak megelőzésére és gyógyítására, magas vérnyomás és olyan betegségek, amelyek pulmonális érellenállás megnövekedésével járnak, például a pulmonális magas vérnyomás kezelésére és sokkok és asztma gyógyítására. A vegyületek felhasználhatók továbbá a szülési fájdalmak gátlására és a terhességi toxikózis kezelésére.

Az új TXA₂-antagonisták ezen kívül alkalmazhatók az átültetés után szervfunkció javítására, például veseátültetés esetében, a kilökési reakció megakadályozására, heparin helyett adjuvánsként művesekezélnél és vérplazmakészítmények például vérlemezkészítmények konzerválásánál.

Az új tromboxánantagonisták antimetasztatikus hatásuk és antiproliferációs tulajdonságaik.

Az új TXA₂-antagonistákat kombinációban, például karbaciklinekkel, prosztaciklinekkel és analógjaikkal, 7-oxo-prosztaciklinekkel, prosztaglandinokkal és ezek származékai-val, és 6-keto-PGE₁-származékokkal, TXA₂-szintetáz-gátlókkal, foszfodiészteráz-gátlókkal, különböző trombocitastimulátorok (például ADP, trombin, kollagén, PAF, adrenalin, szerotonin, fibrinogén) antagonistáival és receptorantagonistáival, kalciumantagonistákkal, fibrinolitikumokkal és trombolitikumokkal, így t-PA-val, heparinnal és más antikoagulánsok-

kal, például acetil-szalicilsavval, lipoxigenáz-gátlókkal, valamint a lipoxigenáz-termékek antagonistáival, értágítókkal, így nitro-vegyületekkel, magas vérnyomás elleni szerekkel, például béta-blokkolókkal vagy diuretikumokkal együtt adagolhatók.

A vegyületek napi dózisa 0,1 és 500 mg között változik, amely embereknek több részletben is beadható. Az egységdózis a gyógyászatilag elfogadható hordozókra vonatkoztatva 0,1 és 100 mg közötti mennyiségű hatóanyagot tartalmaz. Parenterális adagolás esetén steril, injektálható vizes vagy olajos oldatokat alkalmazunk. Orális adagolás céljára például a tabletták, drazsék vagy kapszulák a megfelelőek.

A találmány ily módon kiterjed az (I) általános képletű vegyületeket és a szokásos segéd- és hordozóanyagokat tartalmazó gyógyászati készítményekre is.

A találmány szerinti hatóanyagok az ismert galenikus és egyéb segédanyagokkal együtt például vérnyomáscsökkentő készítmények előállítására szolgálnak.

Ampullák esetében az egységdózis tartomány 0,1 és 100 mg, tabletták esetében 0,1 és 100 mg között változik.

1. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Metil-6-(benzil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-(illetve benzil-)észter

16 mg (56,7 μ mól) 1a) példa szerint előállított alkoholhoz 160 μ l 50 %-os vizes kálium-hidroxid-oldatot,

100 μ l benzil-kloridot és 1,5 mg tetrabutil-ammónium-hidrogén-szulfátot adunk. A heterogén elegyet 60°C-ra melegítjük, és négy órán át hagyjuk reagálni a komponenseket. Az elegyet lehűtjük, több alkalommal, összesen 4 ml dietil-éterrel extraháljuk és analitikai vékonyréteg-lemezen kromatográfiásan tisztítjuk. A metilészternek a reakcióban szintén keletkezett benzil-észterből való elválasztásáról lemondunk. Az eluálást dietil-éterrel végezzük, így 18 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3020, 3000, 2960, 2940, 2870, 1735, 1455, 1125, 1020, 965, 895, 740 és 700 cm^{-1} .

1a) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Metil-6-(hidroximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

400 mg (768 μ mol) 1b) példában előállított bicyclusos vegyületet 4 ml vizmentes tetrahydrofuranban oldunk, 4,0 ml 1 mólos tetrahydrofurános tetrabutil-ammónium-fluorid-oldatot adunk hozzá, és a sárga homogén oldatot 1 órán át 23°C-on keverjük száraz argon atmoszférában. A reakcióelegyet ezután 20 ml jéghideg 10 %-os ammónium-klorid-oldatra öntjük, több alkalommal, összesen 25 ml dietil-éterrel extraháljuk, a szerves fázist vízzel mossuk és magnézium-szulfáton szárítjuk. Szűrés és vizsugárral létesített vákuumban való bepárlás után 432 mg nyers olajat kapunk, amelyet kb. 70 ml kovásvégelen acetone és n-hexán gradiens elegyével eluálva

kromatográfiásan tisztítunk. Ily módon 206 mg (730 μmol , 95 %) cím szerinti vegyületet különítünk el.

IR (film): 3200-3600, 2950, 2930, 2870, 1735, 1450, 1435, 1155, 1010, 960 és 890 cm^{-1} .

1b) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Metil-6-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

Az 1c) példában előállított diolból 598 mg-ot (1,11 mmol) 5 ml vízmentes toluolban oldunk, és a szintelen oldathoz egymást követően 780 mg trifenil-foszfint és 0,7 ml diazodikarbonsav-dietil-észtert adunk, és az elegyet 7 órán át 23°C-on, száraz argon atmoszférában keverjük. Ezután 15 ml dietil-étert adunk hozzá, a szerves fázist több alkalommal mossuk vízzel, majd magnézium-szulfáton szárítjuk. Szűrés és vizsugárral létesített vákuumban való bepárlás után a maradékot kovasavgélen kromatografáljuk, eluálószerként dietil-étert tartalmazó n-hexán gradiensrendszert használunk. Ily módon 403 mg (774 μmol , 70 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3050, 2950, 2930, 2860, 1735, 1590, 1425, 1110, 1015, 895, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

1c) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-(Hidroxi-metil)-1-metil-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-hidroxi-ciklopentán-2-il]-5-hepténsav-metil-észter

921 mg (1,48 mmol) 1d) példa szerint előállított vegyületet 25 ml vízmentes etil-alkoholban oldunk, a szintelen oldathoz 185 mg piridium-p-toluolszulfonátot adunk, és a homogén oldatot 3 órán át 55°C-on és száraz argon atmoszférában keverjük. 50 ml dietil-éterrel hígítjuk az elegyet, a kivált szilárd anyagot kiszűrjük, a szűrletet vizsugárral létesített vákuumban szárazra pároljuk és kovasavgélen kromatográfiásan tisztítjuk, eluálószerként acetont tartalmazó n-hexán grádiensrendszert használunk. Ily módon (1,14 mmol, 77 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3100-3600, 3070, 3050, 2940, 2855, 1735, 1590, 1425, 1110, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

1d) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-(Hidroxi-metil)-1-metil-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropirán-2-il-oxi)-ciklopentán-2-il]-5-hepténsav-metil-észter

11,7 ml hexametil-diszilazánt 40 ml vízmentes tetrahidrofuránban oldunk, és a szintelen oldatot száraz argon alatt 0-3°C-ra hűtjük, majd 42 ml 1,33 mólos n-hexános n-butyl-litium-oldatot adunk hozzá és 20 percig keverjük az elegyet. 5,52 g karboxi-butyl-trifenil-foszfónium-bromid

55 ml vízmentes tetrahidrofuránnal készült szuszpenziójához erőteljes keverés közben, a nedvesség kizárásával az előzőleg készített oldatból 40 ml-t adunk, és az elegyet szobahőmérsékleten 30 percig keverjük. Ezután 744 mg (1,42 mmól), az 1e) példában előállított poláros laktol 15 ml vízmentes tetrahidrofuránnal készült oldatát csepegtetjük hozzá, és még 2 órán át 35°C-on keverjük. A reakciót 200 ml jéghideg, 10 %-os ammónium-klorid-oldatra öntéssel állítjuk le, az elegyet 10 %-os citromsavval megsavanyítjuk és több alkalommal, összesen 300 ml dietil-éterrel extraháljuk. Az egyesített szerves extraktumokat vízzel és telített vizes nátrium-klorid-oldattal mossuk, magnézium-szulfáton szárítjuk, szűrjük és vizsugárral létesített vákuumban az oldószert lepároljuk. Így 3,5 g szintelen olajat kapunk, amelyhez 5 ml étert adunk, a kivált trifenil-foszfin-oxidot kiszűrjük és a szűrlethez 0°C-on éteres diazometán-oldatot adunk. Az elegyet ismét bepároljuk, és a 3,32 g nyers terméket kb. 300 ml finomszemcséjű kovasavgélen kromatografáljuk nyomás alatt, eluálószerként n-hexán és dietil-éter gradiens elegyét használjuk. Ily módon 848 mg (1,36 mmol, 96 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3200-3600, 3070, 3050, 2940, 2855, 1735, 1590, 1425, 1360, 1200, 1110, 870, 820, 740 és 705 cm⁻¹.

1e) példa

(1S,4RS,6R,7S,8R)-1-Metil-4-hidroxi-7-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-3-oxabicyclo[4.3.0]nonán (A) és

(1R,3RS,6R,7S,8R)-1-metil-3-hidroxi-7-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-4-oxabicyclo[4.3.0]nonán (B)

1,71 g (3,26 mmol) 1f) példa szerint előállított, kb. 1:1 arányu regioizomer laktonkeveréket 45 ml vízmentes metil-benzolban oldunk, és a szintelen oldatot száraz argon alatt -70°C -ra hűtjük, majd 6 ml 1 mólos toluolos diizobutil-alumínium-hidrid-oldatot adunk hozzá. A komponenseket 45 percig hagyjuk reagálni, majd a redukálószer feleslegét 3,3 ml izopropanol hozzáadásával elbontjuk. Az elegyet hagyjuk 0°C -ra melegedni, 3,0 ml vizet adunk hozzá, és addig keverjük, amíg finomszemcsés csapadék válik ki. A csapadékot kiszűrjük, diklór-metánnal mossuk, a szűrletből az oldószeret vákuumban eltávolítjuk, így 1,68 g (3,21 mmol, 98 %) terméket kapunk, amely az A és B cím szerinti vegyületek keveréke. Ezt az anyagot kb. 400 ml finomszemcséjű kovasavgélén nyomás alatt ismételten kromatografáljuk, eluálószerként dietil-éter és n-hexán gradienselegyét használjuk, így a regioizomer laktolkeveréket elválasztjuk:

nempoláros B vegyület: 930 mg (1,77 mmol, 54 %), szintelen olaj,

poláros A vegyület: 755 mg (1,44 mmol, 44 %), szintelen olaj.

IR (film): 3200-3600, 3070, 3045, 2940, 2860, 1590, 1425,
1110, 1020, 865, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

1f) példa

(1S,6R,7S,8R)-1-Metil-7-(terc-butyl-difenil-szilil-
-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-3-oxabicyclo [4.3.0]-
nonán-4-on és (1R,6R,7S,8R)-1-metil-7-(terc-butyl-difenil-
-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-4-oxabicyclo-
[4.3.0]nonán-3-on

1,8 g (3,55 mmól) 1g) példa szerinti bicyclusos
ketont 30 ml vízmentes diklór-metánban oldunk, és az oldat-
hoz 870 mg finoman porított nátrium-hidrogén-karbonátot,
majd 1,43 g m-klór-perbenzoesavat adunk, és az elegyet 6 órán
át szobahőmérsékleten, száraz argon alatt keverjük. Ezután
100 ml 10 %-os nátrium-tioszulfát-oldatot adunk hozzá, 15
perc eltelte után a szerves fázist elválasztjuk, 50 ml 1 n
nátrium-hidroxiddal, majd vízzel mossuk addig, amíg a mosó-
folyadék semleges nem lesz, végül magnézium-szulfáton szá-
ritjuk. Bepárlás után 1,9 g szintelen olajat kapunk, amit
nyomás alatt, kb. 400 ml finomszemcséjű kovasavgélen kroma-
tográfiásan tisztítunk, eluálószerként n-hexán és etil-ace-
tát 8:2 térfogatarányu elegyét használjuk. Ily módon 1,72 g
(3,28 mmol, 93 %) szintelen olajat kapunk, amely a cím sze-
rinti vegyületek 1:1 arányu keveréke.

IR (film): 3070, 3045, 2940, 2855, 1750, 1590, 1470, 1425,
1215, 1110, 1075, 1060, 1035, 975, 910, 870,
740 és 705 cm^{-1} .

1g) példa

(1R,5R,6S,7R)-1-Metil-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-7-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-biciklo [3.3.0]oktán-3-on

3,04 g (6,2 mmol) 1h) példa szerint előállított biciklusos telitetlen ketont 70 ml vizmentes tetrahidrofuránban oldunk és 104 mg réz(II)-acetátot adunk hozzá, száraz argon alatt -20°C -ra hűtjük az elegyet és rövid idő alatt 8,2 ml 3 mólos tetrahidrofurános metil-magnézium-bromid-oldatot csepegetetünk hozzá. A komponenseket hagyjuk -20 és 15°C közötti hőmérsékleten reagálni, majd az elegyet 300 ml jéghideg 10 %-os ammónium-klorid-oldatba öntjük, és több alkalommal, összesen 400 ml dietil-éterrel extraháljuk. Az egyesített szerves extraktumokat vízzel, majd telített vizes nátrium-klorid-oldattal semlegesre mossuk, és magnézium-szulfáton szárítjuk. Szűrés és vizesugárral létesített vákuumban való bepárlás után 3,34 g sárga olajat kapunk, amelyet kb. 400 ml finomszemcséjű kovasavgélen nyomás alatt, n-hexán és etil-acetát grádienselegyével eluálva kromatográfiásan tisztítunk. Ily módon 1,81 g (3,6 mmol, 58 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3045, 2970, 2930, 1740, 1590, 1425, 1110, 1075, 1020, 970, 870, 820, 790, 740 és 700 cm^{-1} .

1h) példa

(5R,6S,7R)-7-(Tetrahidropiran-2-il-oxi)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-biciklo [3.3.0]okt-1-én-3-on

8,79 g (17,2 mmol) 1i) példa szerint előállított ketosavat 200 ml vízmentes etil-acetátban oldunk és 7,14 g trifenil-(fenil-imino-vinilidén)-foszforánt adunk az oldathoz, majd száraz argon atmoszférában 3 órán át forraljuk. Lehűtés után az elegyet vizsugárral létesített vákuumban kb. 30 ml-re bepároljuk, 200 ml vízmentes toluolt és 5 ml vízmentes etanolt adunk hozzá és argon alatt további 20 órán át forraljuk. Lehűlés után vizsugárral létesített vákuumban az oldószert lepároljuk, és a visszamaradó barna olajat kb. 600 ml finomszemcséjű kovasavgélen nyomás alatt kromatografáljuk, eluálószerként n-hexán és etil-acetát gradienselegyet használjuk. Ily módon 4,81 g (9,8 mmól, 57 %) cím szerinti vegyületet kapunk halványsárga olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3045, 2940, 2850, 1775, 1705, 1630, 1470, 1425, 1110, 1075, 1030, 970, 915, 870, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

1i) példa

(2R,3S,4R)-2-(Karboxi-metil)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-ciklopentán-1-on

8,83 g (17,8 mmol) 1j) példa szerint előállított laktont 80 ml dietil-éterben oldunk és 80 ml 1 n nátrium-hidroxidot adunk az oldathoz, majd a kétfázisú rendszert szobahőmérsékleten erőteljesen keverjük. 24 óra eltelte után a vizes fázist elválasztjuk, 0-3°C-ra hűtjük és jéghideg telített citromsav-oldat adagolásával a pH-t 4-5-re állít-

juk. A kivált hidroxisavat több alkalommal, összesen 200 ml -5°C hőmérsékletű triklór-metánnal extraháljuk, az egyesített extraktumokat magnézium-szulfáton gyorsan átszűrjük, két alkalommal 20-20 ml -5°C hőmérsékletű triklór-metánnal utánaöblítjük, és a szűrlethez 150 ml -20°C hőmérsékletű acetont adunk. Az elegyet -30°C -ra hűtjük és 9,2 ml standardizált króm-kénsav-oldatot adunk hozzá, majd 4 órán át -30 és -20°C közötti hőmérsékleten keverjük. Az oxidálószer feleslegét 10 ml izopropanol hozzáadásával elbontjuk, hagyjuk az elegyet szobahőmérsékletre melegedni, és aztán 200 ml vízzel hígítjuk. A szerves fázist elválasztjuk, a vizes fázist több alkalommal, összesen 350 ml triklór-metánnal extraháljuk, és az egyesített extraktumokat vízzel, majd nátrium-klorid-oldattal mossuk, míg a mosófolyadék semleges nem lesz. Magnézium-szulfáton való szárítás és szűrés után az oldószert vákuumban lepároljuk, így 8,79 g (17,2 mmol, 96 %) cím szerinti vegyületet kapunk halványzöld olaj formájában, amelyet tisztítás nélkül reagáltatunk tovább.

IR (film): 2500-3600, 3070, 3040, 2940, 2860, 1745, 1710, 1590, 1428, 1110, 1075, 1035, 1020, 970, 870, 820, 758, 740 és 705 cm^{-1} .

1j) példa

(1S,5R,6S,7R)-7-(Tetrahidropiran-2-il-oxi)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [3.3.0]oktán-3-on

7,74 g (18,9 mmol) 1k) példa szerint előállított vegyület 110 ml vízmentes diklór-metánnal készült oldatához 95 mg p-toluolszulfonsavat és 3,1 ml dihidropiránt adunk. Az elegyet 1 órán át szobahőmérsékleten, száraz argon alatt keverjük, a tiszta ibolyaszínű oldathoz 20 ml 10 %-os nátrium-hidrogén-karbonát-oldatot adunk, a szerves fázist elválasztjuk, vízzel több alkalommal mossuk, majd magnézium-szulfáton szárítjuk. Szűrés és az oldószer vizsugárral létesített vákuumban való lepárlása után 12,4 g sárga olaj marad vissza, amelyet kb. 400 ml finomszemcséjű kovasavgélen nyomás alatt kromatográfiásan tisztítunk, eluálószerként n-hexán és etil-acetát grádienselegyet használjuk. Ily módon 8,86 g (17,9 mmol, 95 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3065, 3045, 2940, 2850, 1770, 1590, 1425, 1175, 1110, 1075, 1035, 1000, 970, 870, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

1k) példa

(1S,5R,6S,7R)-7-Hidroxi-6-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [3.3.0]oktán-3-on

93 g (181 mmol) 1l) példa szerint előállított vegyület 800 ml vízmentes metil-alkohollal készült szintelen oldatához 32,5 g finoman porított kálium-karbonátot adunk és az elegyet 5,5 órán át szobahőmérsékleten száraz argon alatt keverjük. Szűrés után a szűrletet vizsugárral létesített vákuumban kb. 200 ml-re bepároljuk, majd 600 ml vizet adunk

hozzá, az elegyet 1 n sósavval pH 3-4-re savanyítjuk és több alkalommal, összesen 1 liter diklór-metánnal extraháljuk. Az egyesített szerves extraktumokat vízzel, majd telített vizes nátrium-klorid-oldattal semlegesre mossuk, magnézium-szulfáton szárítjuk és az oldószert szűrés után vizsugárral létesített vákuumban lepároljuk. Az így kapott nyers terméket kb. 1,5 liter finomszemcséjű kovasavgélen kromatografáljuk, eluálószerként n-hexán és etil-acetát grádienselegyet használjuk. Ily módon 59 g (144 mmol, 80 %) cím szerinti vegyületet különítünk el kristályos szilárd anyag alakjában. IR (Kbr): 3440, 3070, 3040, 2955, 2930, 2855, 1740, 1590, 1470, 1425, 1390, 1370, 1200, 1110, 1045, 1030, 995, 900, 865, 820, 795, 740, 705 és 615 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23} = -6,2^{\circ}$ (c = 1, CHCl_3) Op. : 90-91°C.

11) példa

(1S,5R,6S,7R)-7-(Benzoil-oxi)-6-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [3.3.0]oktán-3-on

50 g (181 mmol) Corey-lakton 850 ml vízmentes dimetil-formamiddal készült szintelen oldatához 25 g imidazolt adunk, és 1 óra alatt 47,5 ml terc-butyl-difenil-klór-szilánt csepegtetünk hozzá, vízmentes dimetil-formamiddal utánaöblítjük, majd 2,5 órán át száraz argon atmoszférában szobahőmérsékleten hagyjuk a komponenseket reagálni. Ezután az elegyet 1 liter jeges vízre öntjük, a kivált gumiszerű nyers

terméket több alkalommal, összesen 1 liter dietil-éterrel extraháljuk. Az egyesített szerves extraktumokat vízzel és telített vizes nátrium-klorid-oldattal semlegesre mossuk, majd magnézium-szulfáton szárítjuk. Szűrés után az oldószert vizsugárral létesített vákuumban lepároljuk, a maradékot intenzíven szárítjuk, így 93 g (181 mmol, 100 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen, -20°C -on megdermedő olaj alakjában, amelyet tisztítás nélkül dolgozunk tovább.

IR (film): 3070, 3045, 2955, 2930, 2855, 1770, 1715, 1600, 1585, 1425, 1270, 1175, 1110, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

$[\alpha]_{\text{D}}^{23} = -52^{\circ}$ ($c = 1,0$, CHCl_3).

2. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Metil-6-(benzil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]heptán-3-il]-5-hepténsav

Az 1. példa szerint előállított észterelegyből 18 mg-ot 0,5 ml metanolban oldunk, 0,5 ml 5 %-os vizes lítium-hidroxid-oldatot adunk hozzá, és 4-6 órán át szobahőmérsékleten keverjük az elegyet. Ezután 1 n sósavval megsavanyítjuk és több alkalommal, összesen 30 ml kloroformmal extraháljuk, magnézium-szulfáton átszűrjük és analitikai vékonyréteglemezen kromatográfiásan tisztítjuk. Futtatóelegyként n-hexán és etil-acetát elegyét, eluálószerként kloroform és izopropanol elegyét használjuk. Ily módon 15 mg (41,8 μmol , az 1. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 74 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3000, 2950, 2930, 2870, 1730, 1710, 1455, 1125, 1100, 1020, 965, 885, 875, 740 és 700 cm^{-1} .

3. példa

(4S,5R(Z),6S,1R)-7-[4-Fenil-6-(benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil(illetve benzil-)észter

16 mg (46,5 μmol) 3a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtak szerint reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 19 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3090, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1735, 1605, 1500, 1455, 1075, 970, 895, 740 és 700 cm^{-1} .

3a) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Fenil-6-(hidroxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

460 mg (789 μmol) 3b) példa szerinti biciklusos vegyületet az 1a) példában leírtak szerint reagáltatunk, és a feldolgozás és tisztítás után 254 mg (737 μmol , 93 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-3400, 3080, 3060, 3030, 2940, 2870, 1735, 1600, 1495, 1445, 1435, 1200, 1150, 1070, 1035, 1000, 895, 760 és 700 cm^{-1} .

3b) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Fenil-6-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-hepténsav-metil-észter

570 mg (949 μ mol) 3c) példa szerint előállított diolt az 1b) példában leírtak szerint ciklizálunk, és a feldolgozás és tisztítás után 452 mg (776 μ mol, 82 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3050, 3020, 2950, 2930, 2855, 1735, 1600, 1590, 1425, 1110, 895, 820, 760, 740 és 700 cm^{-1} .

3c) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-Hidroxi-metil)-1-fenil-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-hidroxi-ciklopentán-2-il]-5-hepténsav-metil-észter

436 mg (662 μ mol) 3d) példa szerint előállított vegyületet az 1c) példában leírtak szerint reagáltatunk, és a feldolgozás és tisztítás után 359 mg (598 μ mol, 90 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3100-3600, 3070, 3050, 3000, 2950, 2930, 2855, 1735, 1600, 1590, 1425, 1110, 1055, 820, 740 és 700 cm^{-1} .

3d) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-Hidroxi-metil)-1-fenil-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(metoxi-etil-1-oxi)-ciklopentán-2-il]-5-hepténsav-metil-észter

716 mg (1,28 mmol) 3e) példa szerint előállított nempoláros laktolt az 1d) példában leírtak szerint reagáltatunk. Az észterezés és tisztítás után 705 mg (1,07 mmol, 84 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3200-3600, 3070, 3050, 2950, 2930, 2860, 1740, 1660, 1590, 1430, 1110, 820, 740, 700 és 505 cm^{-1} .

3e) példa

(1S,4RS,6R,7S,8R)-1-Fenil-4-hidroxi-7-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(metoxi-etil-1-oxi)-3-oxabicyclo-[4.3.0]nonán (A) és

(1S,3RS,6R,7S,8R)-1-fenil-3-hidroxi-7-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(metoxi-etil-1-oxi)-4-oxabicyclo-[4.3.0]nonán (B)

A 3f) példa szerint előállított regioizomer laktonok kb. 1:1 arányú keverékéből 1,43 g-ot (2,56 mmol) az 1e) példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk. A feldolgozás után 1,42 g (2,53 mmol, 99 %) terméket izolálunk, amely a cím szerinti A és B vegyületek elegye.

IR (film): 3200-3600, 3070, 3050, 3025, 2930, 2860, 1605, 1590, 1495, 1470, 1425, 1390, 1110, 1040, 990, 900, 825, 735 és 700 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 716 mg (1,28 mmol, 50 %) nempoláros A vegyületet és 692 mg (1,23 mmol, 48 %) poláros B vegyületet kapunk.

3f) példa

(1S,6R,7S,8R)-1-Fenil-7-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(metoxi-etil-1-oxi)-3-oxabicyclo [4.3.0]nonán-4-on és (1S,6R,7S,8R)-1-fenil-7-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(metoxi-etil-1-oxi)-4-oxabicyclo [4.3.0]nonán-3-on

1,59 g (2,93 mmol) 3 g) példa szerint előállított bicyklusos ketont az 1f) példában leírtaknak megfelelően oxidálunk, és a feldolgozás és tisztítás után 1,43 g (2,56 mmol, 87 %) kristályos szilárd anyagot különítünk el, amely a cím szerinti vegyületek kb. 1:1 arányu elegye. Op.: 113-114°C (n-hexán és diizopropil-éter elegyből).

3g) példa

(1S,5R,6S,7R)-1-Fenil-6-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-7-(metoxi-etil-1-oxi)-bicyclo [3.3.0]oktán-3-on

1,19 g (2,56 mmol) (5R,6S,7R)-7-(metoxi-etil-1-oxi)-6-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-bicyclo [3.3.0]okt-1-én-3-ont, amelyet (1S,5R,6S,7R)-7-hidroxi-6-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [3.3.0]oktán-3-onból az 1h), 1i) és 1j) példákban leírtaknak megfelelően, metil-vinil-éter felhasználásával állítottunk elő, az 1g) példa szerint fenil-magnézium-jodiddal reagáltatunk, rézkatalizátor jelenlétében. A feldolgozás és tisztítás után 995 mg (1,83 mmol, 72 %) cím szerinti vegyületet kapunk színtelen olajként.

IR (film): 3070, 3050, 2940, 2855, 1740, 1600, 1590, 1470,
1430, 1390, 1110, 995, 900, 825, 740 és 705 cm^{-1} .

4. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7- [4-Fenil-6-(benzil-oxi-metil)-
-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav

19 mg, a 3. példa szerint előállított észterele-
gyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk,
és feldolgozás és tisztítás ^{után} 16 mg (38 μmol , a 3. példa sze-
rinti kiindulási anyagra számítva 82 %) cím szerinti vegyü-
letet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2500, 3090, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870,
1730, 1710, 1605, 1500, 1455, 1210, 1120, 1075,
970, 900, 760, 740 és 700 cm^{-1} .

5. példa

(4R,5S(5Z),6R,1S)-7- [4-Fenil-6-(benzil-oxi-metil)-
-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-(illetve
benzil-)észter

19 mg (55 μmol) 5a) példa szerint előállított al-
koholt az 1. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk,
és a feldolgozás és tisztítás után 22 mg cím szerinti vegyü-
letet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3090, 3060, 3030, 2940, 2870, 1735, 1605, 1500,
1455, 1075, 970, 895, 740 és 700 cm^{-1} .

5a) példa

(4R,5S(5Z),6R,1S)-7-[4-Fenil-6-(hidroximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

2,81 g (10,2 mmol) Corey lakton enantiomert az 1a)-1l) példákban leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és 228 mg (662 μ mol, 6,5 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-3200, 3040, 3030, 3000, 2940, 2870, 1735, 1600, 1495, 1440, 1435, 1220, $\sqrt{1200}$, 1035, 1000, 895, 760 és 700 cm^{-1} .

6. példa

(4R,5S(5Z),6R,1S)-7-[4-Fenil-6-(benziloximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

22 mg 5. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és a feldolgozás és tisztítás után 20 mg (48 μ mol, az 5. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 86 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2300, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1730, 1705, 1600, 1500, 1450, 1240, 1210, 1115, 1095, 1070, 1040, 895, 760, 735 és 700 cm^{-1} .

7. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Benzil-6-(benziloximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-(illetve benzil-)észter

20 mg (55,8 μmol) 7a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően éteresítünk, és a feldolgozás és tisztítás után 21 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3090, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1735, 1605, 1500, 1455, 1120, 1100, 1075, 1005, 895, 760, 740 és 700 cm^{-1} .

7a) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7- [4-Benzil-6-(hidroximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

364 mg (611 μmol) 7b) példa szerint előállított bicyklusos vegyületet az 1a) példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és a feldolgozás és tisztítás után 210 mg (586 μmol , 96 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-3200, 3060, 3020, 2940, 2920, 2870, 1735, 1600, 1450, 1435, 1245, 1200, 1150, 1030, 1000, 890, 765 és 705 cm^{-1} .

7b) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7- [4-Benzil-6-(terc-butildifenil-szilil-oximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

554 mg (901 μmol) 7c) példa szerint előállított diolt az 1b) példában leírtaknak megfelelően ciklizálunk,

és a feldolgozás és tisztítás után 364 mg (610 μmol , 68 %) cim szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.
IR (film): 3070, 3030, 2950, 2930, 2860, 1735, 1600, 1590, 1425, 1110, 1070, 1005, 895, 820, 740 és 700 cm^{-1} .

7c) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7- [1-(Hidroxi-metil)-1-benzil-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-hidroxi-ciklopentán-2-ill]-5-hepténsav-metil-észter

766 mg (1,10 mmol) 7d) példa szerint előállított vegyületet az 1c) példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és a feldolgozás és tisztítás után 554 mg (901 μmol , 82 %) cim szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3200-3600, 3070, 3050, 3020, 3000, 2950, 2925, 2855, 1735, 1600, 1590, 1425, 1110, 820, 740 és 700 cm^{-1} .

7d) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7- [1-(Hidroxi-metil)-1-benzil-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropiran-2-ill-oxi)-ciklopentán-2-ill]-5-hepténsav-metil-észter

742 mg (1,23 mmol) 7e) példa szerint előállított nempoláros laktolt az 1d) példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk. Az észterezés és tisztítás után 766 mg (1,10 mmol, 89 %) cim szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3200-3600, 3070, 3050, 3020, 3000, 2940, 2855, 1735, 1600, 1590, 1425, 1265, 1200, 1100, 1030, 870, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

7e) példa

(1S,4RS,6R,7S,8R)-1-Benzil-4-hidroxi-7-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-3-oxabicyclo[4.3.0]nonán (A) és

(1S,3RS,6R,7S,8R)-1-benzil-3-hidroxi-7-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-4-oxabicyclo[4.3.0]nonán (B)

1,86 g (3,11 mmol) 7f) példa szerint előállított kb. 1:1 arányú regioizomer lakton-keveréket az 1e) példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és a feldolgozás után 1,85 g (3,08 mmol, 99 %) terméket kapunk, amely a cím szerinti A és B vegyület keveréke.

IR (film): 3200, 3600, 3070, 3045, 3020, 2940, 2855, 1600, 1590, 1425, 1110, 1040, 870, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 764 mg (1,27 mmol, 41 %) nempoláros A vegyületet és 897 mg (1,49 mmol, 48 %) B vegyületet kapunk.

7f) példa

(1S,6R,7S,8R)-1-Benzil-7-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropirán-2-il-oxi)-3-oxabicyclo[4.3.0]nonán 4-on és

(1R,6R,7S,8R)-1-benzil-7-(terc-butyl-difenil-szilil-

-oxi-metil)-8-(tetrahidropirán-2-il-oxi)-4-oxabicyclo [4.3.0]-nonán-3-on

3,86 g (6,62 mmol) 7g) példa szerint előállított bicyklusos ketont az 1f) példában leírtaknak megfelelően oxidálunk. Feldolgozás és tisztítás után 3,04 g (5,08 mmol, 77 %) terméket kapunk szintelen olaj formájában, amely a cím szerinti vegyületek kb. 1:1 arányu keveréke.

IR (film): 3070, 3045, 3010, 2940, 2855, 1745, 1600, 1590, 1425, 1110, 1035, 970, 870, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

7g) példa

(1R,5R,6S,7R)-1-Benzil-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-7-(tetrahidropirán-2-il-oxi)-bicyclo [3.3.0]oktán-3-on

2,01 g (4,18 mmol) 1h) példa szerint előállított bicyklusos telítetlen ketont az 1g) példában leírtaknak megfelelően benzil-magnézium-kloriddal rézkatalizátor jelenlétében reagáltatunk. Feldolgozás és tisztítás után 1,90 g (3,23 mmol, 83 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3050, 3025, 2930, 2855, 1740, 1600, 1590, 1425, 1265, 1110, 1075, 1020, 870, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

8. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Benzil-6-(benzoil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav

21 mg 7. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 10,7 mg (24,6 μmol , a 7. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 44 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3090, 3060, 3030, 3000, 2930, 2860, 1730, 1710, 1600, 1495, 1455, 1115, 1100, 1075, 1010, 895, 765, 740 és 705 cm^{-1} .

9. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(p-Fenil-benzil)-6-(benzoil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-(illette benzil-)észter

29 mg (66,7 μmol) 9a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően éterré alakítunk, és a feldolgozás és tisztítás után 24 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1735, 1600, 1490, 1455, 1115, 1075, 1005, 895, 850, 770, 740 és 700 cm^{-1} .

9a) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(p-Fenil-benzil)-6-(hidroximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

210 mg (313 μmol) 9b) példa szerint előállított biciklusos vegyületet az 1a) példában leírtaknak megfelelően

reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 126 mg (290 μmol , 93 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (KBr): 3200-3600, 3020, 2920, 2880, 2850, 1715, 1490, 1440, 1200, 1005, 890, 770, 740 és 695 cm^{-1} .

Op.: 61,5-63°C.

9b) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R-7-[4-(p-Fenil-benzil)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabiciklo [2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

296 mg (428 μmol) 9c) példa szerint előállított diolt az 1b) példában leírt módon ciklizálunk, és a feldolgozás és tisztítás után 220 mg (327 μmol , 76 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3050, 3020, 3000, 2950, 2920, 2855, 1735, 1600, 1590, 1485, 1425, 1110, 1070, 1005, 900, 845, 820, 765, 740 és 700 cm^{-1} .

9c) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-(Hidroxi-metil)-1-(p-fenil-benzil)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-hidroxi-ciklopentán-2-ill-5-hepténsav-metil-észter

469 mg (605 μmol) 9d) példa szerint előállított vegyületet az 1c) példában leírt módon reagáltatunk, és a feldolgozás és tisztítás után 308 mg (446 μmol , 74 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3200-3600, 3070, 3050, 3030, 3000, 2950, 2930, 2860, 1735, 1600, 1590, 1490, 1430, 1115, 825, 770, 740, 705 és 505 cm^{-1} .

9d) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-(Hidroxi-metil)-1-(p-fenil-benzil)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-ciklopentán-2-il]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1R,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-(p-fenil-benzil)-2-(hidroxi-metil)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-ciklopentán-1-il]-5-hepténsav-metil-észter (B)

0,77 g (1,14 mmol) 9e) példa szerint előállított kb. 1:1 arányu regioizomer laktolkeveréket az 1d) példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk. Az észterezés, tisztítás és kromatográfiás elválasztás után 355 mg (458 μmol , 40 %) nempoláros B vegyületet és 509 mg (657 μmol , 58 %) poláros A vegyületet kapunk, mindkettőt szintelen olaj formájában.

IR (film): 3200-3600, 3070, 3050, 3020, 3000, 2950, 2855, 1735, 1600, 1590, 1430, 1110, 1025, 860, 820, 765, 740 és 700 cm^{-1} .

9e) példa

(1S,4RS,6R,7S,8R)-1-(p-Fenil-benzil)-4-hidroxi-7-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)3-oxabicyclo[4.3.0]nonán A és

(1S,3RS,6R,7S,8R)-1-(p-fenil-benzil)-3-hidroxi-7-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-4-oxabicyclo[4.3.0]nonán (B)

1,62 g (2,40 mmol) 9f) példa szerint előállított kb. 1:1 arányu regioizomer laktonkeveréket az 1e) példában leírt módon redukálunk. Feldolgozás és tisztítás után 1,37 g (2,03 mmol, 84 %) terméket kapunk, amely a cím szerinti vegyületek keveréke, és amelyet tisztítás nélkül reagáltatunk tovább.

IR (film): 3200-3600, 3070, 3050, 3020, 2940, 2855, 1600, 1590, 1485, 1425, 1265, 1200, 1110, 1075, 1020, 870, 820, 765, 740 és 700 cm^{-1} .

9f) példa

(1S,6R,7S,8R)-1-(p-Fenil-benzil)-7-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-3-oxabicyclo[4.3.0]nonán-4-on és

(1R,6R,7S,8R)-1-(p-fenil-benzil)-7-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-4-oxabicyclo[4.3.0]nonán-3-on

2,20 g (3,34 mmol) 9g) példa szerint előállított bicyklusos ketont az 1f) példában leírt módon oxidálunk. Feldolgozás és tisztítás után 1,69 g (2,51 mmol, 75 %) terméket különítünk el szintelen olajként, amely a cím szerinti két vegyület kb. 1:1 arányu keveréke.

IR (film): 3070, 3050, 3020, 2940, 2850, 1745, 1600, 1590, 1485, 1425, 1260, 1110, 1075, 1030, 870, 820, 735 és 700 cm^{-1} .

9g) példa

(1R,5R,6S,7R)-1-(p-Fenil-benzil)-6-(terc-butyl-di-fenil-szilil-oxi-metil)-7-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-biciklo-[3.3.0]oktán-3-on

1,91 g (3,88 mmol) 1h) példa szerint előállított biciklusos telitetlen ketont az 1g) példában leírt módon p-fenil-benzil-magnézium-kloriddal reagáltatunk rézkatalizátor jelenlétében. A feldolgozás és tisztítás után 2,29 g (3,48 mmol, 90 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3070, 3050, 3000, 2940, 2855, 1730, 1600, 1590, 1485, 1425, 1110, 1075, 1020, 865, 820, 740 és 700 cm^{-1} .

10. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(p-Fenil-benzil)-6-(benzoil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav

24 mg 9. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és a feldolgozás és tisztítás után 16,2 mg (31,7 μmol , a 9. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 48 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (KBr): 3600-2400, 3060, 3030, 3000, 2929, 2860, 1730, 1705, 1600, 1485, 1450, 1110, 1075, 1005, 895, 845, 770, 740 és 695 cm^{-1} .

11. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(1-Pentinil)-6-(benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-(illette benzil-)észter

12,3 mg (36,8 μmol 11a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leirt módon éterezzük, és feldolgozás és tisztítás után 16,4 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3060, 3015, 2960, 2930, 2870, 1735, 1450, 1155, 1010, 895, 735 és 700 cm^{-1} .

11a) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(1-Pentinil)-6-(hidroximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

22 mg (38 μmol) 11b) példa szerint előállított bicyklusos vegyületet az 1a) példában leirtaknak megfelelően reagáltatunk, és a feldolgozás és tisztítás után 12 mg (37 μmol , 96 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3200-3600, 2955, 2930, 2870, 1735, 1450, 1435, 1220, 1190, 1155, 1030, 1000, 950 és 890 cm^{-1} .

11b) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(1-Pentinil)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

46 mg (78 μmol) 11c) példa szerint előállított diolt az 1b) példában leírt módon ciklizálunk. A feldolgozás és tisztítás után 22 mg (38 μmol , 49 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3050, 2960, 2930, 1735, 1590, 1425, 1245, 1110, 1005, 890, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

11c) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-(Hidroxi-metil)-1-(1-pentil)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-hidroxi-ciklopentán-2-ill-5-hepténsav-metil-észter

75 mg (111 μmol) 11d) példa szerint előállított vegyületet az 1c) példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és a feldolgozás és tisztítás után 46 mg (78 μmol , 70 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3100-3600, 3070, 3050, 3000, 2950, 2930, 2855, 1735, 1590, 1425, 1110, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

11d) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-(Hidroxi-metil)-1-(1-pentil)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-ciklopentán-2-ill-5-hepténsav-metil-észter

78 mg (135 μmol) 11e) példa szerint előállított poláros laktolt az 1d) példában leírt módon reagáltatunk, és az észterezés és tisztítás után 75 mg (111 μmol , 72 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3200-3600, 3070, 3050, 2950, 2930, 2860, 1735,
1590, 1430, 1200, 1110, 1030, 870, 820, 740
és 705 cm^{-1} .

11e) példa

(1S,4RS,6R,7S,8R)-1-(1-Pentinil)-4-hidroxi-7-(terc-
-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-
-3-oxa-biciklo [4.3.0]nonán (A) és

(1S,3RS,6R,7S,8R)-1-(1-pentinil)-3-hidroxi-7-(terc-
-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-
-4-oxabiciklo [4.3.0]nonán (B)

330 mg (574 μmol) 11f) példa szerint előállított
kb. 1:1 arányu regioizomer laktonkeveréket az 1e) példában
leírt módon redukálunk. 325 mg (563 μmol , 98 %) terméket kü-
lönítünk el, amely a cím szerinti A és B vegyület keveréke.
IR (film): 3200-3600, 3070, 3050, 2940, 2860, 1590, 1425,
1265, 1200, 1110, 1075, 1020, 870, 820, 740 és
705 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 125 mg
(218 μmol , 38 %) B vegyületet és 80 mg (139 μmol , 24 %)
poláros A vegyületet kapunk.

11f) példa

(1S,6R,7S,8R)-1-(1-Pentinil)-7-(terc-butyl-difenil-
-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-3-oxabiciklo-
[4.3.0]nonán-4-on és

(1S,6R,7S,8R)-1-(1-pentinil)-7-terc-butil-difenil-
-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-4-oxabicyclo-
[4.3.0]nonán-3-on

770 mg (1,38 mmol) 11g) példa szerint előállított
bicyklusos ketont az 1f) példában leírt módon oxidálunk, és
a feldolgozás és tisztítás után 570 mg (992 μmol , 72 %)
terméket kapunk színtelen olaj formájában, amely a cím sze-
rinti vegyületek kb. 1:1 arányu keveréke.

IR (film): 3070, 3050, 2940, 2860, 1750, 1590, 1425, 1260,
1110, 1075, 1035, 970, 870, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

11g) példa

(1S,5R,6S,7R)-1-(1-Pentinil)-6-(terc-butil-difenil-
-szilil-oxi-metil)-7-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-bicyclo-
[3.3.0]oktán-3-on

587 mg 1-pentin-10 ml vízmentes dietil-éterrel ké-
szült oldatát -40°C -ra hűtjük és száraz argon atmoszférában
7,2 ml 1,18 mólos hexános butil-litium-oldatot adunk hozzá,
30 percig -10°C -on keverjük az elegyet, majd -40°C -ra hűt-
jük ismét és 8,5 ml 1 mólos toluolos dietil-alumínium-klorid
oldatot adunk hozzá és a keverést még 40 percig 0 és 3°C kö-
zötti hőmérsékleten folytatjuk. A képződött emulziót a ned-
vesség kizárása mellett 20 ml vízmentes dietil-éterrel fel-
iszapolt 104 mg nikkel-acetil-acetonát és 400 μl 1 mólos
toluolos diizobutil-alumínium-hidrid elegyéhez adjuk, -10°C -ra
hűtjük és rövid idő alatt 1,85 g (3,77 mmol) 1h) példa sze-
rint előállított bicyklusos telítetlen keton 25 ml vízmentes

dietil-éterrel készült oldatát csepegtetjük hozzá. A komponenseket még 1,5 órán át -15 és -5°C közötti hőmérsékleten hagyjuk reagálni, majd a reakcióelegyet 200 ml finomra tört jég és 50 ml 1 n sósav keverékére öntjük intenzív keverés közben. Az így kapott elegyet aztán több alkalommal, összesen 250 ml dietil-éterrel extraháljuk, az egyesített szerves extraktumokat vízzel, majd telített vizes nátrium-klorid-oldattal semlegesre mossuk, magnézium-szulfáton szárítjuk és az oldószert vizsugárral létesített vákuumban eltávolítjuk. A visszamaradó 2,41 g barna nyers olajat kb. 400 ml kovássavgélén nyomás alatt kromatografáljuk, eluálószerként n-hexán és etil-acetát gradienselegyet használjuk. Ily módon 890 mg (1,59 mmol, 42 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3045, 2970, 2930, 1740, 1590, 1428, 1155, 1110, 1075, 1020, 870, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

12. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(1-Pentinil)-6-(benzil-oximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-heptánsav

16,4 mg 11. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 10,9 mg ($26,5\text{ }\mu\text{mol}$, a 11. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 72 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3090, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1730, 1710, 1605, 1455, 1115, 1090, 1075, 1010, 895, 735 és 700 cm^{-1} .

13. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(Fenil-acetilén)-6-(benzoil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-(illette benzil-)észter

11,7 mg (31,8 μmol) 13a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 14 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 2230, 1735, 1605, 1490, 1455, 1110, 1075, 1005, 895, 755, 740 és 695 cm^{-1} .

13a) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(Fenil-acetilén)-6-hidroxi-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

91 mg (150 μmol) 13b) példa szerint előállított bicyklusos vegyületet az 1a) példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 55 mg (148 μmol , 99 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (CHCl_3): 3200-3700, 3080, 3060, 3030, 3000, 2950, 2880, 2230, 1725, 1600, 1490, 1440, 1365, 1300, 1220, 1175, 1025, 995, 890 és 690 cm^{-1} .

13b) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(Fenil-acetilén)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

120 mg (192 μ mol) 13c) példa szerint előállított diolt az 1b) példában leirt módon ciklizálunk, és feldolgozás és tisztítás után 91 mg (150 μ mol, 62 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3050, 3000, 2950, 2930, 2860, 2215, 1735, 1600, 1590, 1425, 1110, 1005, 895, 820, 755, 740 és 705 cm^{-1} .

13c) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-(Hidroxi-metil)-1-(fenil-acetilén)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-hidroxi-ciklopentán-2-ill-5-hepténsav-metil-észter

205 mg (289 μ mol) 13d) példa szerint előállított vegyületet az 1c) példában leírtaknak megfelelően reagáltattunk, és feldolgozás és tisztítás után 120 mg (192 μ mol, 66 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3200-3600, 3070, 3050, 3010, 2950, 2930, 2860, 2220, 1735, 1600, 1590, 1425, 1110, 820, 755, 740 és 705 cm^{-1} .

13d) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-(Hidroxi-metil)-1-(fenil-acetilén)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-ciklopentán-2-il)-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1R(5Z),2R,3S,4R)-7-[1-(fenil-acetilén)-2-(hidroxi-metil)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidro-

piran-2-il-oxi)-ciklopentán-1-il]-5-hepténsav-metil-észter (B)

512 mg (838 μmol) 13e) példa szerint előállított, kb. 1:1 arányu regioizomer laktolkeveréket az 1d) példában leírt módon reagáltatunk, és a metil-észter előállítása, tisztítás és kromatográfiás elválasztás után 220 mg (310 μmol , 37 %) nempoláros cím szerinti B vegyületet, valamint 205 mg (289 μmol , 35 %) poláros cím szerinti A vegyületet kapunk, mindkettőt szintelen olaj alakjában.

IR (CHCl_3): 3400-3600, 3070, 3050, 3000, 2940, 2860, 2220, 1600, 1590, 1425, 1255, 1110, 1075, 1020, 910, 865, 820 és 700 cm^{-1} .

13f) példa

(1S,6R,7S,8R)-1-(Fenilacetilén)-7-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-3-oxa-biciklo[4.3.0]nonán-4-on és

(1S,6R,7S,8R)-1-(fenil-acetilén)-7-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-4-oxa-biciklo[4.3.0]nonán-3-on

1,7 g (2,87 mmól) 13g) példa szerint előállított biciklusos ketont az 1f) példában leírt módon oxidálunk. Feldolgozás és tisztítás után 1,01 g (1,66 mmol, 58 %) terméket kapunk enyhén sárgás színű hab alakjában, amely a cím szerinti vegyületek kb. 1:1 arányu keveréke.

IR (film): 3070, 3050, 2940, 2860, 1750, 1600, 1590, 1575,
1430, 1260, 1110, 1035, 970, 915, 870, 820, 740
és 705 cm^{-1} .

13g) példa

(1S,5R,6S,7R)-1-(Fenil-acetilén)-6-(terc-butil-
-difenil-szilil-oxi-metil)-7-(tetrahidropirán-2-il-oxi)-
-biciklo [3.3.0]oktán-3-on

2,0 g (4,08 mmol) 1h) példa szerint előállított
biciklusos telítetlen ketont a 11g) példában leírtak szerint
fenil-acetilénnel reagáltatunk. Feldolgozás és tisztítás
után 1,78 g (3,00 mmol, 74 %) cím szerinti vegyületet kapunk
sárga olaj alakjában.

IR (CHCl_3): 3070, 3050, 3000, 2940, 2860, 2220, 1735, 1600,
1590, 1425, 1260, 1110, 1075, 1020, 915, 870,
820, 740 és 700 cm^{-1} .

14. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7- [4-(Fenil-acetilén)-6-(benzil-
-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-hepténsav

14 mg 13. példa szerint előállított észterelegyet
a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás
és tisztítás után 10,1 mg (22,7 μmol , a 13. példa szerinti
kiindulási anyagra számítva 71 %) cím szerinti vegyületet
kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2880,
2230, 1730, 1705, 1600, 1490, 1455, 1110, 1070,
1005, 895, 755, 740 és 690 cm^{-1} .

15. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(benzoil-
-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-
-(illette benzil-)észter

19,5 mg (52,3 μ mol) 15a) példa szerint előállított
alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően étereztünk,
és feldolgozás és tisztítás után 23 mg cím szerinti vegyüle-
tet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1735, 1600,
1495, 1240, 1205, 1115, 1095, 1020, 895, 740 és
700 cm^{-1} .

15a) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(hidroxil-
-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-
-észter

944 mg (1,55 mmol) 15b) példa szerint előállított
bicyklusos vegyületet az 1a) példában leírt módon reagálta-
tunk, és feldolgozás és tisztítás után 528 mg (1,42 mmol,
92 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj-
ként.

IR (film): 3200-3600, 3060, 3020, 3000, 2940, 2860, 1735,
1605, 1450, 1435, 1240, 1155, 1025, 895, 750
és 700 cm^{-1} .

15b) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

1,11 g (1,77 mmol) 15c) példa szerint előállított diolt az 1b) példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és tisztítás után 945 mg (1,55 mmol, 88 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3070, 3050, 3020, 3000, 2940, 2850, 1735, 1600, 1590, 1425, 1110, 895, 820, 740 és 700 cm^{-1} .

15c) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-(Hidroxi-metil)-1-(2-fenil-etil)-3-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-4-hidroxi-ciklopentán-2-il]-5-hepténsav-metil-észter

1,62 g (2,27 mmol) 15d) példa szerint előállított vegyületet az 1c) példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és elkülönítés után 1,11 g (1,77 mmol, 78 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3200-3600, 3070, 3050, 3020, 3000, 2940, 2850, 1735, 1600, 1590, 1430, 1240, 1110, 1045, 820, 740 és 700 cm^{-1} .

15d) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-(Hidroxi-metil)-1-(2-fenil-etil)-3-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-ciklopentán-2-il]-5-hepténsav-metil-észter (A)

és

(1R(5Z),2R,3S,4R)-7-[1-(2-fenil-etil)-2-(hidroximetil)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-ciklopentán-1-il]-5-hepténsav-metil-észter (B)

2,62 g (4,26 mmol) 15e) példa szerint előállított regioizomer laktolkeveréket az 1d) példában leírt módon reagáltatunk, és észterezés, tisztítás és kromatográfiás elválasztás után 1,29 g (1,81 mmol, 42 %) nempoláros cím szerinti B vegyületet és 1,62 g (2,27 mmol, 53 %) poláros cím szerinti A vegyületet különítünk el.

IR (film, A vegyület): 3200-3600, 3070, 3050, 3020, 2940, 2855, 1735, 1600, 1590, 1430, 1240, 1200, 1110, 1030, 870, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

15e) példa

(1S,4RS,6R,7S,8R)-1-(2-Fenil-etil)-4-hidroxi-7-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-3-oxabicyclo[4.3.0]nonán és

(1R,3RS,6R,7S,8R)-1-(2-fenil-etil)-3-hidroxi-7-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-4-oxabicyclo[4.3.0]nonán

2,70 g (4,40 mmol) 15f) példa szerint előállított regioizomer laktonkeveréket az 1e) példában leírt módon redukálunk, és feldolgozás után 2,62 g (4,26 mmol, 97 %) terméket kapunk, amely a cím szerinti vegyületek keveréke.

IR (film): 3200-3600, 3070, 3050, 3020, 2930, 2850, 1600, 1590, 1425, 1155, 1260, 1200, 1110, 1075, 1020, 910, 865, 820, 740 és 700 cm^{-1} .

15f) példa

(1S,6R,7S,8R)-1-(2-Fenil-etil)-7-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropirán-2-il-oxi)-3-oxa-biciklo [4.3.0]nonán-4-on és

(1R,6R,7S,8R)-1-(2-fenil-etil)-7-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-tetrahidropirán-2-il-oxi)-4-oxa-biciklo [4.3.0]nonán-3-on

3,14 g (5,26 mmol) 15g) példa szerint előállított ketont az 1f) példában leírt módon oxidálunk, és feldolgozás és tisztítás után 2,70 g (4,40 mmol, 84 %) cím szerinti terméket kapunk, amely a vegyületek kb. 1:1 arányú keveréke. IR (film): 3070, 3050, 3015, 2940, 2850, 1745, 1600, 1590, 1425, 1110, 1040, 970, 870, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

15g) példa

(1R,5R,6S,7R)-1-[2-(Fenil-etil)-6-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-7-(tetrahidropirán-2-il-oxi)-biciklo-[3.3.0]oktán-3-on

4,18 g (8,52 mmol) 1h) példa szerint előállított biciklusos telítetlen ketont az 1g) példában leírtaknak megfelelően fenetil-magnézium-bromiddal reagáltatunk rézkatalizátor jelenlétében. Feldolgozás és tisztítás után 3,15 g (5,27 mmol, 62 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3050, 3020, 2930, 2850, 1740, 1600, 1590,
1425, 1110, 1075, 1020, 870, 820, 740 és 700 cm^{-1} .

16. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(benzil-
-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

23 mg 15. példa szerint előállított észterkeveréket
a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás
és tisztítás után 21 mg (47 μmol , a 15. példa szerinti kiin-
dulási anyagra számítva 90 %) cím szerinti terméket kapunk
szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3020, 3000, 2930, 2860,
1730, 1705, 1600, 1495, 1455, 1240, 1205, 1115,
1090, 1025, 895, 740 és 700 cm^{-1} .

17. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(benzil-
-oxi-metil)2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-
-metil-(illetve benzil-)észter

17,5 mg (48,3 μmol) 17a) példa szerint előállított
alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk,
és feldolgozás és tisztítás után 24 mg cím szerinti vegyü-
letet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3060, 3020, 3000, 2930, 2870, 1735, 1600, 1510,
1455, 1110, 1075, 895, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

17a) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-hidroxi-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

798 mg (1,33 mmol) 17b) példa szerint előállított bicyklusos vegyületet az 1a) példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 448 mg (1,24 mmol, 93 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3200-3600, 3080, 3060, 3020, 3000, 2950, 2870, 1735, 1600, 1510, 1435, 1220, 1020, 995, 895, 820 és 700 cm^{-1} .

17b) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

1,15 g (1,86 mmol) 17c) példa szerint előállított diolt az 1b) példában leírt módon ^kcillizálunk, és feldolgozás és tisztítás után 800 mg (1,33 mmol, 72 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (CHCl_3): 3070, 3050, 3000, 2950, 2930, 2860, 1735, 1605, 1590, 1510, 1425, 1230, 1110, 895, 830, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

17c) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-(Hidroxi-metil)-1-(p-fluor-fenil)-3-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-4-hidroxi-

-ciklopentán-2-ill-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1R,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-(p-fluor-fenil)-2-(hidroximetil)-3-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-4-hidroxiciklopentán-1-ill-5-hepténsav-metil-észter (B)

2,58 g (3,67 mmol) 17d) példa szerint előállított regioizomer vegyületkeveréket az 1c) példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás, tisztítás és elválasztás után 1,15 g (1,86 mmol, 51 %) cím szerinti A vegyületet, valamint 0,85 g (1,37 mmol, 37 %) cím szerinti B vegyületet kapunk, mindkettőt szintelen olaj alakjában.

IR (CHCl₃): A vegyület: 3700-3200, 3070, 3040, 3010, 2950, 2930, 2850, 1730, 1600, 1590, 1510, 1425, 1230, 1110, 1050, 820, 740 és 705 cm⁻¹.

17d) példa

(1S,2R(5Z),3S,4R)-7-[1-(Hidroximetil)-1-(p-fluor-fenil)-3-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-ciklopentán-2-ill-5-hepténsav-metil-észter és

(1R(5Z),2R,3S,4R)-7-[1-(p-fluor-fenil)-2-(hidroximetil)-3-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-ciklopentán-1-ill-5-hepténsav-metil-észter

2,55 g (4,22 mmol) 17e) példa szerint előállított kb. 1:1 arányu regioizomer laktolkeveréket az 1d) példában leírt módon reagáltatunk és a metil-észter előállítására, valamint tisztítás után 2,58 g (3,67 mmol, 87 %) terméket kapunk szintelen olaj alakjában, amely a cím szerinti vegyületek keveréke.

IR (film): 3200-3000, 3070, 3050, 3020, 2950, 2860, 1735,
1600, 1590, 1510, 1430, 1235, 1110, 1035, 870,
820, 740 és 705 cm^{-1} .

17e) példa

(1S,4RS,6R,7S,8R)-1-(p-Fluor-fenil)-4-hidroxi-7-
-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-
-2-il-oxi)-3-oxabicyclo[4.3.1]nonán és

(1S,3RS,6R,7S,8R)-1-(p-fluor-fenil)-3-hidroxi-7-
-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-
-il-oxi)-4-oxabicyclo[4.3.0]nonán

2,57 g (4,26 mmol) 17f) példa szerint előállított
kb. 1:1 arányú regioizomer laktonkeveréket az 1e) példában
leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás
után 2,55 g (4,22 mmol, 99 %) terméket kapunk, amely
a cím szerinti két vegyület keveréke.

IR (film): 3200-3600, 3070, 3040, 3000, 2950, 2870, 1600,
1590, 1510, 1425, 1260, 1110, 1075, 1040, 910,
865, 820, 740 és 700 cm^{-1} .

17f) példa

(1S,6R,7S,8R)-1-(p-Fluor-fenil)-7-(terc-butyl-
-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-3-
-oxabicyclo[4.3.0]nonán-4-on és

(1S,6R,7S,8R)-1-(p-fluor-fenil)-7-(terc-butyl-difenil-
-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-4-oxabicyclo-
[4.3.0]nonán-3-on

2,80 g (4,77 mmol) 17g) példa szerint előállított biciklusos ketont az 1f) példában leírt módon oxidálunk, és feldolgozás és tisztítás után 2,58 g (4,28 mmol, 90 %) terméket kapunk, amely a cím szerinti vegyületek kb. 1:1 arányu keveréke.

IR (CHCl₃): 3070, 3050, 3000, 2950, 2860, 1745, 1605, 1590, 1510, 1230, 1110, 1030, 820, 740 és 700 cm⁻¹.

17g) példa

(1S,5R,6S,7R)-1-(p-Fluor-fenil)-7-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-7-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-biciklo-[3.3.0]oktán-3-on

4,06 g (8,27 mmol) 1h) példa szerint előállított biciklusos telítetlen ketont az 1g) példában leírtaknak megfelelően p-fluor-fenil-magnézium-kloriddal reagáltatunk rézkatalizátor jelenlétében. Feldolgozás és tisztítás után 2,80 g (4,77 mmol, 58 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3090, 3040, 2940, 2850, 1740, 1600, 1590, 1510, 1425, 1235, 1110, 1075, 1020, 820, 740 és 700 cm⁻¹.

18. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav

24 mg 17. példa szerint előállított észterkeveréket a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk,

és feldolgozás és tisztítás után 20 mg ($45,6 \mu\text{mol}$, a 17. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 94 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3090, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1725, 1710, 1605, 1510, 1450, 1230, 1160, 1040, 1025, 890, 830, 735, 695 és 640 cm^{-1} .

19. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Fenil-6-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-hepténsav

22,7 mg ($39 \mu\text{mol}$) 3b) példa szerint előállított vegyület 1 ml metanollal készült szintelen oldatához 0,5 ml 5 %-os vizes litium-hidroxid-oldatot adunk, és a kezdetben heterogén elegyet 16 órán át 23°C -on keverjük. Megfelelő mennyiségű 10 %-os vizes citromsavoldat hozzáadásával a reakcióelegyet semlegesítjük, és analitikai vékonyréteg-lemezen kromatográfiásan tisztítjuk, eluálószerként diklór-metán és etanol elegyét használjuk. A megfelelő zónából etil-acetát és etanol elegyével 19,5 mg ($34,3 \mu\text{mol}$, 88 %) cím szerinti vegyületet eluálunk szintelen olajként.

IR (film): 3500-2400, 3070, 3050, 3010, 2950, 2930, 2860, 1730, 1710, 1600, 1590, 1470, 1430, 1110, 1075, 890, 825, 760, 740, 700, 615, 505 és 490 cm^{-1} .

20. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Fenil-6-(hidroximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-6-yl]-5-hepténsav

15 mg (43,5 μmol) 3a) példa szerint előállított vegyületet a 19. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 10,3 mg (31,2 μmol , 72 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3100-2400, 3080, 3060, 3030, 2930, 2870, 1710, 1600, 1500, 1445, 1230, 1200, 1040, 1000, 970, 890, 760 és 700 cm^{-1} .

21. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Fenil-6-(hexil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

33,8 mg (98,1 μmol) 3a) példában előállított vegyületet 3,5 ml vízmentes tetrahidrofuranban oldunk, 10 mg 50 %-os ásványolajos nátrium-hidrid-diszperziót, majd a hidrogénfejlődés befejeződése után 140 μl 1-bróm-hexánt adunk hozzá. Száraz argon atmoszférában az elegyet 40-50 °C hőmérsékleten 18 órán át keverjük. Ezután vizet adunk hozzá, 10 %-os citromsav-oldattal megsavanyítjuk, és több alkalommal dietil-éterrel extraháljuk. Az egyesített szerves extraktumot vízzel mossuk, magnézium-szulfáton szárítjuk, szűrjük és víz-sugárral létesített vákuumban bepároljuk. A maradékot kromatográfiásan, analitikai vékonyréteg-lemezen, kloroform-etenol rendszerben tisztítjuk. A megfelelő zónából 16,4 mg (38,3 μmol , 39 %) cím szerinti vegyületet izolálunk a kiindulási anyag és az elhidrolizált észter mellett.

IR (film): 3070, 3050, 3030, 3000, 2940, 2870, 1735, 1600, 1450, 1040, 895, 760 és 700 cm^{-1} .

22. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Fenil-6-(hexil-oxi-metil)-
-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

16,4 mg (38,3 μ mol) 21. példa szerint előállított
vegyületet a 19. példában leírt módon elszappanosítunk, és
feldolgozás és tisztítás után 10,0 mg (24,1 μ mol, 63 %) cím
szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3050, 3030, 3010, 2960, 2940,
2870, 1730, 1710, 1600, 1450, 1040, 900, 760
és 700 cm^{-1} .

23. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-Fenil-6-(3-hidroxi-
-4,4-dimetil-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hep-
ténsav-metil-észter (A) és

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-fenil-6-(3-hidroxi-
-4,4-dimetil-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-
-hepténsav-metil-észter (B)

108 mg (231 μ mol) 23a) példa szerint előállított
telítetlen ketont 2,8 ml vízmentes metanolban oldunk, az ol-
datot száraz argonatmoszférában -40°C -ra hűtjük és 53 mg
nátrium-bór-hidridet adunk hozzá. Félóra eltelte után a reak-
ciót 70 μ l jégcet hozzáadásával leállítjuk, hagyjuk az ele-
gyet 23°C -ra melegedni, és aztán több alkalommal, összesen
8 ml dietil-éterrel extraháljuk. Magnézium-szulfáton való
szárítás után az oldószert vizsugárral létesített vákuumban
lepároljuk, és a maradékot 4 analitikai kovasavgéllemezen
kromatografáljuk. Futtatóelegyként kloroform és etanol, eluáló-

szerként etil-acetát és etanol elegyét használjuk. Ily módon 49 mg (105 μ mol, 45 %) apoláros vegyületet, amelyhez az A szerkezetet rendeljük és 31 mg (66 μ mol, 29 %) poláros komponenst kapunk, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

IR (film): A vegyület: 3200-3600, 3060, 2950, 2930, 2870, 1735, 1600, 1450, 1195, 1025, 995, 970, 895, 750 és 700 cm^{-1} .

IR (film): B vegyület: 3200-3600, 2950, 2930, 2870, 1735, 1600, 1445, 1245, 1195, 995, 970, 895, 760 és 700 cm^{-1} .

23a) példa

(4S,5R(5Z),6R(1E),1R)-7-[4-Fenil-6-(3-oxo-4,4-dimetil-1-oktenil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

8,9 mg nátrium-hidrid 2,8 ml vízmentes dimetoxi-etánnal készült szuszpenziójához 96 mg dimetil-(2-oxo-3,3-dimetil-heptil)-foszfónát 0,9 ml vízmentes dimetoxi-etánnal készült oldatát csepegtetjük. A hidrogénfejlődés megszűnte után 104 mg (303 μ mol) 23b) példa szerint előállított aldehid 1,3 ml vízmentes dimetoxi-etánnal készült oldatát csepegtetjük hozzá. Az elegyet hagyjuk 6 óra alatt 22°C-ra melegedni, 170 μ l jégacetet adunk hozzá, 5 ml dietil-éterrel hígítjuk, a szerves fázist vízzel és telített vizes nátrium-klorid-oldattal semlegesre mossuk, magnézium-szulfáton szárítjuk és vizsugárral létesített vákuumban az oldószert ledesztilláljuk.

A maradékot 6 analitikai kovasavgél-lemezen kromatográfiásan tisztítjuk. Futtatóelegyként n-hexán és etil-acetát elegyét, eluálószerként etil-acetátot használunk. Ily módon 108 mg (231 μmol , 76 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3060, 2955, 2930, 2870, 1735, 1685, 1620, 1450, 1195, 1045, 995, 900, 760 és 700 cm^{-1} .

23b) példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-(4-Fenil-6-formil-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl)-5-hepténsav-metil-észter

103 g (299 μmol) 3a) példa szerint előállított alkoholt a 38b) példában leírt módon oxidálunk, és feldolgozás és tisztítás után 101 mg (295 μmol , 99 %) cím szerinti vegyületet kapunk.

IR (film): 3060, 2950, 2870, 2720, 1735, 1715, 1600, 1500, 1445, 1435, 1245, 1165, 1015, 1000, 900, 765 és 700 cm^{-1} .

24. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-Fenil-6-(3-hidroxi-4,4,-dimetil-1-oktenil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

48 mg (105 μmol) 23. példa szerint előállított nem-poláros alkoholt a 2. példában leírtaknak megfelelően elszaporosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 44 mg (97 μmol , 92 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3000, 2950, 2930, 2870, 1710, 1600, 1450, 1240, 1200, 995, 970, 890, 755 és 700 cm^{-1} .

25. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-Fenil-6-(3-hidroxi-4,4-dimetil-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav

31 mg (66 μmol) 23. példa szerint előállított poláros alkoholt a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 30 mg (60,8 μmol , 92 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3090, 3060, 3030, 3000, 2960, 2930, 2870, 1710, 1605, 1450, 1240, 1195, 995, 970, 895, 760 és 700 cm^{-1} .

26. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Fenil-6-[(E/Z)-difenil-metoxi-imino-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

19 mg (40 μmol) 23b) példa szerint előállított aldehidet 200 μl vízmentes etanolban oldunk, 12,2 mg difenil-metoxi-hidroxi-amint és egy csepp piridint adunk hozzá, majd az oldatot száraz argon atmoszférában 7 órán át 50°C-on melegítjük. Lehűlés után analitikai kovásvégél-lemezen kromatografáljuk, futtatószerként kloroform és etanol elegyét használjuk, az eluciót etil-acetáttal végezzük. Így 20 mg (38 μmol ,

95 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3025, 2940, 2870, 1735, 1600, 1495, 1450, 1020, 1000, 935, 895, 760, 740 és 700 cm^{-1} .

27. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-[(E/Z)-difenil-metoxi-imino-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

18 mg 49 μmol) 27a) példa szerint előállított aldehidet a 26. példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 26 mg (47 μmol , 97 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 2940, 2865, 1735, 1600, 1495, 1450, 1020, 935, 895, 745 és 700 cm^{-1} .

27a) példa

(4S,5R(5Z),6R,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-formil-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

201 mg (540 μmol) 15a) példa szerint előállított alkoholt a 38b) példában leírtaknak megfelelően oxidálunk, és feldolgozás és tisztítás után 200 mg (540 μmol , 100 %) cím szerinti vegyületet kapunk halványsárga olaj formájában.

IR (film): 3070, 3050, 3020, 2950, 2860, 2720, 1735, 1715, 1605, 1450, 1435, 1245, 1160, 1025, 900 és 705 cm^{-1} .

28. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Fenil-6-[(E/Z)-difenil-
-metoxi-imino-metil]-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-hepténsav

20 mg (38 μ mol) 26. példa szerint előállított vegyületet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítottunk, és feldolgozás és tisztítás után 15 mg (29 μ mol, 77 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2500, 3090, 3060, 3030, 3010, 2940, 2880,
1730, 1710, 1605, 1495, 1450, 1000, 935, 900,
760, 745 és 700 cm^{-1} .

29. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-[(E/Z)-
-difenil-metoxi-imino-metil]-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-
-yl]-5-hepténsav

26 mg (47 μ mol) 27. példa szerint előállított vegyületet a 2. példában leírt módon elszappanosítottunk, és feldolgozás és tisztítás után 20 mg (37 μ mol, 79 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870,
1730, 1705, 1605, 1495, 1455, 1020, 935, 895,
745 és 700 cm^{-1} .

30. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-Fenil-6-(3-hidroxil-
-4-fenoxi-1-butenil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hep-
ténsav-metil-észter (A) és

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-fenil-6-(3-hidroxi-4-fenoxi-1-butenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (B)

54 mg (114 μ mol) 30a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás, tisztítás és az epimerek elválasztása után 26,6 mg (56 μ mol, 46 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 25 mg (52 μ mol, 46 %) poláros alkoholt kapunk, amelyhez a B szerkezetet rendeljük. IR (film, epimerelegy): 3600-3200, 3060, 3030, 3010, 2930, 2880, 1735, 1600, 1590, 1500, 1455, 1250, 1140, 1000, 970, 895, 760 és 700 cm^{-1} .

30a) példa

(4S,5R(5Z),6R(1E)1R)-7-[4-Fenil-6-(3-oxo-4-fenoxi-1-butenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

84 mg (245 μ mol) 23b) példa szerint előállított aldehidet 4 ml vízmentes dimetoxi-etánban oldunk, száraz argonatmoszférában 0-5°C-ra hűtjük az oldatot és 147 mg dimetil-(2-oxo-3-fenoxi-propil)-foszfonát-litium-sót adunk hozzá, majd 8 órán át 23°C-on keverjük. Ezután hideg vizes citromsavoldatra öntjük, több alkalommal dietil-éterrel extraháljuk, vízzel és telített vizes nátrium-klorid-oldattal az éteres fázist semlegesre mossuk, végül magnézium-szulfáton szárítjuk. Az oldószert vizsugárral létesített vákuum-

ban lepároljuk, a maradékot 5 analitikai kovasavgéllemezen kromatografáljuk. Futtatószerként kloroform és etanol elegyét használjuk, az eluálást etil-acetáttal végezzük. Ily módon 54 mg (114 μ mol, 47 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3060, 3030, 2940, 2870, 1735, 1690, 1620, 1600, 1495, 1435, 1290, 1240, 1220, 1045, 1000, 900, 755 és 700 cm^{-1} .

31. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-fenoxi-1-butenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-(p-fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-fenoxi-1-butenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (B)

59 mg (120 μ mol) 31a) példa szerint előállított tetraol ketont a 23. példában leírt módon redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 54 mg (109 μ mol, 91 %) szintelen olajat kapunk termékként, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3060, 3040, 3010, 2940, 2920, 2870, 1730, 1600, 1585, 1510, 1490, 1240, 1160, 1035, 895, 835, 755 és 690 cm^{-1} .

Kromatográfiás elválasztással 24 mg (49 μ mol, 41 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és

29 mg (59 μ mol, 49 %) poláros alkoholt kapunk, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

31a) példa

(4S,5R(5Z),6R(1E),1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(3-oxo-4-fenoxi-1-butenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il)-5-hepténsav-metil-észter

54 mg (150 μ mol) 31b) példa szerint előállított aldehidet a 30a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-3-fenoxi-propil)-foszfonát-litium-sóval reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 57 mg (116 μ mol, 77 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában. IR (film): 3000, 2940, 2870, 1730, 1690, 1620, 1600, 1430, 1225, 1160, 895, 835, 755 és 690 cm^{-1} .

31b) példa

(4S,5R(5Z),6R,1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-formil-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

155 mg (428 μ mol) 17a) példa szerint előállított alkoholt a 38b) példában leírt módon oxidálunk, és feldolgozás után 155 mg (428 μ mol, 100 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3060, 2950, 2870, 2730, 1735, 1600, 1505, 1450, 1435, 1245, 1160, 1010, 1005, 900, 820, 780 és 700 cm^{-1} .

32. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-Fenil-6-(3-hidroxi-4-fenoxi-1-butenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

25 mg (52 μ mol) 30. példa szerint előállított poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 19 mg (41 μ mol, 79 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3060, 3030, 3010, 2930, 2880, 1710, 1600, 1590, 1500, 1455, 1245, 1140, 995, 970, 895, 760 és 700 cm^{-1} .

33. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-p-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-fenoxi-1-butenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

24 mg (49 μ mol) 31. példa szerint előállított nem-poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 19 mg (40 μ mol, 81 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3060, 3040, 3010, 2930, 2880, 1710, 1600, 1585, 1515, 1495, 1300, 1240, 1160, 1040, 895, 835, 755, 690 és 585 cm^{-1} .

34. példa

(4S,5R(5Z),6S(1E,3R),1R)-7-[4-Fenil-6-(3-hidroxi-4-fenoxi-1-butyl)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

26 mg (55 μ mol) 30. példa szerint előállított nem-

poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 17 mg ($37\text{ }\mu\text{mol}$, 67 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3060, 3030, 3010, 2930, 2880, 1730, 1710, 1600, 1590, 1500, 1455, 1245, 1040, 890, 755, 700 és 690 cm^{-1} .

35. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxil-4-fenoxil-1-butenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

29 mg ($59\text{ }\mu\text{mol}$) 31. példa szerint előállított poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 24 mg ($50\text{ }\mu\text{mol}$, 85 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2500, 3060, 3040, 3010, 2930, 2880, 1710, 1600, 1585, 1515, 1495, 1455, 1300, 1240, 1160, 1040, 895, 835, 755, 690 és 590 cm^{-1} .

36. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Metil-6-(fenil-p-benzil-oximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-(illetve benzil-)észter

16,7 mg ($59\text{ }\mu\text{mol}$) 1a) példában előállított alkoholt az 1. példában leírt módon, 4-fenil-benzil-klorid alkalmazásával reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 26 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3030, 3010, 2960, 2930, 2880, 1735, 1600, 1485, 1455, 1230, 1110, 1020, 895, 830, 760 és 700 cm^{-1} .

37. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Metil-6-(fenil-p-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav

26 mg 36. példa szerint előállított észterkeveréket a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 18 mg (41 μmol , 69 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3030, 3000, 2950, 2920, 1730, 1705, 1600, 1485, 1455, 1235, 1110, 1085, 1020, 1010, 895, 825, 760 és 695 cm^{-1} .

38. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-Metil-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyklo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-metil-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyklo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (B)

37 mg (98 μmol) 38a) példa szerint előállított tetra-
litetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 37 mg (97 μmol , 100 %) terméket kapunk szintelen olaj alakjában, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 2950, 2930, 2860, 1735, 1450, 1435, 1020, 965 és 890 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 19 mg (50 μmol , 51 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, valamint 16,5 mg (44 μmol , 44 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

38a) példa

(4S,5R(5Z),6R(1E),1R)-7-[4-Metil-6-(3-oxo-1-oktenil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

50 mg (178 μmol) 38b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírt módon, dimetil-(2-oxo-heptil)-foszfonát alkalmazásával reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 37,6 mg (100 μmol , 56 % cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 2950, 2930, 2870, 1735, 1690, 1670, 1620, 1450, 1435, 1240, 1195, 1160, 1020, 980 és 895 cm^{-1} .

38b) példa

(4S,5R(5Z),6R,1R)-7-(4-Metil-6-formil-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl)-5-hepténsav-metil-észter

63 μmol frissen desztillált oxalil-klorid 1,6 ml vizmentes diklór-metánnal készült, -60°C -ra hűtött oldatához száraz argon atmoszférában 110 μml dimetil-szulfoxid 310 μl diklór-metánnal készült oldatát, majd kb. 2 perc múlva 168 mg (595 μmol) 1a) példa szerint előállított alkohol 630 μl di-

klór-metánnal készült oldatát adjuk. A komponenseket még 30-40 percig hagyjuk reagálni, majd 440 μ l trietil-amin hozzáadása után hagyjuk az elegyet szobahőmérsékletre melegedni. Ezután 10 ml dietil-éterrel higitjuk, több alkalommal vízzel és telített vizes nátrium-klorid-oldattal mossuk és magnézium-szulfáton szárítjuk. Szűrés és vizsugárral létesített vákuumban való bepárlás után 155 mg (553 μ mol, 93 %) cím szerinti vegyületet kapunk halványsárga olaj alakjában.

IR (film): 2950, 2930, 2870, 2720, 1735, 1715, 1450, 1435, 1245, 1215, 1195, 1160, 1010, 990, 970 és 895 cm^{-1} .

39. példa

(4R,5S(5Z),6S(1E,3S),1S)-7-[4-Fenil-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(4R,5S(5Z),6S(1E,3R),1S)-7-[4-fenil-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (B)

44 mg (100 μ mol) 39a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 40 mg (91 μ mol, 91 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 2950, 2930, 2860, 1730, 1600, 1450, 1435, 1265, 995, 970, 895, 735 és 700 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás során 20 mg (45 μ mol, 45 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendel-

jük, és 17 mg (39 μ mol, 39 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

39a) példa

(4R,5S(5Z),6S(1E),1S)-7-[4-Fenil-6-(3-oxo-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

43 mg (126 μ mol) 39b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően, dimetil-(2-oxo-heptil)-foszfonát alkalmazásával reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 44 mg (100 μ mol, 80 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3060, 3000, 2950, 2930, 2870, 1735, 1690, 1670, 1625, 1600, 1500, 1450, 1435, 1245, 1195, 1170, 1045, 995, 975, 900, 760 és 700 cm^{-1} .

39b) példa

(4R,5S(5Z),6S,1S)-7-(4-Fenil-6-formil-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il)-5-hepténsav-metil-észter

93 mg (270 μ mol) 5a) példa szerint előállított alkoholt a 38b) példában leírt módon oxidálunk, és feldolgozás és tisztítás után 86 mg (251 μ mol, 93 %) cím szerinti vegyületet különítünk el.

IR (film): 3060, 3030, 2940, 2870, 2720, 1735, 1600, 1500, 1450, 1435, 1245, 1165, 1015, 1000, 895, 765 és 700 cm^{-1} .

40. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-Benzil-6-(3-hidroxi-
-1-oktenil)-2-oxabiciklo [2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav-
-metil-észter (A) és

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-benzil-6-(3-hidroxi-
-1-oktenil)-2-oxabiciklo [2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav-me-
til-észter (B)

55 mg (121 μ mol) 40a) példa szerint előállított
ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és
feldolgozás és tisztítás után 51 mg (112 μ mol, 93 %) szinte-
len olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.
IR (film): 3600-3300, 3060, 3030, 2950, 2920, 2860, 1735,
1600, 1450, 1435, 1245, 1150, 1015, 995, 965,
895, 765 és 705 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 27,7 mg
(61 μ mol, 50 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerke-
zetet rendeljük, és 21,2 mg (47 μ mol, 39 %) poláros alkoholt
különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

40a) példa

(4S,5R(5Z),6R(1E),1R)-7-[4-Benzil-6-(3-oxo-1-okte-
nil)-2-oxabiciklo [2.2.1]heptán-5-ill-2-hepténsav-metil-észter

49 mg (137 μ mol) 40b) példa szerint előállított al-
dehydet a 23a) példában leírt módon, dimetil-(2-oxo-heptil)-
-foszfonát alkalmazásával reagáltatunk, és feldolgozás és
tisztítás után 55 mg (121 μ mol, 88 %) cím szerinti vegyüle-
tet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3060, 3030, 2950, 2930, 2860, 1735, 1690, 1670, 1620, 1450, 1245, 1160, 995, 900, 765 és 705 cm^{-1} .

40b) példa

(4S,5R(5Z),6R,1R)-7-(4-Benzil-6-formil-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-il)-5-hepténsav-metil-észter

100 mg (279 μmol) 7a) példa szerint előállított alkoholt a 38b) példában leírt módon oxidálunk, és feldolgozás és tisztítás után 98 mg (275 μmol , 99 %) cím szerinti vegyületet kapunk halványsárga olaj alakjában.

IR (film): 3060, 2950, 2720, 1765, 1715, 1600, 1450, 1435, 1245, 1160, 1010, 995, 895, 760 és 700 cm^{-1} .

41. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-(p-Fenil-benzil)-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(4S,5R(5Z),6R,(1E,3S),1R)-7-[4-(p-fenil-benzil)-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (B)

44 mg (83 μmol) 41a) példa szerint előállított tetraol ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 43 mg (81 μmol , 98 %) színtelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3060, 3030, 2930, 2870, 1735, 1600,
1455, 1200, 1110, 1010, 895, 850, 740 és 700 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 23 mg (43 μmol , 52 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 19 mg (36 μmol , 43 %) poláros alkoholt kapunk, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

41a) példa

(4S,5R(5Z),6R(1E),1R)-7-[4-(p-Fenil-benzil)-6-(3-oxo-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

43 mg (99 μmol) 41b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően, dimetil-(2-oxo-heptil)-foszfonát alkalmazásával reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 44 mg (83 μmol , 84 %) cím szerinti vegyületet kapunk kristályos szilárd anyag formájában. Op.: 75-76°C.

41b) példa

(4S,5R(5Z),6R,1S)-7-[4-(p-Fenil-benzil)-6-formil-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

103 mg (237 μmol) 9a) példa szerint előállított alkoholt a 38b) példában leírt módon oxidálunk, és feldolgozás és tisztítás után 87 mg (201 μmol , 85 %) cím szerinti vegyületet kapunk gyantászerű szilárd anyag alakjában.

IR (film): 3070, 3050, 3020, 2920, 2860, 2720, 1735, 1715,
1600, 1490, 1440, 1005, 895, 770, 740 és 700 cm^{-1} .

42. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-(2-fenil-etil)-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

33,7 mg (72 μ mol) 42a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 30 mg (64 μ mol, 89 %) színtelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3080, 3060, 3020, 3000, 2930, 2860, 1735, 1600, 1450, 1435, 1245, 1200, 1155, 1025, 1015, 970, 895, 755 és 700 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 14 mg (30 μ mol, 41 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 13 mg (28 μ mol, 39 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

42a) példa

(4S,5R(5Z),6R(1E),1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(3-oxo-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

52 mg (140 μ mol) 27a) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően, dimetil-(2-oxo-heptil)-foszfonát alkalmazásával reagáltatunk, és fel-

dolgozás és tisztítás után 33,7 mg ($72 \mu\text{mol}$, 52 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3020, 3000, 2950, 2920, 2860, 1735, 1690, 1670, 1620, 1450, 1435, 1245, 1170, 980, 900, 755 és 700 cm^{-1} .

43. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-hepténsav-metil-észter (A) és

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-(p-fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (B)

52 mg ($114 \mu\text{mol}$) 43a) példa szerint előállított teilitlen ketont a 23. példában leírt módon redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 49 mg ($107 \mu\text{mol}$, 94 %) szintelen olajat kapunk, amely a cím szerinti két vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3000, 2950, 2930, 2860, 1735, 1600, 1510, 1230, 1160, 995, 970, 895, 830 és 735 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 26 mg ($57 \mu\text{mol}$, 50 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 20 mg ($44 \mu\text{mol}$, 38 %) poláros alkoholt kapunk, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

43a) példa

(4S,5R(5Z),6R(1E),1R)-6-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(3-oxo-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

46 mg (128 μmol) 31b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően, dimetil-(2-oxo-heptil)-foszfonát alkalmazásával reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 52 mg (114 μmol , 89 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3000, 2950, 2930, 2860, 1735, 1690, 1670, 1620, 1510, 1435, 1230, 1160, 995, 975, 900 és 835 cm^{-1} .

44. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-Metil-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav

17,5 mg (46 μmol) 38. példa szerint előállított nempoláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 15,7 mg (43 μmol , 94 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 2970, 2930, 2870, 1710, 1460, 1240, 1025, 970 és 890 cm^{-1} .

45. példa

(4R,5S(5Z),6S(1E,3S),1R)-7-[4-Fenil-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav

20 mg (45 μmol) 39. példa szerint előállított nempoláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 19 mg (45 μmol , 95 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2300, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1710, 1605, 1500, 1450, 1240, 1195, 1045, 995, 970, 890, 760 és 700 cm^{-1} .

46. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-Benzil-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

27,7 mg ($61 \mu\text{mol}$) 40. példa szerint előállított nempoláros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 26 mg ($59 \mu\text{mol}$, 97 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3090, 3070, 3030, 2940, 2870, 1710, 1605, 1455, 1245, 995, 970, 895, 765 és 705 cm^{-1} .

47. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-(p-Fenil-benzil)-6-(3-hidroxi-2-oktenil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

23 mg ($43 \mu\text{mol}$) 41. példa szerint előállított nempoláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 19,7 mg ($38 \mu\text{mol}$, 89 %) cím szerinti vegyületet kapunk kristályos szilárd anyagként.

IR (KBr): 3600-2200, 3010, 2930, 2870, 2850, 1690, 1600, 1490, 1265, 1200, 890, 765, 735 és 690 cm^{-1} .

48. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il)-5-hepténsav

14 mg (30 μ mol) 42. példa szerint előállított nem-poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 13 mg (29 μ mol, 95 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában. IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3020, 3000, 2930, 2860, 1725, 1710, 1605, 1455, 1240, 1115, 1030, 970, 890, 755 és 700 cm^{-1} .

49. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav

26 mg (57 μ mol) 43. példa szerint előállított nem-poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 21 mg (47 μ mol, 83 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként. IR (film): 3600-2400, 3060, 3040, 3000, 2950, 2930, 2860, 1710, 1610, 1515, 1235, 1160, 995, 970, 895, 835 és 585 cm^{-1} .

50. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-Metil-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav

14,7 mg (39 μ mol) 38. példa szerint előállított

poláros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 11,8 mg (32 μmol , 83 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában. IR (film): 3600-2400, 2960, 2930, 2870, 1730, 1710, 1460, 1240, 1025, 970 és 890 cm^{-1} .

51. példa

(4R,5S(5Z),6S(1E,3R),1S)-8-[4-Fenil-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

17 mg (39 μmol) 39. példa szerint előállított nem-poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 16 mg (38 μmol , 96 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3000, 2950, 2930, 2860, 1710, 1605, 1500, 1450, 1295, 1240, 1195, 1045, 995, 970, 890, 760 és 700 cm^{-1} .

52. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-Benzil-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

21,2 mg (47 μmol) 40. példa szerint előállított poláros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 19 mg (43 μmol , 92 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3090, 3070, 3030, 2930, 2870, 1730, 1710, 1605, 1455, 1245, 995, 970, 890, 765 és 705 cm^{-1} .

53. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-(p-Fenil-benzil)-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav

19 mg (36 μ mol) 41. példa szerint előállított poláros észter a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 14,6 mg (28 μ mol, 78 %) cím szerinti vegyületet kapunk kristályos szilárd anyag alakjában.

IR (KBr): 3600-2200, 3010, 2960, 2930, 2880, 2850, 1695, 1600, 1490, 1460, 1250, 1135, 1055, 1005, 970, 890, 770, 735 és 695 cm^{-1} .

54. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav

13 mg (28 μ mol) 42. példa szerint előállított poláros észter a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 11 mg (24 μ mol, 86 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2860, 1725, 1710, 1605, 1455, 1260, 1240, 1030, 970, 890, 755 és 700 cm^{-1} .

55. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav

20 mg ($44 \mu\text{mol}$) 43. példa szerint előállított poláros észter a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 18 mg ($40 \mu\text{mol}$, 92 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2500, 3040, 3000, 2950, 2930, 2860, 1710, 1610, 1515, 1235, 1160, 995, 970, 895, 835 és 585 cm^{-1} .

56. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R,4RS),1R)-7-[4-(4-Metil-6-(3-hidroxi-4-metil-6-in-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S,4RS),1R)-7-[4-metil-6-(3-hidroxi-4-metil-6-in-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (B)

53 mg ($137 \mu\text{mol}$) 56a) példa szerint előállított tetraacetil ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 52 mg ($134 \mu\text{mol}$, 98 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 2950, 2920, 2870, 1735, 1450, 1435, 1245, 1160, 1020, 970 és 890 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 28 mg ($72 \mu\text{mol}$, 53 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 22 mg ($57 \mu\text{mol}$, 41 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

56a) példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,4RS),1R)-7-[4-Metil-6-(3-oxo-4-metil-6-in-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

50 mg (178 μmol) 38b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően, racém dimetil-(2-oxo-3-metil-hept-5-inil)-foszfonát alkalmazásával reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 53 mg (137 μmol , 77 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 2950, 2930, 2870, 1735, 1690, 1665, 1620, 1450, 1435, 1370, 1215, 1195, 1160, 1025, 975 és 895 cm^{-1} .

57. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R,4RS),1R)-7-[4-(p-Fenil-benzil)-6-(3-hidroxi-4-metil-6-in-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S,4RS),1R)-7-[4-(p-fenil-benzil)-6-(3-hidroxi-4-metil-6-in-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (B)

44 mg (82 μmol) 57a) példa szerint előállított területlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 43 mg (80 μmol , 97 %) terméket kapunk, amely a cím szerinti két vegyület keveréke.

IR (KBr): 3600-3200, 3010, 2960, 2930, 2870, 1735, 1600, 1490, 1245, 1120, 970, 895, 770, 735 és 695 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 24,6 mg (45 μmol , 55 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük és 17 mg (31 μmol , 38 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

57a) példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,4RS),1R)-7-[4-(p-Fenil-benzil)-6-(3-oxo-4-metil-6-in-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

43 mg (99 μmol) 41b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk racém dimetil-(2-oxo-3-metil-hept-5-inil)-foszfonát alkalmazásával, és feldolgozás és tisztítás után 45 mg (84 μmol , 84 %) cím szerinti vegyületet különítünk el.
Op.: 82-83°C.

58. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,4R,4RS),1R)-7-[4-Metil-6-(3-hidrox-4-metil-6-in-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav

28 mg (72 μmol) 56. példa szerint előállított nempoláros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszap-panositunk, és feldolgozás és tisztítás után 23,6 mg (63 μmol , 88 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 2960, 2930, 2870, 1730, 1710, 1455, 1240, 1020, 970 és 890 cm^{-1} .

59. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R,4RS),1R)-7-[4-p-Fenil-benzil)-
-6-(3-hidroxi-4-metil-6-in-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]-
heptán-5-ill]-5-hepténsav

24,6 mg (45 μ mol) 57. példa szerint előállított
nempoláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosí-
tunk, és feldolgozás és tisztítás után 20 mg (38 μ mol, 84 %)
cim szerinti vegyületet különítünk el kristályos szilárd
anyag formájában.

IR (KBr): 3600-2200, 3080, 3060, 3030, 2970, 1730, 1710,
1605, 1490, 1450, 1410, 1245, 1010, 995, 970,
890, 850, 770, 740 és 700 cm^{-1} .

60. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S,4RS),1R)-7-[4-Metil-6-(3-hidroxi-
-4-metil-6-in-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-
-hepténsav

22 mg (57 μ mol) 56. példa szerint előállított po-
láros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappa-
nosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 20 mg (53 μ mol,
94 %) cim szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 2960, 2930, 2870, 1730, 1710, 1455,
1240, 1020, 970 és 885 cm^{-1} .

61. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S,4RS),1R)-7-[4-(p-Fenil-benzil)-
-6-(3-hidroxi-4-metil-6-in-1-oktenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]-
heptán-5-ill]-5-hepténsav

17 mg (31 μ mol) 57. példa szerint előállított poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12,4 mg (24 μ mol, 76 %) cím szerinti vegyületet különítünk el kristályos szilárd anyag alakjában.

IR (KBr): 3600-2200, 3080, 3060, 3030, 2960, 2920, 1725, 1705, 1600, 1490, 1450, 1410, 1295, 1010, 995, 920, 890, 845, 765, 740 és 700 cm^{-1} .

62. példa

(4R,5S(5Z),6R,1S)-7-[4-Fenil-6-(N-morfolino-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

22 mg (54 μ mol) 62a) példa szerint előállított bromidot a 63. példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 15 mg (36 μ mol, 67 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2950, 2870, 2810, 1735, 1670, 1600, 1440, 1225, 995, 895, 865 és 695 cm^{-1} .

62a) példa

(4R,5S(5Z),6S,1S)-7-[4-Fenil-6-(bróm-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

100 mg (290 μ mol) 5a) példa szerint előállított alkoholt a 63a) példában leírtaknak megfelelően brómozunk, és feldolgozás és tisztítás után 116 mg (285 μ mol, 98 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2950, 2930, 2870, 1735,
1600, 1450, 1435, 1225, 1165, 995, 895, 765, 740,
705 és 640 cm^{-1} .

63. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Benzil-6-(N-morfolino-metil)-
-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

17 mg (40 μmol) 63a) példa szerint előállított
bromidhoz 215 μl morfolint adunk, és az elegyet száraz argon
atmoszférában 3 órán át 100°C -on melegítjük. Lehűlés után
10 ml dietil-éterrel hígítjuk, több alkalommal vízzel mossuk,
a szerves fázist magnézium-szulfáton szárítjuk, szűrjük és
az oldószert vizsugárral előállított vákuumban lepároljuk.
Ily módon 14,2 mg (33 μmol , 83 %) cím szerinti vegyületet kü-
lönítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3060, 3030, 3000, 2950, 2930, 2870, 2815, 1730,
1670, 1605, 1440, 1225, 1000, 895, 865 és 695 cm^{-1} .

63a) példa

(4S,5R(5Z),6R,1R)-7-[4-Benzil-6-(bróm-metil)-2-oxa-
bicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

66 mg (184 μmol) 7a) példa szerint előállított al-
kohol 1,4 ml vízmentes acetonitrillel készült oldatához
305 mg tetrabróm-metánt, 120 μl kollidint, 241 mg trifenil-
-foszfint adunk, és 9 órán át száraz argon atmoszférában
 23°C -on keverjük az elegyet. Ezután 8 ml dietil-éterrel hígít-
juk, jéghideg vízzel mossuk, a szerves fázist magnézium-szul-
fáton szárítjuk, szűrjük és vizsugárral létesített vákuumban

szárazra pároljuk. A maradékot kb. 35 ml kovasavgélen kromatografáljuk. Futtatószerként n-hexán és etil-acetát gradienselegyét használjuk. Ily módon 77 mg (183 μ mol, 99 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3020, 3000, 2950, 2930, 2860, 1735, 1605, 1450, 1435, 1220, 1165, 1015, 995, 895, 765, 735, 705 és 635 cm^{-1} .

64. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(Fenil-acetilén)-6-(N-morfolino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

16 mg (37 μ mol) 64a) példa szerint előállított bromidot a 63. példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 14,5 mg (33 μ mol, 90 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3060, 3030, 3000, 2950, 2860, 2810, 2230, 1730, 1670, 1600, 1440, 1220, 1110, 1000, 890, 865 és 690 cm^{-1} .

64a) példa

(4S,5R(5Z),6R,1R)-7-[4-(Fenil-acetilén)-6-(bróm-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

25 mg (68 μ mol) 13a) példa szerint előállított alkoholt a 63a) példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 16,3 mg (38 μ mol, 56 %) cím szerinti

vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (CHCl_3): 3080, 3060, 3020, 3000, 2950, 2880, 2230, 1725,
1600, 1490, 1435, 1300, 1220, 1165, 995, 895,
690 és 645 cm^{-1} .

65. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(N-morfo-
lino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-
-metil-észter

22 mg ($51\text{ }\mu\text{mol}$) 65a) példa szerint előállított
bromidot a 63. példában leírt módon reagáltatunk, és feldol-
gozás és tisztítás után 20,6 mg ($47\text{ }\mu\text{mol}$, 91 %) cím szerinti
vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2950, 2870, $\overset{2810}{\vee}1735$, 1665,
1600, 1440, 1220, 995, 895, 865 és 700 cm^{-1} .

65a) példa

(4S,5R(5Z),6R,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(bróm-
-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-
-észter

98 mg ($263\text{ }\mu\text{mol}$) 15a) példa szerint előállított al-
koholt a 63a) példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgo-
zás és tisztítás után 101 mg ($232\text{ }\mu\text{mol}$, 88 %) cím szerinti
vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2950, 2930, 2860, 1735,
1605, 1450, 1435, 1245, 1220, 1165, 1025, 980,
900, 750, 700 és 635 cm^{-1} .

66. példa

(4R,5S(5Z),6R,1S)-7-[4-Fenil-6-(N-morfolino-metil)-
-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav

15 mg (36 μmol) 62. példa szerint előállított ész-
tert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldol-
gozás és tisztítás után 14 mg (35 μmol , 97 %) cím szerinti
vegyületet kapunk szintelen szilárd anyag alakjában.

IR (KBr): 3600-3200, 3080, 3060, 3030, 3000, 2950, 2920,
2870, 2700-2300, 2100-1850, 1710, 1600, 1500,
1460, 1445, 1200, 1115, 1025, 1005, 900, 870,
760 és 700 cm^{-1} .

67. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Benzil-6-(N-morfolino-metil)-
-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-ill]-hepténsav

14,2 mg (33 μmol) 63. példa szerint előállított
észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és fel-
dolgozás és tisztítás után 10 mg (24 μmol , 73 %) cím szerinti
vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2300, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870,
2810, 1720, 1605, 1495, 1455, 1265, 1245, 1120,
1005, 895, 870, 765 és 705 cm^{-1} .

68. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(Fenil-acetilén)-6-(N-mor-
folino-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav

14,5 mg (33 μmol) 64. példa szerint előállított
észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és fel-

dolgozás és tisztítás után 11,5 mg ($27\text{ }\mu\text{mol}$, 82 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 2930, 2880, 2860, 2810, 2240, 1720, 1600, 1490, 1460, 1445, 1140, 1120, 1005, 895, 870 és 695 cm^{-1} .

69. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(N-morfolino-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

20,6 mg ($47\text{ }\mu\text{mol}$) 65. példa szerint előállított vegyületet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 16,5 mg ($39\text{ }\mu\text{mol}$, 82 %) cím szerinti vegyületet kapunk kristályos anyag formájában.

IR (KBr): 3600-2300, 3090, 3060, 3010, 2930, 2860, 1710, 1605, 1500, 1455, 1230, 1120, 1010, 890, 870 és 705 cm^{-1} .

70. példa

4R,5S(5Z),6R,1S)-7-[4-Fenil-6-(1-imidazolil-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

26 mg ($64\text{ }\mu\text{mol}$) 62a) példa szerint előállított bromidot a 63. példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 15 mg ($38\text{ }\mu\text{mol}$, 59 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3110, 3060, 3020, 3000, 2950, 2880, 1735, 1600,
1510, 1450, 1300, 1235, 1110, 1080, 1005, 900,
750, 700 és 665 cm^{-1} .

71. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-8-[4-Benzil-6-(1-imidazolil-metil)-
-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

15 mg (36 μmol) 63a) példa szerint előállított
bromidot a 63. példában leírt módon, imidazol felhasználásával
reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 9,2 mg
(23 μmol , 64 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szin-
telen olaj alakjában.

IR (film): 3115, 3060, 3030, 3000, 2940, 2870, 1735, 1605,
1510, 1455, 1235, 1110, 1085, 1000, 900, 760,
705 és 660 cm^{-1} .

72. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(1-imidazo-
lil-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-me-
til-észter

19 mg (44 μmol) 65a) példa szerint előállított bromi-
dot a 63. példában leírtaknak megfelelően, imidazol alkalma-
zásával reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 18 mg
(43 μmol , 97 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szin-
telen olaj alakjában.

IR (film): 3110, 3080, 3060, 3030, 2970, 2930, 2870, 2735,
1605, 1455, 1320, 1295, 1235, 1110, 1075, 1010,
895, 750, 700 és 660 cm^{-1} .

73. példa

(4R,5S(5Z),6R,1S)-7-[4-Fenil-6-(1-imidazolil-metil)-
-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav

15 mg (38 μ mol) 70. példa szerint előállított ész-
tert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk,
és feldolgozás és tisztítás után 11 mg (29 μ mol, 76 %) cím
szerinti vegyületet különítünk el szintelen szilárd anyagként.

IR (KBr): 3600-3200, 3110, 3060, 3020, 3000, 2940, 2880,
2700-2200, 2100-1800, 1700, 1600, 1500, 1445, 1315,
1290, 1235, 1110, 1085, 1025, 1005, 900, 760, 750,
700 és 665 cm^{-1} .

74. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Benzil-6-(1-imidazolil-metil)-
-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav

9,2 mg (23 μ mol) 71. példa szerint előállított ész-
tert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk,
és feldolgozás és tisztítás után 6,5 mg (16 μ mol, 70 %) cím
szerinti vegyülethez jutunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2300, 3120, 3060, 3030, 3000, 2930, 2860,
1710, 1605, 1510, 1455, 1235, 1110, 1085, 1005,
900, 760, 705 és 660 cm^{-1} .

75. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(1-imidazolil-
-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav

18 mg (43 μ mol) 72. példa szerint előállított ve-
gyületet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosí-

tunk, és feldolgozás és tisztítás után 13,3 mg (33 μmol , 76 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (KBr): 3600-3000, 3100, 3080, 3060, 3020, 2970, 2920, 2870, 2700-2200, 2100-1800, 1700, 1600, 1455, 1320, 1290, 1255, 1235, 1110, 1080, 1030, 1010, 890, 750, 700, 660 és 630 cm^{-1} .

76. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S,4S),1R)-7-[4-Benzil-6-(3-hidroxi-4-metil-6-in-1-nonenil)-2-oxabiciklo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R,4S),1R)-7-[4-benzil-6-(3-hidroxi-4-metil-6-in-1-nonenil)-2-oxabiciklo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (B)

53 mg (111 μmol) 76a) pllda szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 51 mg (107 μmol , 96 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3080, 3060, 3030, 2970, 2920, 2870, 1735, 1600, 1450, 1435, 1245, 1155, 1015, 995, 970, 895, 765 és 705 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 33 mg (69 μmol , 62 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az (A) szerkezetet rendeljük, valamint 15,5 mg (32 μmol , 29 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a (B) szerkezetet rendeljük.

76a) példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,4S),1R)-7-[4-Benzil-6-(3-oxo-4-metil-6-in-1-nonenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

49 mg (137 μ mol) 40b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-3S-metil-okt-5-inil)-foszfonát alkalmazásával reagáltattunk, és feldolgozás és tisztítás után 53 mg (111 μ mol, 81 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 2970, 2930, 2870, 1735, 1690, 1665, 1620, 1450, 1435, 1245, 1165, 995, 895, 765 és 705 cm^{-1} .

77. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R,4S),1R)-7-[4-Benzil-6-(3-hidrox-4-metil-6-in-1-nonenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav

33 mg (69 μ mol) 76. példa szerint előállított nem-poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítottunk, és feldolgozás és tisztítás után 32 mg (68 μ mol, 99 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3090, 3060, 3030, 2980, 2880, 1710, 1605, 1495, 1455, 1245, 995, 970, 890, 765 és 705 cm^{-1} .

78. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S,4S),1R)-7-[4-Benzil-6-(3-hidrox-4-metil-6-in-1-nonenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav

15,5 mg (32 μ mol) 76. példa szerint előállított poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 14 mg (30 μ mol, 94 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3090, 3070, 3030, 2980, 2940, 2880, 1730, 1710, 1670, 1605, 1495, 1455, 1250, 1100, 1015, 995, 970, 890, 765 és 705 cm^{-1} .

79. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-[[2-(fenil-amino-karbonil)-hidroazinol-metil]-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

17,4 mg (47 μ mol) 27a) példa szerint előállított aldehidet a 26. példában leírtaknak megfelelően, 4-fenil-szemikarbazid alkalmazásával reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 21,3 mg (42 μ mol, 90 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3370, 3200, 3140-3040, 3030, 2940, 2860, 1730, 1690, 1595, 1530, 1445, 1230, 1030, 980, 895, 755, 735 és 695 cm^{-1} .

80. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-[[2-(fenil-amino-karbonil)-hidrazinol-metil]-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav

21,3 mg (47 μ mol) 79. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk,

és feldolgozás és tisztítás után 18 mg ($37\text{ }\mu\text{mol}$, 78 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3500-2300, 3380, 3200, 3090, 3060, 3030, 3010, 2940, 2870, 1700, 1660, 1595, 1540, 1500, 1450, 1235, 900, 755 és 695 cm^{-1} .

81. példa

(4R,5S(5Z),6R,1S)-7-[4-Fenil-6-(1-pirrolidino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav-pirrolidinamid

22 mg ($54\text{ }\mu\text{mol}$) 62a) példa szerint előállított bromidot a 63. példában leírtak szerint, pirrolidin alkalmazásával reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 19 mg ($44\text{ }\mu\text{mol}$, 81 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3060, 3030, 2950, 2880, 2600, 1630, 1450, 1260, 1005, 895, 765, 705, 665, 620 és 450 cm^{-1} .

82. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(N-pirrolidino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav-pirrolidinamid

18 mg ($41\text{ }\mu\text{mol}$) 65a) példa szerint előállított bromidot a 63. példában leírtaknak megfelelően, pirrolidin alkalmazásával reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 15 mg ($32\text{ }\mu\text{mol}$, 78 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 2930, 2870, 2780, 1640, 1605,
1435, 895, 755 és 700 cm^{-1} .

83. példa

(4R,5S(5Z),6S(1E,3S),1S)-7-[4-Fenil-6-[3-hidroxi-
-4-(p-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-
-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(4R,5S(5Z),6S(1E,3R),1S)-7-[4-fenil-6-[3-hidroxi-
-4-(p-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-
-ill-5-hepténsav-metil-észter (B)

21 mg (43 μmol) 83a) példa szerint előállított te-
litetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redu-
kálunk, és feldolgozás és tisztítás után 19 mg (38 μmol ,
89 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj
alakjában.

IR (film): 3600-3200, 3080, 3060, 3030, 3010, 2930, 2870,
1735, 1600, 1505, 1250, 1210, 1040, 1030, 895,
830, 760 és 700 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 7,5 mg
(15 μmol , 36 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerke-
zetet rendeljük, és 9 mg (18 μmol , 43 %) poláros alkoholt
különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

83a) példa

(4R,5S(5Z),6S(1E),1S)-7-[4-Fenil-6-[3-oxo-4-(p-
-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill-
-5-hepténsav-metil-észter

43 mg (125 μ mol) 39b) példa szerint előállított aldehidet a 84a) példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 21 mg (43 μ mol, 34 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3000, 2940, 2870, 1730, 1690, 1620, 1500, 1440, 1290, 1245, 1200, 1040, 1000, 895, 830, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

84. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-(2Fenil-etil)-6-[3-hidroxi-4-(p-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-(2-fenil-etil)-6-[3-hidroxi-4-(p-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (B)

40 mg (77 μ mol) 84a) példa szerint előállított tetraol ketont a 23a) példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 34 mg (65 μ mol, 85 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3080, 3060, 3020, 300, 2930, 2860, 1735, 1600, 1505, 1450, 1435, 1250, 1210, 1030, 975, 895, 830, 760 és 700 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 13 mg (25 μ mol, 32 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 18 mg (34 μ mol, 45 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

84a) példa

(4S,5R(5Z),6R(1E),1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-[3-oxo-4-(p-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

7,6 mg vízmentes litium-klorid 500 μ l vízmentes acetonitrillel készült oldatához száraz argon atmoszférában 47 mg dimetil-[2-oxo-3-(p-fluor-fenoxi)-propil]-foszfonát 500 μ l vízmentes acetonitrillel készült oldatát csepegtetjük, 20 μ l DBU-t, majd 55 mg (148 μ mol) 27a) példa szerint előállított aldehid 250 μ l acetonitrillel készült oldatát adjuk hozzá és az elegyet 23°C-on 4-5 órán át keverjük. Ezután 10 ml dietil-éterrel hígítjuk, 10 %-os ammónium-klorid-oldattal, vízzel és telített vizes nátrium-klorid-oldattal semlegesre mossuk, magnézium-szulfáton szárítjuk és szűrés és vizsugárral létesített vákuumban való bepárlás után a kapott maradékot két analitikai kovasavgél-lemezen kromatografáljuk. Futtatóelegyként kloroform és dietil-éter elegyét használjuk, eluálószerként etil-acetátot alkalmazunk. Ily módon 40 mg (77 μ mol, 52 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 3940, 2870, 1735, 1690, 1620, 1505, 1450, 1435, 1245, 1210, 1155, 1035, 980, 895, 830, 760, 730, és 700 cm^{-1} .

85. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-[3-hidroxi-4-(p-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-(p-fluor-fenil)-6-
- [3-hidroxi-4-(p-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabicyclo [2,2,1]-
heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (B)

39 mg (76 μ mol) 85a) példa szerint előállított te-
litetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redu-
kálunk, és feldolgozás és tisztítás után 37 mg (72 μ mol,
95 %) szintelen olajat kapunk, amely a cím szerinti két ve-
gyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3000, 2970, 2940, 2870, 1730,
1600, 1505, 1245, 1220, 1160, 1035, 895, 830,
760 és 735 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 15 mg
(29 μ mol, 38 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkeze-
tet rendeljük, és 19 mg (37 μ mol, 49 %) poláros alkoholt kü-
lönítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

85a) példa

(4S,5R(5Z),6R(1E),1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-[3-
-oxo-4-(p-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabicyclo [2,2,1]heptán-
-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

54 mg (150 μ mol) 31b) példa szerint előállított
aldehidet a 84a) példában leírt módon, dimetil-[2-oxo-3-(p-
-fluor-fenoxi)-propil]-foszfonát alkalmazásával reagálta-
tunk, és feldolgozás és tisztítás után 39 mg (76 μ mol, 51 %)
cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3010, 2940, 2870, 1730, 1715, 1690, 1620, 1505,
1435, 1220, 1200, 1160, 900 és 830 cm^{-1} .

86. példa

(4R,5S(5Z),6S(1E,3R),1S)-7-[4-Fenil-6-[3-hidroxi-4-(p-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabiciklo[2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav

9 mg (18 μ mol) 83. példa szerint előállított poláros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 7 mg (15 μ mol, 81 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3010, 2930, 2870, 1710, 1600, 1505, 1250, 1210, 1035, 890, 830, 760 és 700 cm^{-1} .

87. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-[3-hidroxi-4-(p-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabiciklo[2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav

13 mg (25 μ mol) 84. példa szerint előállított nem-poláros vegyületet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12 mg (24 μ mol, 95 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2200, 3030, 3010, 2930, 2870, 1725, 1710, 1605, 1505, 1250, 1210, 1030, 975, 890, 830, 760 és 700 cm^{-1} .

88. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-[3-hidroxi-4-(p-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabiciklo[2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

14 mg (27 μ mol) 85. példa szerint előállított nem-poláros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12 mg (24 μ mol, 88%) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2500, 3070, 3050, 3000, 2930, 2880, 1710, 1610, 1600, 1505, 1295, 1220, 1160, 1035, 895, 830, 760, 585 és 510 cm^{-1} .

89. példa

(4R,5S(5Z),6S(1E,3S),1S)-7-[4-Fenil-6-[3-hidroxi-4-(p-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

7,5 mg (15 μ mol) 83. példa szerint előállított nem-poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 7 mg (15 μ mol, 96 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3010, 2930, 2880, 1710, 1600, 1505, 1250, 1210, 1040, 1030, 890, 830, 760 és 700 cm^{-1} .

90. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3S),1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-[3-hidroxi-4-(p-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

18 mg (34 μ mol) 84. példa szerint előállított poláros vegyületet elszappanosítunk a 2. példában leírtaknak meg-

felelően, és feldolgozás és tisztítás után 16 mg (31 μmol , 91 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1725, 1710, 1505, 1455, 1250, 1210, 1030, 975, 890, 830, 760 és 700 cm^{-1} .

91. példa

(4S,5R(5Z),6R(1E,3R),1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-[3-hidroxi-4-(p-fluor-fenoxi)-1-butenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]-heptán-5-yl]-5-hepténsav

19 mg (37 μmol) 85. példa szerint előállított poláros észter a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 18 mg (36 μmol , 97 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2500, 3080, 3030, 3010, 2980, 2940, 2880, 1710, 1610, 1605, 1510, 1460, 1300, 1225, 1165, 1040, 970, 895, 830, 760, 590 és 515 cm^{-1} .

92. példa

(4R,5S(5Z),6R,1S)-7-[4-Fenil-6-(1-piperidino-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

21 mg (52 μmol) 62a) példa szerint előállított bromidot a 63. példában leírtaknak megfelelően, piperidin alkalmazásával reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 20 mg (49 μmol , 94 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2860, 1735, 1605, 1500, 1450, 1400, 1040, 895, 760 és 700 cm^{-1} .

93. példa

(4R,5S(5Z),6R,1S)-7-[4-Fenil-6-(1-piperidino-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

20 mg (52 μmol) 92. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 15 mg (38 μmol , 78 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2300, 3440, 3080, 3060, 3000, 2930, 2870, 1715, 1630, 1605, 1500, 1450, 1400, 1035, 895, 760 és 700 cm^{-1} .

94. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(m-nitro-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil (illetve m-nitro-benzil)-észter

18,7 mg (50 μmol) 15a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon m-nitro-benzil-kloriddal éterezünk, és feldolgozás és tisztítás után 20 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3020, 3000, 2930, 2860, 1735, 1600, 1530, 1350, 1100, 895, 810, 730 és 700 cm^{-1} .

95. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(m-nitro-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

20 mg 94. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 13 mg (26 μmol , a 94. példa szerinti kiindulási anyagra vonatkoztatva 53 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3020, 3000, 2930, 2860, 1730, 1705, 1600, 1530, 1120, 1095, 890, 805, 730 és 700 cm^{-1} .

96. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(o-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil (illetve o-fluor-benzil)-észter

19 mg (51 μmol) 15a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon o-fluor-benzil-kloriddal éterezünk, és feldolgozás és tisztítás után 27 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1735, 1620, 1605, 1585, 1490, 1455, 1230, 1120, 1085, 895, 760 és 700 cm^{-1} .

97. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(o-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav

27 mg 96. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és

feldolgozás és tisztítás után 18 mg (39 μ mol, a 96. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 76 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2500, 3080, 3060, 3020, 3000, 2930, 2860, 1730, 1710, 1620, 1600, 1585, 1490, 1455, 1230, 1115, 1085, 890, 760 és 700 cm^{-1} .

98. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(m-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav-metil (illetve m-fluor-benzil)-észter

18 mg (48 μ mol) 15a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon m-fluor-benzil-kloriddal éterezünk, és feldolgozás és tisztítás után 24 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3080, 3060, 3020, 3000, 2930, 2860, 1735, 1615, 1590, 1485, 1450, 1255, 1140, 895, 785, 750, 700 és 685 cm^{-1} .

99. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(m-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-il]-5-hepténsav

24 mg 98. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 17 mg (36 μ mol, a 98. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 75 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3020, 3000, 2930, 2860, 1725, 1710, 1615, 1590, 1485, 1450, 1250, 890, 785, 745, 700 és 685 cm^{-1} .

100. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(p-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-heptén-sav-metil (illetve p-fluor-benzil)-észter

19 mg (50 μmol) 15a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon p-fluor-benzil-kloriddal éterezünk, és feldolgozás és tisztítás után 21 mg cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olajként.

IR (film): 3080, 3060, 3020, 3000, 2930, 2860, 1735, 1605, 1510, 1220, 1150, 895, 825, 755 és 700 cm^{-1} .

101. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(p-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]heptán-5-yl]-5-heptén-sav-metil (illetve p-fluor-benzil)-észter

18 mg (50 μmol) 17. példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 26 mg cím szerinti vegyületet kapunk színtelen olaj formájában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2940, 2860, 1735, 1605, 1510, 1225, 1145, 895, 820, 760 és 705 cm^{-1} .

102. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Fenil-6-(p-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil (illetve p-fluor-benzil)-észter

11,2 mg (33 μ mol) 3a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 10 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3020, 3000, 2950, 2860, 1735, 1605, 1510, 1220, 1145, 900, 825, 760 és 700 cm^{-1} .

103. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(p-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav

21 mg 100. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 16 mg (34 μ mol, a 100. példa szerinti kiindulási anyagra vonatkoztatva 68 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3020, 3000, 2930, 2860, 1730, 1710, 1605, 1510, 1455, 1220, 1090, 890, 825, 755 és 700 cm^{-1} .

104. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(p-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav

26 mg 101. példa szerint előállított észterelegyet

a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 21 mg ($46 \mu\text{mol}$, a 101. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 92 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2500, 3070, 3040, 3000, 2930, 2870, 1725, 1710, 1600, 1510, 1220, 1160, 1090, 890 és 830 cm^{-1} .

105. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-Fenil-6-(p-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav

10 mg 102. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 9 mg ($20 \mu\text{mol}$, a 102. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 59 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1730, 1705, 1600, 1510, 1220, 1115, 1090, 895, 760 és 700 cm^{-1} .

106. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-[m-(trifluor-metil)-benzil-oxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav-metil (illetve m-(trifluor-metil)-benzil)-észter

17 mg ($46 \mu\text{mol}$) 15a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon m-(trifluor-metil)-benzil-kloriddal éterezünk, és feldolgozás és tisztítás után 23 mg

cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2860, 1735, 1605, 1495, 1330, 1200, 1165, 1130, 1070, 890, 750, 700 és 665 cm^{-1} .

107. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-[m-(trifluor-metil)-benzil-oxi-metil]-2-oxabicyklo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav

23 mg 106. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 17 mg (33 μmol , a 106. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 72 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2500, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2860, 1730, 1710, 1605, 1455, 1330, 1195, 1165, 1125, 1075, 890, 800, 755, 700 és 660 cm^{-1} .

108. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-[p-(trifluor-metil)-benzil-oxi-metil]-2-oxabicyklo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil (illetve p-(trifluor-metil)-benzil)-észter

15 mg (40 μmol) 15a) példa szerinti előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően p-(trifluor-metil)-benzil-kloriddal éterezünk, és feldolgozás és tisztítás

tás után 28 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2860, 1735, 1620, 1605, 1330, 1160, 1130, 1065, 1015, 895, 820, 760 és 700 cm^{-1} .

109. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-[p-(trifluor-metil)-benzil-oxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav

28 mg 108. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 19 mg ($37 \mu\text{mol}$, a 108. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 91 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3090, 3060, 3030, 3010, 2940, 2860, 1730, 1710, 1620, 1605, 1330, 1165, 1125, 1065, 1020, 890, 825, 755 és 705 cm^{-1} .

110. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(p-klór-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil (illetve p-klór-benzil)-észter

18 mg ($48 \mu\text{mol}$) 15a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon p-klór-benzil-kloriddal éterezünk, és feldolgozás és tisztítás után 30 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2860, 1735, 1600, 1495, 1450, 1235, 890, 810, 760 és 700 cm^{-1} .

111. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(p-klór-benzil-oxi-metil)-2-oxabiciklo [2.2.1]heptán-5-ill-5-hepténsav

30 mg 110. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 18 mg ($37\text{ }\mu\text{mol}$, a 110. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 77 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2860, 1730, 1710, 1600, 1490, 1455, 1240, 1090, 1030, 890, 810, 755 és 700 cm^{-1} .

112. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(fenoxi-etil-oxi-metil)-2-oxabiciklo [2.2.1]heptán-5-il)-5-hepténsav-metil (illetve fenoxi-etil)-észter

17 mg ($46\text{ }\mu\text{mol}$) 15a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon 1-klór-2-fenoxi-etánnal éterezünk, és feldolgozás és tisztítás után 18 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1735, 1600, 1590, 1500, 1455, 1250, 1125, 890, 760, 700 és 690 cm^{-1} .

113. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(fenoxi-

-etil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-heptén-sav

18 mg 112. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 11 mg ($23 \mu\text{mol}$, a 112. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 50 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2500, 3080, 3060, 3030, 2930, 2870, 1730, 1710, 1600, 1585, 1495, 1455, 1245, 1130, 890, 755, 700 és 690 cm^{-1} .

114. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(N-anilino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

19 mg ($44 \mu\text{mol}$) 65a) példa szerint előállított bromidot a 63. példában leírt módon, anilin felhasználásával reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 17 mg ($38 \mu\text{mol}$, 87 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3440, 3300, 3080, 3060, 3020, 2930, 2860, 1730, 1600, 1505, 1320, 1250, 895, 750 és 695 cm^{-1} .

115. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(N-anilino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

17 mg ($38 \mu\text{mol}$) 114. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgo-

zás és tisztítás után 15 mg (35 μ mol, 91 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3400, 3600-2300, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2860, 1725, 1710, 1605, 1510, 1495, 1325, 1255, 980, 890, 750, 700 és 695 cm^{-1} .

116. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(p-fluor-N-anilino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

19 mg (44 μ mol) 65a) példa szerint előállított bromidot a 63. példában leírtaknak megfelelően, p-fluor-anilin alkalmazásával reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 13 mg (28 μ mol, 64 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3450-3300, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1735, 1610, 1605, 1515, 1220, 895, 820 és 700 cm^{-1} .

117. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(2-Fenil-etil)-6-(p-fluor-N-anilino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-ill]-5-hepténsav

13 mg (28 μ mol) 116. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 11 mg (24 μ mol, 87 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3390, 3600-2300, 3080, 3060, 3020, 3000, 2930, 2870, 1710, 1610, 1605, 1510, 1220, 890, 820 és 700 cm^{-1} .

118. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(fenoxi-
-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-
-észter

36 mg (84,6 μ mol) 118a) példa szerint előállított
bromid 300 μ l tetrahidrofuránnal készült oldatát 90 mg ná-
trium-fenolát 300 μ l vízmentes metil-benzol és 300 μ l tetra-
hidrofurán elegyével készült tiszta oldatához adjuk és 28
órán át 80-90°C-on melegítjük. Az elegyhez ezután vizet adunk,
több alkalommal dietil-éterrel extraháljuk, a szerves fázist
vizzel és telített vizes nátrium-klorid-oldattal semleges-
re mossuk, magnézium-szulfáton szárítjuk és szűrés után az
oldószert lepároljuk. A maradékot analitikai kovásgél-le-
mezekon kromatográfiásan tisztítjuk. A kifejlesztéshez etil-
-acetát és etanol elegyét, az eluáláshoz kloroform és dietil-
-éter elegyét használjuk. A kiindulási anyag és az elhid-
rolizált észter mellett 18 mg (40,3 μ mol, 48 %) cím szerinti
vegyületet különítünk el halványsárga olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2950, 2930, 2870, 1735,
1600, 1510, 1445, 1230, 1110, 900, 820, 760 és
700 cm^{-1} .

118a) példa

(4S,5R(5Z),6R,1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(bróm-
-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav-metil-
-észter

28 mg (77 μ mol) 17a) példa szerint előállított alkoholt a 63a) példában leírtaknak megfelelően brómozunk, és feldolgozás és tisztítás után 32 mg (75 μ mol, 97 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2950, 2860, 1735, 1600, 1505, 1450, 1435, 1220, 1165, 1010, 895, 825, 760, 700 és 635 cm^{-1} .

119. példa

(4S,5R(5Z),6S,1R)-7-[4-(p-Fluor-fenil)-6-(fenoxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]heptán-5-yl]-5-hepténsav

18 mg (40,3 μ mol) 118. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 14 mg (32,3 μ mol, 82 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3040, 2950, 2930, 2870, 1710, 1605, 1600, 1515, 1230, 1160, 895, 835, 720 és 580 cm^{-1} .

120. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(benzil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil(illetve benzil)-észter

17,5 mg (48,3 μ mol) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példa szerint reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 22,6 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3060, 3020, 3000, 2930, 2870, 1735, 1600, 1510, 1455, 1110, 1075, 895, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

120a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(hidroximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

40,7 mg (148 μmol) Corey-lakton enantiomert a 17a)-17g) és 1h)-1l) példában leírt módon reagáltatunk és 1,88 g (5,19 mmol , 3,5 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-3200, 3040, 3000, 2960, 2920, 2870, 1730, 1600, 1510, 1225, 1160, 1025, 890 és 830 cm^{-1} .

121. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(benziloximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

22,6 mg 120. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtak szerint elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 17,4 mg (39,7 μmol , a 120. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 82 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3090, 3060, 3020, 3000, 2940, 2870, 1725, 1710, 1605, 1510, 1450, 1230, 1160, 1090, 1030, 890, 830, 735, 690 és 640 cm^{-1} .

122. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(hexil-

-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

18,1 mg (50 μ mol) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 1-bróm-hexánal éterezünk, és feldolgozás és tisztítás után 25,5 mg (49 μ mol, 98 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3040, 3000, 2960, 2930, 2860, 1730, 1605, 1515, 1230, 1160, 1120, 1090, 1030, 895 és 830 cm^{-1} .

123. példa

(1S,4R,5S(5Z),5R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(hexil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

25,5 mg 122. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 20,0 mg (46,2 μ mol, 94 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3000, 2950, 2930, 2860, 1730, 1710, 1605, 1515, 1235, 1160, 1120, 1090, 1030, 895 és 830 cm^{-1} .

124. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[2-(4-bróm-fenoxi)-etoxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

16,3 mg (45 μ mol) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 1-klór-2-(4-bróm-fenoxi)-etánnal éterezünk, és feldolgozás és tisztítás

után 18,5 mg (34 μ mol, 76 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3040, 3000, 2940, 2870, 1730, 1590, 1850, 1515, 1490, 1450, 1290, 1245, 895, 825 és 645 cm^{-1} .

125. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[2-(4-bróm-fenoxi)-etoxil-metil]-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

18,5 mg (34 μ mol) 124. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 15,4 mg (29 μ mol, 85 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2500, 3070, 3040, 3000, 2930, 2870, 1725, 1710, 1590, 1580, 1515, 1490, 1455, 1285, 1245, 895, 825 és 645 cm^{-1} .

126. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-nitro-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil (illetve 3-nitro-benzil)-észter

19,4 mg (53 μ mol) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 19,9 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3050, 3000, 2930, 2870, 1735, 1610, 1595,
1530, 1510, 1230, 1160, 1120, 1095, 1030, 895,
830, 815 és 735 cm^{-1} .

127. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-nitro-
-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

19,9 mg 126. példa szerint előállított észterele-
gyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk,
és feldolgozás és tisztítás után 15 mg ($31\text{ }\mu\text{mol}$, a 126. példa
szerinti kiindulási anyagra számítva 58 %) cím szerinti ve-
gyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3090, 3070, 3050, 3000, 2930, 2870,
1730, 1705, 1610, 1595, 1530, 1510, 1350, 1230,
1160, 1120, 1095, 1030, 895, 830, 815 és 730 cm^{-1} .

128. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-klór-
-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-heptén-
sav-metil(illetve 4-klór-benzil)-észter

18,1 mg ($50\text{ }\mu\text{mol}$) 210a) példa szerint előállított
alkoholt az 1. példa szerint reagáltatunk, és feldolgozás
és tisztítás után 22 mg cím szerinti vegyületet különítünk
el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1735, 1605, 1600,
1515, 1495, 1450, 1235, 1160, 1120, 1090, 1015,
895, 830, 820, 810 és 800 cm^{-1} .

129. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-8-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-klór-benzil-oxi-metil)-2-oxabiciklo[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

22 mg 128. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 13,3 mg (28 μ mol, a 128. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 56 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3000, 2930, 2870, 1725, 1710, 1605, 1600, 1515, 1490, 1410, 1230, 1160, 1120, 1090, 1015, 895, 830, 820, 810 és 800 cm^{-1} .

130. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabiciklo[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil(illetve 4-fluor-benzil)-észter

17,8 mg (49 μ mol) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 21 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2950, 2860, 1735, 1605, 1510, 1225, 1150, 895, 820, 760 és 705 cm^{-1} .

131. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabiciklo[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

21 mg 130. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és

feldolgozás és tisztítás után 18,1 mg (40 μ mol, a 130. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 81 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2500, 3070, 3040, 3000, 2930, 2870, 1725, 1710, 1605, 1510, 1220, 1160, 1090, 1030, 1015, 895 és 830 cm^{-1} .

132. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[4-(trifluor-metil)-benzil-oxi-metil]-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil(illetve 4-(trifluor-metil)-benzil)-észter

17,7 mg (49 μ mol) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 26,5 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3040, 3000, 2940, 2870, 1735, 1620, 1610, 1515, 1325, 1240, 1165, 1125, 1065, 1020, 900, 830 és 825 cm^{-1} .

133. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[4-(trifluor-metil)-benzil-oxi-metil]-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

26,5 mg 132. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 22,5 mg (44 μ mol, a 132. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 91 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2500, 3040, 3000, 2940, 2870, 1725, 1710,
1620, 1610, 1515, 1325, 1235, 1165, 1125, 1065,
1020, 895, 830 és 825 cm^{-1} .

134. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fenil-
-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-
-metil-észter

17 mg (47 μmol) 120a) példa szerint előállított al-
koholt az 1. példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgo-
zás és tisztítás után 21 mg (40 μmol , 85 %) cím szerinti ve-
gyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3060, 3030, 3000, 2940, 2870, 1735, 1605, 1515,
1490, 1410, 1225, 1160, 1120, 1090, 1080, 1025,
1010, 895, 830, 760, 735 és 705 cm^{-1} .

135. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fenil-
-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

21 mg (40 μmol) 134. példa szerint előállított
észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk,
és feldolgozás és tisztítás után 16,5 mg (32 μmol , 80 %) cím
szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3060, 3030, 3000, 2940, 2870, 1730,
1710, 1605, 1515, 1490, 1410, 1230, 1160, 1120,
1090, 1080, 1030, 1010, 895, 830, 760, 735 és
700 cm^{-1} .

136. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fluor-anilino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

28 mg (66 μ mol) 136a) példa szerint előállított bromidot a 63. példában leírtaknak megfelelően 4-fluor-anilinnel reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 20,5 mg (45 μ mol, 68 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3450-3300, 3040, 3000, 2930, 2870, 1735, 1610, 1510, 1320, 1300, 1220, 1160, 895, 820 és 760 cm^{-1} .

136a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(bróm-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

25,9 mg (71 μ mol) 120a) példa szerint előállított alkoholt a 63a) példában leírt módon brómozunk, és feldolgozás és tisztítás után 28 mg (66 μ mol, 93 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3040, 2970, 2940, 2870, 1730, 1605, 1510, 1450, 1430, 1295, 1230, 1160, 1035, 900, 830 és 735 cm^{-1} .

137. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fluor-anilino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

20,5 mg (45 μ mol) 136. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk,

és feldolgozás és tisztítás után 18 mg (41 μmol , 91 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3390, 3040, 3000, 2930, 2870, 1710, 1610, 1510, 1320, 1300, 1220, 1160, 895, 820 és 760 cm^{-1} .

138. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidroxi-4-fenoxi-1(E)-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-11]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[3(R)-hidroxi-fenoxi-1(E)-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-11]-5-hepténsav-metil-észter (B)

43 mg (87 μmol) 138a) példa szerint előállított tetraol ketont a 23. példában leírt módon redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 43 mg (87 μmol , 99 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3700-3100, 3050, 3000, 2970, 2940, 2930, 2870, 1730, 1595, 1585, 1510, 1490, 1450, 1430, 1290, 1230, 1160, 1080, 1035, 995, 970, 895, 830, 755, 735 és 690 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 19,8 mg (40 μmol , 46 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 19,6 mg (40 μmol , 46 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

138a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-oxo-4-fenoxi-1(E)-butenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

47,4 mg (131 μ mol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 30a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-3-fenoxi-propil)-foszfónát-lítium-sóval reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 43,5 mg (88 μ mol, 67 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3060, 3040, 3000, 2970, 2940, 2870, 1730, 1690, 1620, 1600, 1510, 1490, 1450, 1435, 1290, 1230, 1160, 1040, 995, 900, 835, 755 és 690 cm^{-1} .

138b) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-formil-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

647 mg (1,79 mmol) 120a) példa szerinti alkoholt a 38b) példában leírt módon oxidálunk, és feldolgozás után 637 mg (1,77 mmol, 99 %) cím szerinti olajat különítünk el, amelyet tisztítás nélkül reagáltatunk tovább.

139. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidroxi-4-fenoxi-1(E)-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

19,8 mg (40 μ mol) 138. példa szerint előállított nempoláros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 15,9 mg

(33 μmol , 83 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3700-2400, 3060, 3040, 3010, 2930, 2880, 1725, 1710, 1600, 1585, 1455, 1300, 1245, 1235, 1160, 1080, 1040, 995, 970, 895, 835, 820, 755, 690 és 590 cm^{-1} .

140. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7- [4-(4-Fluor-fenil)-6- [3(R)-
-hidroxi-4-fenoxi-1(E)-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-
-5-hepténsav

19,6 mg 39,6 μmol) 138. példa szerint előállított poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 13,8 mg (28,7 μmol , 73 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3040, 3000, 2930, 2880, 1725, 1710, 1600, 1585, 1455, 1300, 1250, 1235, 1160, 1080, 1040, 995, 970, 895, 840, 820, 755, 690 és 590 cm^{-1} .

141. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7- [4-(4-Fluor-fenil)-6- [3(S)-
-hidroxi-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-heptén-
sav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7- [4-(4-fluor-fenil)-6- [3(R)-
-hidroxi-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-heptén-
sav-metil-észter (B)

43 mg (94 μmol) 141a) példa szerint előállított telitetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 42 mg (92 μmol , 97 %) szintelen olajat különítünk el, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3040, 3000, 2950, 2920, 2860, 1605, 1510, 1450, 1435, 1230, 1160, 995, 970, 895 és 830 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 21 mg (46 μmol , 49 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 19 mg (41 μmol , 44 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

141a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-oxo-1(E)-oktenil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

47 mg (130 μmol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-heptil)-foszfónáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 43 mg (94 μmol , 72 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3040, 3000, 2950, 2920, 2860, 1730, 1690, 1665, 1620, 1510, 1450, 1430, 1230, 1160, 995, 900 és 835 cm^{-1} .

142. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-
-hidroxi-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-
-hepténsav

21 mg (46 μ mol) 141. példa szerint előállított nem-
poláros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszap-
panositunk, és feldolgozás és tisztítás után 19 mg (43 μ mol,
93 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3040, 3000, 2950, 2930, 2870, 2860,
1710, 1610, 1515, 1455, 1300, 1235, 1160, 995,
970, 895 és 835 cm^{-1} .

143. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(R)-
-hidroxi-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-
-hepténsav

19 mg (41 μ mol) 141. példa szerint előállított po-
láros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk,
és feldolgozás és tisztítás után 15,6 mg (35 μ mol, 86 %)
cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3040, 3000, 2940, 2870, 1725, 1710,
1610, 1515, 1455, 1300, 1230, 1160, 995, 970,
895 és 835 cm^{-1} .

144. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,4R,4RS)-
-3-hidroxi-4,7-dimetil-okta-1,6-dienil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-
hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[(1E,3S,-4RS)-3-hidroxi-4,7-dimetil-okta-1,6-dienil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (B)

53 mg (110 μmol) 144a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 48 mg (99 μmol , 90 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3040, 2960, 2920, 2870, 1735, 1605, 1510, 1450, 1435, 1230, 1160, 995, 970, 895, 835 és 735 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 27 mg (56 μmol , 51 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 18 mg (37 μmol , 34 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

144a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,4RS)-3-oxo-4,7-dimetil-okta-1,6-dienil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

48,6 mg (135 μmol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-3,6-dimetil-5-heptenil)-foszfónáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 53 mg (110 μmol , 81 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3040, 3000, 2960, 2930, 2870, 1735, 1690, 1665, 1620, 1510, 1450, 1435, 1370, 1230, 1160, 1040, 995, 975, 900 és 830 cm^{-1} .

145. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,3S,-4RS)-3-hidroxi-4,7-dimetil-okta-1,6-dienil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

27 mg (56 μ mol) 144. példa szerint előállított nempoláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 23 mg (49 μ mol, 87 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3040, 2970, 2930, 2880, 1710, 1610, 1515, 1455, 1300, 1235, 1160, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

146. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,3R,-4RS)-3-hidroxi-4,7-dimetil-okta-1,6-dienil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

18 mg (37 μ mol) 144. példa szerint előállított poláros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 16 mg (34 μ mol, 92 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3040, 2970, 2930, 2880, 1725, 1710, 1610, 1515, 1450, 1300, 1235, 1160, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

147. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-fenil-ureido-imino-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

18 mg (50 μ mol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 26. példában leírt módon 4-fenil-szemikarbaziddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 22,3 mg (45 μ mol, 90 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3390, ^{3200,} 3150-3050, 3010, 2940, 2880, 1730, 1690, 1595, 1535, 1515, 1450, 1235, 895, 830, 755 és 690 cm^{-1} .

148. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(difenil-metoxi-imino-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

17,4 mg (48 μ mol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 26. példa szerint reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 25,7 mg (47 μ mol, 98 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3090, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1735, 1605, 1515, 1495, 1450, 1300, 1235, 1160, 1040, 1020, 935, 895, 830, 740 és 700 cm^{-1} .

150. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(difenil-metoxi-imino-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

25,7 mg (47 μ mol) 149. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 24 mg (45 μ mol, 97 %) cím

szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3090, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1730, 1705, 1605, 1515, 1495, 1450, 1300, 1235, 1160, 1040, 1020, 1000, 935, 900, 830, 740 és 700 cm^{-1} .

151. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(1-naftil-metoxi-imino-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

17,9 mg (50 μmol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 26. példában leírtaknak megfelelően 1-naftil-metoxi-aminnal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 24 mg (47 μmol , 93 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3060, 3040, 3000, 2940, 2870, 1730, 1605, 1595, 1510, 1450, 1435, 1365, 1230, 1160, 1035, 1010, 1000, 895, 830, 800, 790, 775 és 635 cm^{-1} .

152. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(1-naftil-metoxi-imino-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

24 mg (47 μmol) 151. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 20 mg (40 μmol , 85 %) cím szerinti vegyületet különítünk el viaszszerű szilárd anyag formájában.

IR (KBr): 3600-2400, 3070, 3050, 3010, 2940, 2880, 1730,
1705, 1610, 1600, 1515, 1230, 1160, 1040, 1015,
1000, 920, 900, 835, 800, 795, 780 és 585 cm^{-1} .

153. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-
-hidroxi-4-(4-fluor-fenoxi)-1(E)-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-
hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[3(R)-
-hidroxi-4-(4-fluor-fenoxi)-1(E)-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-
hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (B)

36 mg (70,5 μmol) 153a) példa szerint előállított
telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően re-
dukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 31 mg (60,5 μmol ,
86 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti ve-
gyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3000, 2970, 2940, 2870, 1735,
1605, 1510, 1245, 1220, 1160, 1035, 895, 830,
760 és 735 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 11 mg
(21,5 μmol , 30 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerke-
zetet rendeljük, és 16 mg (31 μmol , 44 %) poláros alkoholt
különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

153a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3-oxo-
-4-(4-fluor-fenoxi)-1(E)-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-
-yl]-5-hepténsav-metil-észter

55,4 mg (154 μmol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 30a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-3-(p-fluor-fenoxi)-propil)-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 36 mg (70,5 μmol , 46 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában. IR (film): 3070, 3040, 3000, 2970, 2940, 2870, 1730, 1690, 1620, 1510, 1505, 1435, 1290, 1220, 1200, 1160, 1040, 995, 900 és 830 cm^{-1} .

154. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidroxi-4-(4-fluor-fenoxi)-1(E)-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-yl]-5-hepténsav

11 mg (21,5 μmol) 153. példa szerint előállított nempoláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 10 mg (20 μmol , 93 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában. IR (film): 3600-2400, 3080, 3030, 3010, 2980, 2940, 2870, 1710, 1610, 1605, 1510, 1460, 1300, 1225, 1165, 1035, 890, 835, 760, 590 és 520 cm^{-1} .

155. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(R)-hidroxi-4-(4-fluor-fenoxi)-1(E)-butenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-yl]-5-hepténsav

16 mg (31 μmol) 153. példa szerint előállított poláros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszap-

panositunk, és feldolgozás és tisztítás után 13 mg (26 μ mol, 84 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3030, 2980, 2940, 2880, 1710, 1610, 1605, 1510, 1460, 1300, 1225, 1165, 1040, 895, 830, 760, 590 és 520 cm^{-1} .

156. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidroxi-4(RS)-fluor-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[3(R)-hidroxi-4(RS)-fluor-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (B)

51 mg (107 μ mol) 156a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírt módon redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 49 mg (103 μ mol, 96 %) szintelen olajat kapunk, amely a cím szerinti két vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3040, 3000, 2950, 2930, 2860, 1735, 1605, 1510, 1450, 1435, 1230, 1160, 1040, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás után 26 mg (54,5 μ mol, 51 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük és 19 mg (40 μ mol, 37 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

156a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3-oxo-4(RS)-fluor-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

48 mg (133 μ mol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-3-fluor-heptil)-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 51 mg (107 μ mol, 81 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olajként.

IR (film): 3040, 3020, 3000, 2950, 2920, 2870, 1730, 1690, 1615, 1510, 1450, 1430, 1310, 1290, 1230, 1160, 1045, 995, 975, 900 és 830 cm^{-1} .

157. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidrox-4(RS)-fluor-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

26 mg (55 μ mol) 156. példa szerint előállított nem-poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 24 mg (52 μ mol, 95 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2940, 2920, 2880, 1710, 1610, 1515, 1455, 1300, 1235, 1115, 1040, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

158. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(R)-hidrox-4(RS)-fluor-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

19 mg (40 μ mol) 156. példa szerint előállított poláros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszap-panositunk, és feldolgozás és tisztítás után 18 mg (39 μ mol, 97 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2940, 2920, 2880, 1725, 1710, 1610, 1515, 1300, 1235, 1115, 1040, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

159. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidroxi-4(RS)-fluor-1(E)-nonenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[3(R)-hidroxi-4(RS)-fluor-1(E)-nonenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (B)

46 mg (94 μ mol) 159a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 43 mg (88 μ mol, 97 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3080, 3040, 3000, 2960, 2930, 2870, 1735, 1605, 1510, 1435, 1230, 1160, 1040, 995, 970, 900 és 835 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 24 mg (50 μ mol, 52 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 17 mg (34 μ mol, 37 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

159a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3-oxo-4-(RS)-fluor-1(E)-nonenil]2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-heptén-sav-metil-észter

46 mg (128 μ mol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírt módon dimetil-(2-oxo-3-fluor-oktil)-foszfénáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 46 mg (94 μ mol, 74 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3070, 3040, 3000, 2950, 2920, 2860, 1735, 1690, 1615, 1510, 1450, 1435, 1230, 1160, 1045, 995, 900 és 830 cm^{-1} .

160. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidroxi-4(RS)-fluor-1(E)-nonenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

24 mg (50 μ mol) 159. példa szerint előállított nem-poláros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszáposítunk, és feldolgozás és tisztítás után 21 mg (44 μ mol, 88 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2960, 2930, 2870, 1725, 1710, 1610, 1515, 1455, 1410, 1300, 1235, 1155, 1000, 975, 895 és 835 cm^{-1} .

161. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(R)-

-hidroxi-4(RS)-fluor-1(E)-nonenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-
-5-yl]-5-hepténsav

17 mg (34 μ mol) 159. példa szerint előállított polá-
rális észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk,
és feldolgozás és tisztítás után 16 mg (33 μ mol, 98 %) cím
szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.
IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2950, 2930, 2870, 1710,
1610, 1515, 1455, 1410, 1300, 1235, 1155, 1045,
1000, 975, 895 és 835 cm^{-1} .

162. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-
-hidroxi-4,4-trimetilenon-1(E)-nonen-7-ynil]-2-oxabicyclo-
[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[3(R)-
-hidroxi-4,4-trimetilenon-1(E)-nonen-7-ynil]-2-oxabicyclo-
[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (B)

30 mg (59 μ mol) 162a) példa szerint előállított
telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redu-
kálunk, és feldolgozás és tisztítás után 28 mg (55 μ mol,
93 %) színtelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti ve-
gyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3080, 3030, 2970, 2930, 2870, 1735,
1605, 1510, 1450, 1435, 1225, 1160, 1040, 995,
970, 895 és 835 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 18 mg
(35 μ mol, 60 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkeze-

tet rendeljük, és 8 mg (16 μ mol, 27 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a (B) szerkezetet rendeljük.

162a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3-oxo-4,4-trimetilenon-1(E)-nonén-7-inil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

46 mg (128 μ mol) 138b) példa szerinti aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-3,3-trimetilenon-okt-6-inil)-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 31 mg (61 μ mol, 48 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3040, 2970, 2940, 2860, 1735, 1680, 1620, 1510, 1450, 1453, 1230, 1160, 995, 900 és 830 cm^{-1} .

163. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidroxi-4,4-trimetilenon-1(E)-nonén-7-inil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

18 mg (35 μ mol) 162. példa szerint előállított nem-poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 15 mg (30 μ mol, 87 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2400, 3040, 2980, 2940, 2880, 2840, 1710, 1610, 1515, 1445, 1435, 1410, 1300, 1230, 1160, 1040, 1015, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

164. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(R)-
-hidroxi-4,4-trimetilenon-1(E)-nonen-7-inil]-2-oxabicyklo-
[2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav

8 mg (16 μ mol) 162. példa szerint előállított po-
láros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappa-
nosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 7 mg (14 μ mol,
88 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj
formájában.

IR (film): 3600-2400, 3040, 2980, 2940, 2880, 2840, 1725,
1710, 1610, 1515, 1450, 1435, 1410, 1300, 1235,
1160, 1040, 1015, 995, 970, 890 és 835 cm^{-1} .

165. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-
-hidroxi-4,4-trimetilenon-1(E)-nonén-6-inil]-2-oxabicyklo-
[2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[3(S)-
-hidroxi-4,4-trimetilenon-1(E)-nonén-6-inil]-2-oxabicyklo-
[2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (B)

50 mg (99 μ mol) 165a) példa szerint előállított
telítetlen ketont a 23. példában leírt módon redukálunk, és
feldolgozás és tisztítás után 46 mg (90 μ mol, 91 %) szinte-
len olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keve-
réke.

IR (film): 3600-3200, 3040, 2970, 2930, 2870, 1735, 1605,
1510, 1450, 1435, 1230, 1160, 1040, 995, 970,
895 és 835 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 27 mg (53 μ mol, 54 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 17 mg (33 μ mol, 34 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

165a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3-oxo-4,4-trimetilenon-1(E)-nonen-6-inil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

45 mg (125 μ mol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírt módon dimetil-(2-oxo-3,3-trimetilenon-5-oktinil)-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 50 mg (99 μ mol, 79 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3070, 3040, 2970, 2940, 2870, 1730, 1685, 1620, 1510, 1450, 1430, 1230, 1160, 1045, 995, 900 és 830 cm^{-1} .

166. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidrox-4,4-trimetilenon-1(E)-nonén-6-inil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

26 mg (51 μ mol) 165. példa szerint előállított nempoláros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszapanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 24 mg (49 μ mol, 95 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3040, 2980, 2940, 2880, 1710, 1610, 1515, 1455, 1430, 1405, 1320, 1300, 1235, 1160, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

167. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(R)-hidroxi-4,4-trimetilenon-1(E)-nonén-6-inill]-2-oxabicyclo-[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

16 mg (31 μmol) 165. példa szerint előállított poláros észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 15 mg (30 μmol , 98 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3040, 2970, 2940, 2870, 1725, 1710, 1610, 1515, 1455, 1430, 1405, 1320, 1300, 1230, 1160, 1040, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

168. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,3R,-4RS,6Z)-3-hidroxi-4-metil-7-klór-okta-1,6-dienill]-2-oxabicyclo-[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[(1E,3S,-4RS,6Z)-3-hidroxi-4-metil-7-klór-okta-1,6-dienill]-2-oxabicyclo-[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (B)

52 mg (103 μmol) 168a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 52 mg (103 μmol , 99 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3040, 2950, 2920, 2870, 1730, 1605,
1510, 1430, 1230, 1160, 995, 970, 895 és 830 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 30 mg
(59 μmol , 58 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkeze-
tet rendeljük, és 21 mg (42 μmol , 40 %) poláros alkoholt kü-
lönitünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

168a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,4RS,-
6Z)-3-oxo-4-metil-7-klór-okta-1,6-dienil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-
hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

48 mg (133 μmol) 138b) példa szerint előállított
aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-
-oxo-3-metil-6-klór-hept-5(Z)-én)-foszfonáttal reagáltatunk,
és feldolgozás és tisztítás után 52 mg (103 μmol , 78 %) cím
szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3040, 2970, 2940, 2930, 2870, 1730, 1690, 1665,
1620, 1510, 1450, 1430, 1360, 1225, 1160, 1040,
995, 975, 900 és 830 cm^{-1} .

169. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,3R,-
4RS,6Z)-3-hidrox-4-metil-7-klór-okta-1,6-dienil]-2-oxa-
bicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

30 mg (59 μmol) 168. példa szerint előállított
észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosí-
tunk, és feldolgozás és tisztítás után 25 mg (51 μmol , 86 %)

cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2970, 2960, 2930, 2880, 1710, 1610, 1515, 1300, 1235, 1160, 1015, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

170. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,3S,-4RS)-3-hidroxi-4-metil-7-klór-okta-1,6-dienil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

21 mg (42 μmol) 168. példa szerint előállított poláros észter a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 18 mg (37 μmol , 87 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3060, 3020, 2970, 2930, 2880, 1710, 1610, 1515, 1455, 1410, 1300, 1235, 1160, 1015, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

171. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,3R,-4RS)-3-hidroxi-4,6-dimetil-heptenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[(1E,3S,-4RS)-3-hidroxi-4,6-dimetil-heptenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (B)

47 mg (100 μmol) 171a) példa szerint előállított tetraacetil ketont a 23. példában leírt módon redukálunk, és

feldolgozás és tisztítás után 47 mg (99 μmol , 99 %) szintelen olajat kapunk, amely a cím szerinti két vegyület keveréke.
IR (film): 3600-3250, 3040, 2950, 2920, 2860, 1735, 1605, 1450, 1435, 1365, 1230, 1160, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 28 mg (59 μmol , 59 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 18 mg (38 μmol , 38 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

171a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,4RS)-3-oxo-4,6-dimetil-heptenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

47 mg (130 μmol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 23. példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-3,5-dimetil-hexil)-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 48 mg (102 μmol , 78 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3060, 3040, 2950, 2920, 2860, 1735, 1690, 1665, 1620, 1510, 1450, 1435, 1365, 1230, 1190, 1160, 1040, 995, 975, 900 és 830 cm^{-1} .

172. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,3R,4RS)-3-hidroxi-4,6-dimetil-heptenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

28 mg (69 μmol) 171. példa szerint előállított nem-poláros észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszepanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 24 mg (52 μmol , 76 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként. IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2960, 2930, 2870, 1725, 1710, 1610, 1515, 1460, 1300, 1235, 1165, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

173. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,3S,-4RS)-3-hidroxi-4,6-dimetil-heptenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

18 mg (38 μmol) 171. példa szerint előállított poláros észtert a 2. példában leírt módon elszepanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 17 mg (37 μmol , 97 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2960, 2930, 2870, 1710, 1610, 1515, 1460, 1385, 1300, 1235, 1165, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

174. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-piridil-2-vinil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

26,4 mg 2-pikolil-trifenil-foszfónium-klorid-nátrium-amid 250 μl vízmentes tetrahidrofuránnal készült halványsárga oldatához 19 mg (53 μmol) 138b) példa szerint előállított

aldehid 200 μ l vízmentes tetrahidrofuránnal készült oldatát adjuk, és két órán át 25°C-on száraz argon atmoszférában hagyjuk a komponenseket reagálni. A reakcióoldatot két analitikai vékonyréteg-lemezre visszük fel, triklór-metán és etanol elegyével a kromatogramot kifejlesztjük és a terméket triklór-metánnal eluáljuk, így 19 mg (44 μ mol, 82 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3430, 3040, 3000, 2970, 2930, 2870, 1735, 1650, 1595, 1585, 1565, 1515, 1465, 1430, 1295, 1225, 1040, 995, 970, 900, 835, 760, 590 és 530 cm^{-1} .

175. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-piridil-2-vinil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav

19 mg (44 μ mol) 174. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 16 mg (38 μ mol, 86 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2300, 3430, 3040, 3000, 2970, 2930, 2870, 2540, 2100-1800, 1725, 1710, 1650, 1595, 1585, 1565, 1515, 1470, 1430, 1295, 1230, 1040, 995, 970, 900, 835, 760, 585 és 530 cm^{-1} .

176. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-fenil-2-vinil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

18 mg (50 μmol) 138b) példa szerinti aldehidet a 174. példában leírt módon benzil-trifenil-foszfónium-bromid-nátrium-amiddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 17 mg (40 μmol , 81 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3060, 3020, 3000, 2970, 2940, 2870, 1735, 1595, 1510, 1445, 1435, 1230, 1195, 1160, 1040, 995, 965, 895, 835, 745 és 695 cm^{-1} .

177. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-fenil-vinil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

17 mg (40 μmol) 176. példa szerint előállított észter a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 15 mg (36 μmol , 89 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3010, 2980, 2940, 2880, 1730, 1710, 1610, 1600, 1515, 1450, 1410, 1300, 1230, 1160, 1040, 995, 965, 895, 835, 745, 695, 585 és 520 cm^{-1} .

178. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[1(E/Z),4-(E)-pentadienil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

20 mg (55 μmol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 174. példában leírtaknak megfelelően krotil-

-trifenil-foszfónium-bromid-nátrium-amiddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 7 mg (18 μ mol, 32 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában. IR (film): 3040, 3010, 2930, 2870, 1735, 1610, 1515, 1450, 1410, 1300, 1235, 1160, 995, 900 és 835 cm^{-1} .

179. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[1(E/Z),-4(E)-pentadienil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav
7 mg (18 μ mol) 178. példa szerint előállított észter
a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 5 mg (13 μ mol, 72 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.
IR (film): 3600-2400, 3040, 3010, 2930, 2880, 1730, 1710, 1610, 1515, 1450, 1410, 1300, 1235, 1160, 990, 900 és 835 cm^{-1} .

180. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[4-(trifluor-metil)-benzil-oxi-imino-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter
17,9 mg (49 μ mol) 138b) példa szerinti előállított aldehidet a 26. példában leírtaknak megfelelően p-(trifluor-metil)-fenil-metoxi-aminnal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 22,8 mg (43 μ mol, 87 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3070, 3040, 2940, 2870, 1735, 1620, 1605, 1510, 1435, 1415, 1325, 1230, 1160, 1125, 1065, 1015, 900, 830 és 820 cm^{-1} .

181. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[4-(tri-fluor-metil)-benzil-oxi-imino-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

22 mg (43 μmol) 180. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 19 mg (37 μmol , 85 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2930, 2880, 1730, 1710, 1620, 1610, 1515, 1415, 1325, 1235, 1165, 1125, 1065, 1015, 900, 835 és 820 cm^{-1} .

182. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fluor-benzil-oxi-imino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

19,3 mg (53,5 μmol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 26. példában leírtaknak megfelelően p-fluor-fenil-metoxi-aminnal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 23,6 mg (48,8 μmol , 91 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3070, 3040, 3000, 2940, 2870, 1735, 1605, 1510, 1435, 1365, 1220, 1160, 1040, 1015, 1000, 900 és 830 cm^{-1} .

183. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fluor-benzil-oxi-imino-metil)-3-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

23,6 mg (48,8/μmol) 182. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 22 mg (46,9 μmol, 96 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.
IR (film): 3600-2400, 3070, 3040, 3010, 2930, 2880, 1730, 1710, 1605, 1515, 1225, 1160, 1040, 1015, 1000, 900, 835 és 820 cm⁻¹.

184. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(benzil-oxi-imino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

17,1 mg (47,4 μmol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 26. példában leírt módon fenil-metoxi-aminnal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 17,8 mg (38,2 μmol, 81 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3090, 3060, 3030, 3000, 2940, 2920, 2870, 1735, 1605, 1510, 1450, 1430, 1365, 1230, 1160, 1040, 1015, 1000, 900, 835, 750, 735 és 700 cm⁻¹.

185. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(benzil-oxi-imino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

17,8 mg (38,2 μ mol) 184. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 17 mg (31,4 μ mol, 82 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában. IR (film): 3600-2400, 3090, 3060, 3030, 3010, 2930, 2880, 1730, 1710, 1610, 1515, 1455, 1235, 1165, 1045, 1015, 1000, 900, 835, 820, 735 és 700 cm^{-1} .

186. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

3 mg (6,4 μ mol) 187. példa szerint előállított savat 1 ml diklór-metánban oldunk, az oldatot 0-5°C-ra hűtjük és diazometán éteres oldatát adjuk hozzá. Az oldószer eltávolítása után 3 mg (6,4 μ mol, 100 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3010, 2970, 2940, 2880, 2230, 1735, 1610, 1595, 1515, 1445, 1435, 1290, 1235, 1165, 1040, 1020, 990, 895, 835 és 820 cm^{-1} .

187. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

26 mg (46,3 μ mol) 190. példa szerint előállított A nempoláros alkoholt 460 μ l vízmentes dimetil-szulfoxid és

190 μ l vízmentes tetrahidrofurán elegyében oldunk, 15,6 mg kálium-terc-butanolátot adunk az oldathoz, és 2,5 órán át 23°C-on, száraz argon atmoszférában keverjük az elegyet. Jegesvíz hozzáadása után az oldatot telített vizes citromsav-oldattal megsavanyítjuk, dietil-éterrel extraháljuk, a szerves fázist magnézium-szulfáton szárítjuk. Szűrés és az oldószer eltávolítása után kapott maradékot két analitikai vékonyréteg-lemezen tisztítjuk. Futtatószerként triklór-metán és etanol, eluálószerként etil-acetát és etanol elegyét használjuk. Ily módon 11,5 mg (24,6 μ mol, 53 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3700-2400, 3050, 3010, 2980, 2940, 2880, 2230, 1710, 1610, 1595, 1515, 1445, 1435, 1410, 1290, 1235, 1165, 1040, 1020, 990, 900, 835 és 820 cm^{-1} .

188. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3R,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

2,7 mg (5,8 μ mol) 189. példa szerint előállított savat a 186. példában leírt módon észterezünk, és az oldószer eltávolítása után 2,7 mg (5,8 μ mol, 100 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3010, 2980, 2940, 2880, 2230, 1735, 1610, 1515, 1445, 1435, 1410, 1295, 1230, 1165, 1040, 1020, 990, 900, 835 és 820 cm^{-1} .

189. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3R,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

38 mg (67,7 μ mol) 190. példa szerint előállított poláros B alkoholt a 187. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 17,3 mg (37,1 μ mol, 55%) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2400, 3050, 3010, 2980, 2940, 2880, 2230, 1710, 1610, 1515, 1445, 1435, 1410, 1295, 1235, 1165, 1040, 1020, 990, 900, 835 és 820 cm^{-1} .

190. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-bróm-3-hidroxi-4-metil-1-non-1-én-6-ill)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3R,4S))-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-(2-bróm-3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (B)

80 mg (143 μ mol) 190a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírt módon redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 66 mg (118 μ mol, 82 %) színtelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti termék keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3040, 2970, 2930, 2870, 1735, 1605, 1510, 1450, 1430, 1230, 1160, 1040, 990, 895, 830 és 735 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 26 mg (46,3 μ mol, 32 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 38 mg (67,7 μ mol, 47 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

190a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-bróm-3-oxo-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyklo [2.2.1]-hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

12,4 mg 50 %-os paraffinos nátrium-hidrid diszperzió 1,1 ml vízmentes tetrahidrofuránnal készült szuszpenziójához 0°C-on, argon atmoszférában 62 mg dimetil-(2-oxo-3S-metil-okt-5-in)-foszfonát 650 μ l vízmentes tetrahidrofuránnal készült oldatát csepegtetjük, majd 30 perc eltelte után 47,5 mg finoman porított N-bróm-szukcinimidet adunk az elegyhez és 1 órával később 77,7 mg (215 μ mol) 138b) példa szerint előállított aldehid 650 μ l vízmentes tetrahidrofuránnal készült oldatát csepegtetjük hozzá. A reakcióelegyet hagyjuk 23°C-ra melegedni, 5 órán át keverjük, majd dietil-éterrel hígítjuk. Az éteres fázist 10 %-os nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal és vízzel semlegesre mossuk, magnézium-szulfáton szárítjuk és szűrés után az oldószert eltávolítjuk. A maradékot három analitikai vékonyréteg-lemezen kromatográfiásan tisztítjuk. Futtatószerként kloroform és dietil-éter elegyét használjuk, eluálószerként etil-acetátot alkalmazunk. Ily módon 80 mg (143 μ mol, 66 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3040, 3010, 2970, 2930, 2870, 1730, 1680, 1600,
1510, 1450, 1430, 1230, 1160, 1040, 985, 900
és 830 cm^{-1} .

191. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3R,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-
-6-(2-bróm-3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo-
[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

7,3 mg (13 μmol) 190. példa szerint előállított po-
láros B észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszap-
panositunk, és feldolgozás és tisztítás után 5,1 mg (9,3 μmol ,
72 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3040, 3010, 2960, 2930, 2870, 1735,
1605, 1510, 1450, 1410, 1305, 1230, 1160, 1040,
990, 895, 830 és 730 cm^{-1} .

192. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-
-6-(2-bróm-3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo-
[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

8,1 mg (14,4 μmol) 190. példa szerint előállított
nempoláros A észtert a 2. példában leírt módon elszappanosí-
tunk, és feldolgozás és tisztítás után 7,5 mg (13,7 μmol ,
95 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj
alakjában.

IR (film): 3600-2300, 3050, 3010, 2970, 2930, 2880, 1735,
1605, 1510, 1455, 1410, 1305, 1235, 1160, 1040,
990, 895, 830 és 730 cm^{-1} .

193. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3R,4S))-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (B)

40 mg (83,2 μ mol) 193a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 39 mg (80,8 μ mol, 97 %) színtelen olajat kapunk, amely a cím szerinti két vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3040, 2970, 2930, 2870, 1730, 1605, 1510, 1450, 1435, 1230, 1160, 995, 970, 895, 830 és 735 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 16,4 mg (34 μ mol, 41 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 20 mg (41 μ mol, 50 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

193a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-oxo-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

49,3 mg (136 μ mol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírt módon dimetil-(2-oxo-3S-metil-okt-5-in)-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tiszt-

titás után 37 mg (77 μ mol, 57 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3060, 3040, 2970, 2930, 2870, 1735, 1690, 1665, 1620, 1510, 1450, 1430, 1230, 1160, 1040, 995, 975, 900 és 835 cm^{-1} .

194. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyklo [2.2.1]-hept-5-ill-5-hepténsav

16 mg (33,2 μ mol) 193. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 15 mg (32 μ mol, 97 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR(film): 3700-2400, 3070, 3050, 3010, 2970, 2930, 2880, 2100, 1710, 1610, 1515, 1455, 1410, 1320, 1300, 1235, 1165, 1040, 1015, 995, 975, 895, 835 és 820 cm^{-1} .

195. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3R,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyklo [2.2.1]-hept-5-ill-5-hepténsav

20 mg (41,4 μ mol) 193. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 16 mg (34,1 μ mol, 82 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3700-2300, 3070, 3040, 3000, 2970, 2930, 2880,
1710, 1610, 1515, 1455, 1410, 1320, 1300, 1235,
1160, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

196. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-ciano-
-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-
-metil(illetve 4-ciano-benzil)-észter

19,6 mg (54,1 μmol) 120a) példa szerint előállított
alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 4-bróm-metil-
-benzonitrillel reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás
után 23 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen
olaj formájában.

IR (film): 3050, 3040, 3010, 2930, 2860, 2220, 1730, 1605,
1510, 1435, 1360, 1225, 1160, 1120, 1090, 1030,
895, 830 és 815 cm^{-1} .

197. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-ciano-
-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

23 mg 196. példa szerint előállított észterelegyet
a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és
feldolgozás és tisztítás után 18 mg (38,8 μmol , a 196. példa
szerinti kiindulási anyagra számítva 72 %) cím szerinti ve-
gyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3050, 3010, 2930, 2870, 2230,
1725, 1710, 1610, 1515, 1410, 1230, 1160, 1125,
995, 930, 920, 895, 835 és 820 cm^{-1} .

198. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-ciano-
-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-
-metil(illetve 3-ciano-benzil)-észter

18,4 mg (50,8 μmol) 120a) példa szerint előállított
alkoholt az 1. példában leírt módon 3-bróm-metil-benzonitril-
lel reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 25 mg cím
szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3060, 3040, 3000, 2940, 2860, 2230, 1730, 1605,
1510, 1435, 1230, 1160, 1090, 1030, 895, 830,
795, 730 és 685 cm^{-1} .

199. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(ciano-
-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

25 mg 198. példa szerint előállított észterelegyet
a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és
feldolgozás és tisztítás után 16,8 mg (36,2 μmol , a 198. pél-
da szerinti kiindulási anyagra számítva 71 %) cím szerinti
vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2930, 2870, 2230, 1725,
1710, 1605, 1515, 1230, 1160, 1120, 1090, 1030,
890, 835, 795 és 690 cm^{-1} .

200. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-fenil-propoxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

19,4 mg (53,5 μmol) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 3-bróm-1-fenil-propánnal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 23,4 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj fémájában.

IR (film): 3080, 3060, 3020, 2930, 2860, 1730, 1600, 1510, 1450, 1230, 1160, 1115, 1025, 895, 830, 735 és 700 cm^{-1} .

201. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-fenil-propoxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

23,4 mg 200. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 17 mg (36,4 μmol , a 200. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 68 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3700-2400, 3090, 3060, 3030, 3000, 2940, 2870, 1725, 1710, 1515, 1455, 1230, 1160, 1120, 1030, 895, 835, 745 és 700 cm^{-1} .

202. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[2-(4-fluor-fenoxi)-etoxi-metil]-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil(illetve 2-(4-fluor-fenoxi)-etil)-észter

21,4 mg (59 μ mol) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 4-fluor-fenoxi-2-etil-bromiddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 21 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3070, 3050, 3010, 2940, 2870, 1735, 1605, 1505, 1455, 1255, 1220, 1210, 1130, 895, 830 és 745 cm^{-1} .

203. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[2-(4-fluor-fenoxi)-etoxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

21 mg 202. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 10,6 mg (21,8 μ mol, a 202. példa szerinti kiindulási vegyületre számítva 37 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3050, 3010, 2930, 2870, 1730, 1710, 1605, 1505, 1455, 1250, 1220, 1210, 1130, 895, 830 és 745 cm^{-1} .

204. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[2-(metoxi-karbonil-metoxi)-etoxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

2,5 mg (5,5 μ mol) 205. példa szerint előállított savat a 186. példa szerint észterezünk, és az oldószer eltávolí-

tása után 2,5 mg (5,5 μ mol, 100 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3070, 3050, 3010, 2940, 2880, 1735, 1605, 1505, 1455, 1250, 1215, 1125, 895, 830 és 745 cm^{-1} .

205. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[2-(karb-oxi-metoxi)-etoxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

18,4 mg (50,8 μ mol) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 6-klór-3-oxa-hexánsav-etil-észterrel reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 12,8 mg (28,4 μ mol, 56 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2300, 3050, 3010, 2930, 2880, 1720, 1605, 1515, 1430, 1230, 1120, 1030, 895 és 835 cm^{-1} .

206. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(ciklohexil-metoxi-imino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

23,8 mg (66 μ mol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 26. példában leírtaknak megfelelően ciklohexil-metoxi-aminnal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 21 mg (44,5 μ mol, 67 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3050, 3010, 2920, 2850, 1735, 1605, 1510, 1450,
1230, 1160, 1040, 1000, 900, 830 és 735 cm^{-1} .

207. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(ciklohexil-
-metoxi-imino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

21 mg (44,5 μmol) 206. példa szerint előállított
észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és fel-
dolgozás és tisztítás után 20 mg (43,7 μmol , 98 %) cím sze-
rinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3050, 3010, 2930, 2850, 2635,
1730, 1710, 1610, 1515, 1450, 1235, 1160, 1040,
1025, 995, 895, 835 és 820 cm^{-1} .

208. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-
-(3-hidroxi-okt-1-ynil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hep-
ténsav-metil-észter

4,1 mg (9,3 μmol) 209. példa szerint előállított
savat a 186. példában leírtaknak megfelelően észteresítünk,
és az oldószer eltávolítása után 4 mg (8,8 μmol , 95 %) cím
szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3020, 2950, 2860, 2230, 1735,
1610, 1515, 1455, 1410, 1295, 1230, 1165, 1045,
995, 895 és 830 cm^{-1} .

209. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-

-hidroxi-okt-1-inil)-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav

24 mg (44,6 μmol) 212. példa szerint előállított nempoláros A alkoholt a 187. példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 13,8 mg (31,2 μmol , 70 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2500, 3050, 3010, 2950, 2930, 2870, 2860, 2230, 1710, 1610, 1515, 1455, 1410, 1235, 1160, 1045, 1015, 990, 900 és 830 cm^{-1} .

210. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3R,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-okt-1-inil)-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

2,9 mg (6,6 μmol) 211. példa szerint előállított savat a 186. példában leírtaknak megfelelően észterezünk, és az oldószer eltávolítása után 3 mg (6,6 μmol , 100 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3020, 2950, 2930, 2860, 2230, 1735, 1610, 1515, 1450, 1410, 1300, 1230, 1160, 1040, 1010, 995, 895 és 830 cm^{-1} .

211. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3R,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-okt-1-inil)-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav

17 mg (31,6 μmol) 212. példa szerint előállított poláros B alkoholt a 187. példában leírt módon reagáltatunk,

és feldolgozás és tisztítás után 10,2 mg (23 μ mol, 73 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3700-2400, 3070, 3050, 3010, 2950, 2930, 2870, 2860, 2230, 1710, 1610, 1515, 1455, 1410, 1295, 1235, 1160, 1045, 1015, 990, 895 és 830 cm^{-1} .

212. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3R,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-bróm-3-hidroxi-okt-1-enil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-11]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3R,4S))-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-(2-bróm-3-hidroxi-okt-1-enil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-11]-5-hepténsav-metil-észter (B)

80 mg (149 μ mol) 212a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 67 mg (125 μ mol, 84 %) szintelen olajat különítünk el, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3300, 3070, 3050, 3010, 2960, 2930, 2860, 1735, 1605, 1515, 1455, 1410, 1305, 1235, 1160, 1040, 995, 940, 895, 835 és 725 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 37 mg (68,8 μ mol, 46 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 27 mg (50,2 μ mol, 34 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

212a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-bróm-3-oxo-okt-1-enil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-11]-5-

-hepténsav-metil-észter

80,7 mg (224 μmol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 190a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-heptil)-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 80 mg (149 μmol , 67 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3070, 3050, 3010, 2950, 2930, 2870, 1735, 1685, 1600, 1510, 1450, 1435, 1365, 1305, 1230, 1160, 1045, 990, 900 és 830 cm^{-1} .

213. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-bróm-3-hidroxi-okt-1-enil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-11]-5-hepténsav

12,6 mg (23,4 μmol) 212. példa szerint előállított nempoláros A észter a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12 mg (22,9 μmol , 98 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2950, 2930, 2870, 2860, 1710, 1605, 1515, 1455, 1410, 1305, 1235, 1160, 1045, 995, 895, 830 és 725 cm^{-1} .

214. példa

(1R,4S,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-ciano-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-11]-5-hepténsav

19 mg 214a) példa szerint előállított észtereleget a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk,

és feldolgozás és tisztítás után 14,8 mg (31,9 μ mol, a 214a) példa szerinti kiindulási anyagra számítva 72 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3050, 3010, 2930, 2870, 2230, 1725, 1710, 1610, 1515, 1410, 1230, 1160, 1125, 995, 920, 895, 835 és 820 cm^{-1} .

214a) példa

(1R,4S,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-ciano-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-metil(illetve 4-ciano-benzil)-észter

16,1 mg (44,4 μ mol 17a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon 4-(bróm-metil)-benzonitrilrel reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 19 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3050, 3040, 3010, 2930, 2860, 2220, 1730, 1605, 1510, 1435, 1360, 1225, 1160, 1120, 1090, 1030, 895, 830 és 815 cm^{-1} .

215. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3R,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-bróm-3-hidroxi-okt-1-enil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav

8,8 mg (16,4 μ mol) 212. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 8,3 mg (15,9 μ mol, 97 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2950, 2930, 2870, 2860,
1710, 1610, 1515, 1455, 1410, 1300, 1235, 1165,
1040, 995, 940, 895, 835 és 725 cm^{-1} .

216. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,3S,-
4RS)-3-hidroxi-4,6-dimetil-okta-1-in-6-enil]-2-oxabicyclo-
[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

3,3 mg ($7\text{ }\mu\text{mol}$) 217. példa szerint előállított savat
a 186. példában leírtaknak megfelelően észterezünk, és az
oldószer eltávolítása után 3,2 mg ($6,6\text{ }\mu\text{mol}$, 94 %) cím sze-
rinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3050, 3010, 2960, 2930, 2870, 2230, 1735, 1605,
1515, 1455, 1235, 1160, 1040, 1020, 1000, 900
és 830 cm^{-1} .

217. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,3S,-
4RS)-3-hidroxi-4,7-dimetil-okta-1-in-6-enill-2-oxabicyclo-
[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

27 mg ($47,9\text{ }\mu\text{mol}$) 220. példa szerint előállított
nempoláros A alkoholt a 187. példában leírt módon reagálta-
tunk, és feldolgozás és tisztítás után 18 mg ($38,4\text{ }\mu\text{mol}$,
80 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj
formájában.

IR (film): 3600-2500, 3070, 3050, 3010, 2960, 2930, 2880,
2230, 1710, 1610, 1515, 1455, 1235, 1165, 1040,
1020, 990, 940, 900 és 830 cm^{-1} .

218. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,3R,-4RS)-3-hidroxi-4,7-dimetil-okta-1-in-6-enil]-2-oxabicyclo-[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

3 mg (6,4 μ mol) 219. példa szerint előállított savat a 186. példában leírtaknak megfelelően észterezünk, és az oldószer eltávolítása után 3 mg (6,2 μ mol, 97 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3010, 2960, 2930, 2880, 2230, 1730, 1610, 1515, 1455, 1410, 1375, 1300, 1265, 1235, 1160, 1040, 1020, 995, 940, 895, 830 és 815 cm^{-1} .

219. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,3R,-4RS)-3-hidroxi-4,7-dimetil-okta-1-in-6-enil]-2-oxabicyclo-[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

18 mg (31,9 μ mol) 220. példa szerint előállított poláros B alkoholt a 187. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 106 mg (22,6 μ mol, 71 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3700-2400, 3050, 3010, 2960, 2930, 2880, 2230, 1710, 1610, 1515, 1455, 1410, 1375, 1295, 1265, 1235, 1160, 1040, 1020, 990, 940, 895, 830 és 815 cm^{-1} .

220. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E/Z,3S,-4RS)-2-bróm-3-hidroxil-4,7-dimetil-okt-1,6-dienil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[(1E/Z,3R,-4RS)-2-bróm-3-hidroxil-4,7-dimetil-okt-1,6-dienil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (B)

50 mg (89 μ mol) 220a) példában leírt módon előállított telítetlen ketont a 23. példa szerint redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 48 mg (85,2 μ mol, 96 %) szintelen olajat különítünk el, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3010, 2960, 2920, 2870, 1730, 1605, 1510, 1450, 1435, 1375, 1230, 1160, 1040, 990, 895, 830 és 735 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 27 mg (47,9 μ mol, 54 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 18 mg (31,9 μ mol, 36 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

220a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E/Z,4RS)-2-bróm-3-oxo-4,7-dimetil-okt-1,6-dienil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

67,9 mg (188 μ mol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 190a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-3-(RS),6-dimetil-hept-5-enil)-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 50 mg (89 μ mol, 47 %) cím

szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3070, 3050, 3010, 2970, 2930, 2870, 1735, 1680,
1600, 1510, 1450, 1435, 1370, 1305, 1230, 1160,
1045, 985, 900 és 835 cm^{-1} .

221. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E/Z,3R,-
4RS)-2-bróm-3-hidroxi-4,7-dimetil-okt-1,6-dienil]-2-oxabicyclo-
[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

12 mg ($21,3\text{ }\mu\text{mol}$) 220. példa szerint előállított
poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk,
és feldolgozás és tisztítás után 9,3 mg ($16,9\text{ }\mu\text{mol}$, 79 %) cím
szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2950, 2920, 2870, 1710,
1605, 1510, 1455, 1420, 1375, 1230, 1160, 1045,
995, 895, 830 és 730 cm^{-1} .

222. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E/Z,3S,-
4RS)-2-bróm-3-hidroxi-4,7-dimetil-okt-1,6-dienil]-2-oxabicyclo-
[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

13,7 mg ($24,3\text{ }\mu\text{mol}$) 220. példa szerint előállított
nempoláros A észtert a 2. példában leírt módon észterezünk,
és feldolgozás és tisztítás után 11,8 mg ($21,5\text{ }\mu\text{mol}$, 88 %) cím
szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2950, 2930, 2870, 1710,
1605, 1515, 1455, 1420, 1305, 1230, 1160, 1040,
995, 895, 830 és 730 cm^{-1} .

223. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(3S)-3-hidroxi-3-ciklohexil-prop-1-inil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

3,5 mg (7,7 μmol) 224. példa szerint előállított savat a 186. példában leírtaknak megfelelően észterezünk, és feldolgozás és tisztítás után 3,5 mg (7,5 μmol , 97 %) cím szerinti vegyületet kapunk színtelen olaj formájában.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3010, 2940, 2860, 2230, 1735, 1605, 1510, 1445, 1265, 1230, 1160, 1015, 995, 895 és 835 cm^{-1} .

224. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(3S)-3-hidroxi-3-ciklohexil-prop-1-inill-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

29,6 mg (53,9 μmol) 227. példa szerint előállított nempoláros A alkoholt a 187. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 13,8 mg (30,4 μmol , 56 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2930, 2850, 2230, 1710, 1605, 1510, 1450, 1265, 1230, 1160, 1015, 990, 895, 830 és 735 cm^{-1} .

225. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(3R)-3-hidroxi-3-ciklohexil-prop-1-inill-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

2,8 mg (6,2 μ mol) 226. példa szerint előállított savat a 186. példában leírtaknak megfelelően észterezünk, és az oldószer eltávolítása után 2,9 mg (6,2 μ mol, 100 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-3200, 3070, 3050, 3010, 2940, 2850, 2230, 1735, 1605, 1515, 1450, 1410, 1295, 1235, 1160, 1045, 1010, 990, 940, 895 és 830 cm^{-1} .

226. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(3R)-3-hidroxi-3-ciklohexil-prop-1-inil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav

23,5 mg (42,8 μ mol) 227. példa szerint előállított poláros B alkoholt a 187. példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 11,5 mg (25,3 μ mol, 59 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3700-2400, 3070, 3050, 3010, 2930, 2850, 2230, 1710, 1610, 1515, 1450, 1410, 1295, 1235, 1160, 1045, 1015, 990, 940, 895, 830 és 815 cm^{-1} .

227. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E/Z,3S)-2-bróm-3-hidroxi-3-ciklohexil-prop-1-enil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[(1E/Z,3R)-2-bróm-3-hidroxi-3-ciklohexil-prop-1-enil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (B)

60 mg (110 μmol) 227a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 57,8 mg (105 μmol , 96 %) szintelen olajat kapunk, amely a cím szerinti két vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3000, 2930, 2850, 1730, 1605, 1510, 1450, 1230, 1160, 990, 895, 830 és 735 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 29,6 mg (53,9 μmol , 49 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 23,5 mg (42,8 μmol , 39 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

227a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E/Z)-2-bróm-3-oxo-ciklohexil-prop-1-enil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

70,7 mg (196 μmol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 190a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-2-ciklohexil-etil)-foszfónáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 60 mg (110 μmol , 56 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3050, 3000, 2930, 2850, 1735, 1680, 1600, 1510, 1445, 1435, 1370, 1305, 1235, 1160, 1045, 985, 900 és 830 cm^{-1} .

228. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E/Z,3R)-2-bróm-3-hidroxil-3-ciklohexil-prop-1-enil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-ill-5-hepténsav

14,7 mg (26,7 μ mol) 227. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12,6 mg (23,5 μ mol, 88 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában. IR (film): 3600-2400, 3070, 3040, 3010, 2930, 2850, 1710, 1600, 1510, 1450, 1435, 1230, 1160, 1045, 985, 900, 830 és 735 cm^{-1} .

229. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E/Z,3S)-2-bróm-3-hidroxi-3-ciklohexil-prop-1-enil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-ill-5-hepténsav

13,4 mg (24,4 μ mol) 227. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 11,6 mg (21,7 μ mol, 89 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként. IR (film): 3600-2400, 3040, 3010, 2930, 2850, 1710, 1605, 1510, 1450, 1435, 1225, 1160, 1040, 995, 895, 830 és 735 cm^{-1} .

230. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,3S)-3-hidroxi-3-ciklohexil)-prop-1-enil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[(1E,3R)-3-hidroxi-3-ciklohexil-prop-1-enil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (B)

39 mg (83,2 μmol) 230a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 33 mg (70 μmol , 84 %) szintelen olajat kapunk, amely a cím szerinti két vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3040, 3010, 2920, 2850, 1730, 1605, 1510, 1450, 1230, 1160, 995, 970, 895, 835 és 735 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 19 mg (40,4 μmol , 49 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 14 mg (29,7 μmol , 36 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

230a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E)-3-oxo-3-ciklohexil-prop-1-enil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

50,3 mg (140 μmol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-2-ciklohexil-etil)-foszfónáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 39 mg (83,2 μmol , 60 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3070, 3050, 3010, 2930, 2850, 1735, 1690, 1660, 1620, 1510, 1445, 1370, 1310, 1230, 1160, 995, 900 és 835 cm^{-1} .

231. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E,3S)-3-hidroxi-3-ciklohexil-prop-1-enil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

19 mg (40,4 μ mol) 230. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 18 mg (39,4 μ mol, 98 %) cím szerinti vegyületet kapunk viaszszerű anyag formájában.

IR (KBr): 3700-2300, 3050, 3010, 2930, 2860, 1710, 1610, 1515, 1450, 1235, 1160, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

232. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1R,3R)-3-hidroxi-3-ciklohexil-prop-1-enil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

14 mg (29,7 μ mol) 230. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12 mg (26,3 μ mol, 88 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3700-2400, 3050, 3010, 2930, 2850, 1710, 1610, 1515, 1450, 1410, 1300, 1235, 1160, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

233. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidroxi-4,4-trimetilenon-non-1,7-diinil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

2,6 mg (5,3 μ mol) 234. példa szerint előállított savat a 186. példában leírt módon észterezünk, és az oldószer eltávolítása után 2,3 mg (4,5 μ mol, 86 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-3200, 3040, 3000, 2980, 2940, 2870, 2230, 1735, 1610, 1515, 1450, 1410, 1300, 1230, 1160, 1040, 1015, 995, 895 és 835 cm^{-1} .

234. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-8-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidroxi-4,4-trimetilenon-non-1,7-diinil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-yl]-5-hepténsav

17 mg (28,9 μ mol) 237. példa szerint előállított nempoláros A alkoholt a 187. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 8,7 mg (17,7 μ mol, 61 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3040, 3020, 2980, 2940, 2880, 2230, 1710, 1610, 1515, 1450, 1410, 1295, 1230, 1160, 1040, 1015, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

235. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(R)-hidroxi-4,4-trimetilenon-non-1,7-diinil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

2,2 mg (4,5 μ mol) 236. példa szerint előállított savat a 186. példában leírt módon észterezünk, és az oldószer eltávolítása után 2,2 mg (4,3 μ mol, 96 %) cím szerinti vegyü-

letet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-3200, 3050, 2980, 2940, 2870, 2230, 1735,
1610, 1515, 1450, 1435, 1410, 1300, 1235, 1160,
1040, 1020, 995, 895 és 835 cm^{-1} .

236. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(R)-
-hidroxi-4,4-trimetilenon-non-1,7-diinil]-2-oxabicyklo [2.2.1]-
hept-5-il]-5-hepténsav

9,2 mg (15,7 μmol) 237. példa szerint előállított
poláros B alkoholt a 187. példában leírtaknak megfelelően
reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 4,8 mg (9,7 μmol ,
62 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj
formájában.

IR (film): 3600-2400, 3040, 2980, 2940, 2870, 2230, 1710,
1610, 1515, 1445, 1435, 1410, 1295, 1235, 1160,
1035, 1015, 995, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

237. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[1(E/Z,3S)-
-2-bróm-3-hidroxi-4,4-trimetilenon-non-1-én-7-inil]-2-oxa-
bicyklo [2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[1(E/Z,3R)-
-2-bróm-3-hidroxi-4,4-trimetilenon-non-1-én-7-inil]-2-oxa-
bicyklo [2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (B)

32 mg (54,6 μmol) 237a) példa szerint előállított
telítetlen ketont a 23. példában leírt módon redukálunk, és

feldolgozás és tisztítás után 28,5 mg (48,5 μmol , 89 %) szintelen olajat különítünk el, amely a cím szerinti két vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3050, 2940, 2860, 1730, 1605, 1510, 1435, 1230, 1160, 1040, 1015, 990, 895 és 835 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás után 17 mg (28,9 μmol , 53 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 9,2 mg (15,7 μmol , 29 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

237a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(E/Z)-2-bróm-3-oxo-4,4-trimetilenon-non-1-én-7-inil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

65,1 mg (181 μmol) 138b) példa szerint előállított aldehidet a 190a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-3,3-trimetilenon-okt-6-inil)-foszfonáttal reagáltattunk, és feldolgozás és tisztítás után 32 mg (54,6 μmol , 30 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3050, 2940, 2870, 1735, 1675, 1605, 1515, 1435, 1230, 1160, 1045, 900 és 835 cm^{-1} .

238. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E/Z,3R)-2-bróm-3-hidrox-4,4-trimetilenon-non-1-én-7-inil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav

9,9 mg (16,8 μmol) 237. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 8,8 mg (15,3 μmol , 86 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2959, 2930, 2860, 1710, 1605, 1510, 1440, 1230, 1160, 1040, 1015, 990 és 835 cm^{-1} .

239. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)- -[4-(4-Fluor-fenil)-6-[(1E/Z,3S)-2-bróm-3-hidroxi-4,4-trimetilenon-non-1-én-7-inil]-2-oxabicyklo[2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav

10,5 mg (17,9 μmol) 237. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 8,8 mg (15,3 μmol , 86 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2300, 3070, 3050, 3010, 2940, 2860, 1715, 1605, 1515, 1440, 1235, 1160, 1040, 1010, 990, 895 és 835 cm^{-1} .

240. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(1-naftil-metil-oxi-metil)-2-oxabicyklo[2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-metil(illetve 1-naftil-metil)-észter

16,4 mg (45,2 μmol) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 1-(klór-metil)-

-naftalinnal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 22,3 mg cim szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3070, 3050, 3010, 2930, 2870, 1735, 1605, 1595, 1515, 1230, 1160, 1115, 1095, 1075, 1030, 970, 895, 835, 800, 795 és 775 cm^{-1} .

241. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(1-naftil-metil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

22,3 mg 240. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12 mg (24,6 μmol , 240. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 54 %) cim szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2500, 3070, 3050, 3010, 2930, 2870, 1730, 1710, 1605, 1595, 1515, 1235, 1160, 1115, 1095, 1075, 1030, 975, 895, 835, 800, 795 és 775 cm^{-1} .

242. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-naftil-metil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil(illetve -2-naftil-metil)-észter

16,9 mg (46,6 μmol 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 2-(bróm-metil)-naftalinnal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után

23,4 mg cim szerinti vegyületet különitünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3040, 3010, 2930, 2870, 1735, 1605, 1510, 1230, 1160, 1125, 1090, 890, 855, 830, 815 és 750 cm^{-1} .

243. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-naftil-metil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

23,4 mg 242. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 20 mg ($40,9\text{ }\mu\text{mol}$, a 242. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 88 %) cim szerinti vegyületet különitünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2930, 2870, 1730, 1705, 1605, 1515, 1230, 1160, 1125, 1090, 895, 855, 830, 820 és 750 cm^{-1} .

244. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[2,4-bisz(trifluor-metil)-benzil-oxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil(illetve 2,4-bisz(trifluor-metil)-benzil)-észter

17,6 mg ($48,5\text{ }\mu\text{mol}$) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 2,4-bisz(trifluor-metil)-benzil-bromiddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 29,6 mg cim szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3050, 3010, 2930, 2870, 1735, 1625, 1605,
1515, 1345, 1300, 1275, 1235, 1175, 1130, 1085,
1055, 910, 900 és 835 cm^{-1} .

245. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[2,4-bisz-(trifluor-metil)-benzil-oxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav

29,6 mg 244. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 22 mg ($38,3 \mu\text{mol}$, a 244. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 79 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3000, 2930, 2870, 1730, 1710,
1630, 1610, 1515, 1345, 1300, 1275, 1235, 1175,
1130, 1085, 1055, 910 és 835 cm^{-1} .

246. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3,5-bisz-(trifluor-metil)-benzil-oxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil(illetve 3,5-bisz(trifluor-metil)-benzil)-észter

17,7 mg ($48,8 \mu\text{mol}$) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 3,5-bisz-(trifluor-metil)-benzil-bromiddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 26,5 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3050, 3000, 2940, 2870, 1735, 1620, 1605, 1510,
1455, 1435, 1380, 1355, 1280, 1230, 1175, 1130,
900, 885, 835, 705 és 680 cm^{-1} .

247. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3,5-bisz-(trifluor-metil)-benzil-oxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-
-il]-5-hepténsav

26,5 mg 246. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 23 mg (40 μmol , a 246. példa szerinti kiindulási vegyületre számítva 82 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2400, 3050, 3010, 2930, 2870, 1730, 1710,
1625, 1610, 1515, 1385, 1355, 1280, 1235, 1175,
1135, 890, 845, 835, 820, 705 és 685 cm^{-1} .

248. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-metil-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-
-il]-5-hepténsav-metil(illetve-3-metil-benzil)-észter

16,9 mg (46,6 μmol) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 3-metil-benzil-bromiddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 23,7 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3050, 3010, 2930, 2870, 1735, 1605, 1595, 1515,
1235, 1160, 1115, 1090, 1025, 975, 895, 835, 785
és 700 cm^{-1} .

249. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-metil-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

23,7 mg 248. példa szerinti észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 17,4 mg (38,4 μ mol, a 248. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 82 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3700-2400, 3050, 3010, 2930, 2870, 1730, 1710, 1610, 1595, 1515, 1235, 1160, 1115, 1090, 1030, 975, 895, 835, 785 és 695 cm^{-1} .

250. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-metil-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil(illetve 4-metil-benzil)-észter

18,5 mg (51 μ mol) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 4-metil-benzil-bromiddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 24,2 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3050, 3000, 2950, 2930, 2870, 1735, 1610, 1595, 1515, 1455, 1410, 1360, 1295, 1230, 1160, 1120, 1090, 1030, 1020, 970, 895, 830, 815 és 805 cm^{-1} .

251. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-metil-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

24,2 mg 250. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 19,9 mg ($44 \mu\text{mol}$, a 250. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 86 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2940, 2870, 1730, 1710, 1610, 1515, 1455, 1410, 1360, 1300, 1230, 1160, 1115, 1090, 1030, 1020, 970, 895, 830, 820 és 805 cm^{-1} .

252. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[4-(benzil-oxi)-benzil-oxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil(illetve 4-(benzil-oxi)-benzil)-észter

21,4 mg ($59 \mu\text{mol}$) 120a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 4-(benzil-oxi)-benzil-kloriddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 32 mg cím szerinti vegyületet kapunk színtelen olajként.

IR (film): 3060, 3030, 3010, 2930, 2860, 1735, 1610, 1585, 1515, 1450, 1300, 1235, 1165, 1115, 1090, 1080, 1025, 895, 830, 820, 740 és 700 cm^{-1} .

253. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[4-(benzil-oxi)-benzil-oxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

32 mg 252. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 25,8 mg ($47,4 \mu\text{mol}$, a 252. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 80 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3060, 3030, 3000, 2930, 2860, 1730, 1705, 1610, 1585, 1510, 1450, 1300, 1235, 1170, 1160, 1115, 1090, 1080, 1025, 895, 830, 820, 740 és 695 cm^{-1} .

254. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-[3(S)-hidroxi-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

17 mg ($36,6 \mu\text{mol}$) 256. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 16 mg ($35,5 \mu\text{mol}$, 97 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2300, 3080, 3060, 3010, 2950, 2930, 2880, 2860, 2230, 1710, 1600, 1490, 1455, 1445, 1405, 1305, 1240, 1200, 1120, 1015, 995, 970, 895, 755 és 690 cm^{-1} .

255. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-[3(R)-hidroxi-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

16 mg (34,4 μ mol) 256. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12,7 mg (28,2 μ mol, 82 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2400, 3080, 3060, 3010, 2960, 2930, 2870, 2860, 2230, 1710, 1600, 1490, 1455, 1445, 1300, 1240, 1200, 1015, 995, 970, 895, 755 és 695 cm^{-1} .

256. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-[3(S)-hidroxi-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(2-fenil-etinil)-6-[3(R)-hidroxi-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (B)

39 mg (84,3 μ mol) 256a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 36,5 mg (78,6 μ mol, 93 %) színtelen olajat különítünk el, amely a cím szerinti két vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3070, 3050, 3010, 2950, 2930, 2860, 2220, 1735, 1595, 1490, 1440, 1360, 1300, 1240, 1195, 1155, 1070, 1010, 995, 970, 895, 755 és 690 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 17 mg (36,6 μ mol, 43 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerke-

zetet rendeljük, és 16 mg (34,4 μmol , 41 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

256a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-[3-oxo-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

52 mg (142 μmol) 256b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-heptil)-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 39 mg (84,3 μmol , 59 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3070, 3050, 2950, 2930, 2870, 2230, 1735, 1690, 1670, 1620, 1595, 1490, 1450, 1440, 1365, 1310, 1240, 1190, 1170, 1070, 1010, 995, 975, 895, 755 és 690 cm^{-1} .

256b) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-formil-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

55,7 mg (151 μmol) 256c) példa szerint előállított alkoholt a 38b) példában leírtaknak megfelelően oxidálunk, és feldolgozás és tisztítás után 52 mg (142 μmol , 94 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3080, 3050, 3010, 2950, 2930, 2870, 2720, 2230, 1735, 1715, 1595, 1490, 1440, 1360, 1310, 1245, 1190, 1170, 1070, 1025, 980, 895, 755 és 690 cm^{-1} .

256c) példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(hidroximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

5,3 g (19,2 mmol) enantiomer Corey-laktont a 11a)-11g) és 1h)-11) példákban leírt módon reagáltatunk, és ily módon 208 mg (564 μ mol, 2,9 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-3200, 3070, 3050, 2950, 2930, 2870, 2230, 1735, 1490, 1440, 1365, 1300, 1245, 1200, 1155, 1065, 1025, 1000, 890, 755 és 690 cm^{-1} .

257. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(benziloximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil- (illetve benzil)-észter

17,8 mg (48,3 μ mol) 256c) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően benzil-kloriddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 18 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3090, 3060, 3020, 3000, 2930, 2870, 2230, 1730, 1595, 1490, 1450, 1360, 1305, 1210, 1150, 1110, 1070, 1005, 895, 755, 735 és 695 cm^{-1} .

258. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(benziloximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

18 mg 257. példa szerint előállított észtert a 2.

példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 16,7 mg (37,6 μmol , a 257. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 78 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 2230, 1730, 1705, 1600, 1490, 1450, 1440, 1365, 1305, 1240, 1210, 1110, 1070, 1005, 895, 755, 735 és 695 cm^{-1} .

259. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(4-ciano-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil(illetve 4-ciano-benzil)-észter

16,9 mg (45,9 μmol) 256c) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 4-(bróm-metil)-benzonitrillel reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 20 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3060, 3000, 2940, 2870, 2220, 1730, 1610, 1600, 1440, 1360, 1210, 1105, 1005, 895, 820, 755 és 690 cm^{-1} .

260. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(4-ciano-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

20 mg 259. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás

és tisztítás után 18 mg (38 μ mol, a 259. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 84 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2300, 3080, 3050, 3000, 2930, 2870, 2850, 2230, 1710, 1610, 1600, 1490, 1445, 1310, 1280, 1210, 1110, 1005, 895, 820, 760 és 690 cm^{-1} .

261. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3S,4S))-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-ill-5-hepténsav

11,2 mg (22,9 μ mol) 263. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 10 mg (21,1 μ mol, 92 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2500, 3070, 3050, 3030, 3010, 2970, 2930, 2850, 2230, 1710, 1605, 1490, 1455, 1390, 1240, 1195, 1015, 990, 970, 895, 755 és 690 cm^{-1} .

262. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3R,4S))-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-ill-5-hepténsav

18,1 mg (37 μ mol) 263. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk,

és feldolgozás és tisztítás után 14,7 mg (31 μmol , 84 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3050, 3030, 3010, 2970, 2930, 2850, 2230, 1710, 1600, 1490, 1455, 1390, 1240, 1200, 1015, 990, 970, 890, 755 és 690 cm^{-1} .

263. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3S,4S))-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3R,4S))-7-[4-(2-(fenil-etinil)-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (B)

32 mg (65,8 μmol) 263a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 31,1 mg (63,6 μmol , 97 %) szintelen olajat kapunk, amely a cím szerinti két vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3080, 3050, 2970, 2950, 2930, 2870, 2850, 2220, 1730, 1595, 1450, 1435, 1265, 1195, 1155, 1010, 995, 970, 890, 755, 735 és 690 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 11,2 mg (22,9 μmol , 35 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 18,1 mg (37,0 μmol , 56 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

263a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,4S))-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(3-oxo-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

48,6 mg (133 μ mol) 256b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-3S-metil-okt-5-in)-foszfónáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 32 mg (65,8 μ mol, 50 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3050, 2970, 2930, 2870, 2230, 1735, 1685, 1665, 1615, 1450, 1435, 1240, 1160, 1040, 1015, 985, 895, 755, 735 és 695 cm^{-1} .

264. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3S,4S))-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

2,5 mg (5,3 μ mol) 265. példa szerint előállított savat a 186. példában leírt módon észterezünk, és az oldószer eltávolítása után 2,5 mg (5,1 μ mol, 97 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-3200, 3080, 3060, 3030, 3010, 2970, 2930, 2880, 2230, 1735, 1605, 1490, 1450, 1410, 1320, 1305, 1290, 1270, 1240, 1160, 1020, 990, 895, 760 és 690 cm^{-1} .

265. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3S,4S))-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-
-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-
-5-ill-5-hepténsav

23,9 mg (42,1 μmol) 268. példa szerint előállított
nempoláros alkoholt a 187. példában leírtaknak megfelelően
reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 11,7 mg (24,8
 μmol , 59 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen
olajként.

IR (film): 3600-2400, 3060, 3030, 3010, 2970, 2940, 2880,
2230, 1705, 1600, 1490, 1455, 1445, 1410, 1320,
1305, 1280, 1240, 1155, 1020, 990, 895, 760 és
690 cm^{-1} .

266. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3R,4S))-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-
-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-
-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

2,9 mg (6,1 μmol) 267. példa szerint előállított
savat a 186. példában leírt módon észterezünk, és az oldó-
szer eltávolítása után 3 mg (6,1 μmol , 100 %) cím szerinti
észtert kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-3200, 3070, 3050, 3030, 3010, 2970, 2930,
2880, 2230, 1735, 1600, 1490, 1450, 1410, 1320,
1305, 1290, 1270, 1240, 1160, 1020, 990, 895,
760 és 690 cm^{-1} .

267. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3R,4S))-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

25,7 mg (45 μmol) 268. példa szerint előállított poláros B alkoholt a 187. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 15,5 mg (32,8 μmol , 73 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3700-2400, 3080, 3060, 3030, 3010, 2970, 2930, 2880, 2230, 1710, 1600, 1490, 1455, 1410, 1320, 1305, 1290, 1270, 1240, 1155, 1020, 990, 895, 760 és 690 cm^{-1} .

268. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3S,4S))-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(2-bróm-3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3R,4S))-7-[4-(2-fenil-etinil)-6-(2-bróm-3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (B)

58 mg (102 μmol) 268a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírt módon redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 52,8 mg (93 μmol , 91 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3080, 3050, 2970, 2950, 2930, 2880, 2230, 1735, 1595, 1490, 1450, 1435, 1315, 1240, 1200, 1155, 1025, 1010, 990, 895, 755, 735 és 690 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 23,9 mg (42,1 μmol , 41 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük és 25,7 mg (45 μmol , 45 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

268a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,4S))-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(2-bróm-3-oxo-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

39,5 mg (108 μmol) 256b) példa szerint előállított aldehidet a 190a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-3S-metil-okt-5-in)-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 58 mg (102 μmol , 94 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3080, 3050, 2970, 2950, 2930, 2880, 2230, 1730, 1685, 1600, 1485, 1450, 1435, 1310, 1265, 1240, 1160, 1070, 1015, 985, 895, 755, 735 és 690 cm^{-1} .

269. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3S,4S))-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(2-bróm-3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

10,2 mg (18 μmol) 268. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírt módon elszappanosí-

tunk, és feldolgozás és tisztítás után 8,5 mg (15,4 μ mol, 85 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2400, 3070, 3050, 2970, 2950, 2930, 2880, 2230, 1705, 1595, 1490, 1450, 1435, 1315, 1240, 1200, 1160, 1025, 1010, 990, 895, 755, 735 és 695 cm^{-1} .

270. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3R,4S))-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-(2-bróm-3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

12,3 mg (21,7 μ mol) 268. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 10,6 mg (19,1 μ mol, 88 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3050, 2970, 2950, 2930, 2880, 2230, 1710, 1595, 1495, 1450, 1435, 1315, 1240, 1200, 1160, 1025, 1010, 990, 895, 755, 735 és 690 cm^{-1} .

271. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-[4-(benzil-oxi)-benzil-oxi-metil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil(illetve 4-(benzil-oxi)-benzil)-észter

28 mg (76 μ mol) 256c) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 4-(benzil-oxi)-benzil-kloriddal reagáltatunk, és feldolgozás és tiszt-

titás után 36 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3030, 3010, 2930, 2880, 2230, 1735, 1610, 1580, 1510, 1445, 1295, 1240, 1170, 1110, 1080, 1025, 1005, 895, 825, 760, 740 és 695 cm^{-1} .

272. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(2-Fenil-etinil)-6-[4-(benzil-oxi)-benzil-oxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

36 mg 271. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 28,4 mg (51,6 μmol , a 271. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 68 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3060, 3030, 3010, 2930, 2880, 2230, 1730, 1710, 1610, 1585, 1510, 1300, 1240, 1170, 1105, 1080, 1025, 1005, 895, 825, 760, 740 és 695 cm^{-1} .

273. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

9,2 mg 274. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 5,8 mg (12,6 μmol , a 274. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 31 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3700-2400, 3070, 3040, 2930, 2870, 1730, 1605,
1510, 1225, 1115, 895 és 830 cm^{-1} .

274. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fluor-
-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-3-oxa-5(Z)-
-hepténsav-terc-butyl(illetve 4-fluor-benzil)-észter

16,5 mg (40 μmol) 274a) példa szerint előállított
alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk,
és feldolgozás és tisztítás után 9,2 mg cím szerinti vegyü-
letet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3050, 2980, 2930, 2870, 1745, 1605, 1510, 1370,
1265, 1225, 1160, 1120, 1030, 830 és 735 cm^{-1} .

274a) példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(hidrox-
-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-3-oxa-5(Z)-hepténsav-
-terc-butyl-észter

686 mg (1,06 mmol) 274b) példa szerint előállított
vegyületet az 1a) példában leírtaknak megfelelően reagálta-
tunk, és feldolgozás és tisztítás után 385 mg (947 μmol ,
89 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj
formájában.

IR (film): 3600-3200, 3040, 2970, 2920, 2870, 1740, 1605,
1510, 1365, 1230, 1160, 1130, 1025, 970, 895 és
735 cm^{-1} .

274b) példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(Z)-hepténsav-terc-butil-észter

580 mg (1,09 mmol) 274c) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon bróm-ecetsav-terc-butil-észterrel reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 686 mg (1,06 mmol, 97 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3050, 3040, 3010, 2970, 2930, 2850, 1745, 1605, 1590, 1510, 1470, 1425, 1390, 1365, 1295, 1225, 1160, 1130, 1110, 940, 895, 830, 820, 740 és 700 cm^{-1} .

274c) példa

(1S,4R,5S,6R)-4-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-2-(Z)-butenol

620 mg (1,11 mmol) 274d) példa szerint előállított A észtert a 274j) példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás után 581 mg (1,09 mmol, 99 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-3200, 3070, 3040, 3010, 2950, 2930, 2860, 1605, 1590, 1510, 1470, 1425, 1265, 1230, 1160, 1110, 1025, 1015, 895, 830, 820, 735 és 700 cm^{-1} .

274d) példa

(1S,4R,5S,6R)-4-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-2(Z)-buténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S,6R)-4-[4-(4-fluor-fenil)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-2(E)-buténsav-metil-észter (B)

1,25 ml bisz(2,2,2-trifluor-etil)-metoxi-karbonil-metil-foszfónát 30 ml vízmentes tetrahidrofuránnal készült oldatához 1,96 g 18-korona-6-étert adunk, száraz argon atmoszférában lehűtjük az elegyet -70°C -ra és 5,9 ml 1 mólos tetrahidrofurános nátrium-hexametil-diszilazid oldatot csepegtetünk hozzá. 15 percig hagyjuk a komponenseket reagálni, és aztán a 274e) példában előállított 748 mg (1,48 mmol) aldehid 15 ml vízmentes tetrahidrofuránnal készült oldatát adjuk hozzá és 2,5 órán át -70°C és -60°C közötti hőmérsékleten keverjük. Ezután a reakcióelegyet telített ammónium-klorid-oldatra öntjük, több alkalommal dietil-éterrel extraháljuk, vízzel és telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, majd magnézium-szulfáton szárítjuk. A szűrés és bepárlás után kapott maradékot 100 ml kvasavgelen, n-hexán és etil-acetát grádiens-eleggyével eluálva kromatográfiásan tisztítjuk. Ily módon 622 mg (1,11 mmol, 75 %) cím szerinti A vegyületet és 54 mg (96,6 μmol , 7 %) cím szerinti B vegyületet különítünk el.

IR (film): A vegyület: 3070, 3040, 2950, 2930, 2860, 1720, 1645, 1605, 1590, 1510, 1425, 1230, 1205, 1170, 1110, 1085, 1025, 895, 820, 740 és 700 cm^{-1} .

IR (film): B vegyület: 3070, 3040, 2950, 2930, 2860, 1720, 1655, 1645, 1605, 1590, 1510, 1425, 1265, 1230, 1160, 1110, 1085, 1025, 1015, 895, 830, 820, 740 és 700 cm^{-1} .

274e) példa

(1S,4R,5S,6R)-2-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-1-oxo-etán

748 mg (1,48 mmol) 274f) példa szerint előállított alkoholt a 38b) példában leírt módon oxidálunk, és a feldolgozás után 748 mg (1,48 mmol, 100 %) cím szerinti vegyületet kapunk halványsárga olaj alakjában, amelyet tisztítás nélkül reagáltatunk tovább.

274f) példa

(1S,4R,5S,6R)-2-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-1-hidroxi-etán

1,03 g (1,68 mmol) 274g) példa szerint előállított benzoátot a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 748 mg (1,48 mmol, 88 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3600-3200, 3070, 3050, 2920, 2850, 1605, 1590,
1510, 1465, 1425, 1260, 1230, 1160, 1110, 1075,
1065, 1015, 975, 935, 895, 830, 820, 740. és 700 cm^{-1} .

274g) példa

(1S,4R,5S,6R)-2-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-il]-1-benzoil-oxi-etán

1,11 g (1,76 mmol) 274h) példa szerint előállított diolt az 1b) példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 1,03 g (1,68 mmol, 95 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3050, 2950, 2930, 2850, 1775, 1715, 1600,
1585, 1510, 1465, 1450, 1425, 1270, 1230, 1110,
1070, 1020, 830, 740 és 705 cm^{-1} .

274h) példa

(1R,2S,3R,4S)-2-[1-(Hidroxi-metil)-1-(4-fluor-fenil)-3-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-4-hidroxi-ciklopentán-2-il]-benzoil-oxi-etán

1,79 g (2,17 mmol) 274i) példában előállított benzoátot az 1c) példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 1,11 g (1,76 mmol, 81 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3070, 3050, 2950, 2930, 2850, 1775, 1715, 1600,
1585, 1510, 1470, 1450, 1425, 1270, 1235, 1110,
1070, 1045, 825, 740 és 705 cm^{-1} .

274i) példa

(1R,2S,3R,4S)-2-[1-(terc-Butil-dimetil-szililoxi-metil)-
-1-(4-fluor-fenil)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-
-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-ciklopentán-2-il]-1-benzoil-oxi-
-etán

1,70 g (2,36 mmol) 274j) példa szerint előállított alkoholt 17 ml vízmentes piridinben oldunk, 850 μ l benzoil-kloridot adunk az oldathoz és a komponenseket 4 órán át 23°C-on hagyjuk reagálni száraz argon atmoszférában. Ezután a reakcióelegyet dietil-éterrel higitjuk, több alkalommal jegesvízzel mossuk, magnézium-szulfáton szárítjuk, majd szűrés után az oldószert eltávolítjuk. A maradékot kb. 75 ml kovasavgélen kromatográfiásan tisztítjuk. Eluálószerként n-hexán és dietil-éter gradiens-elegyét használjuk. Ily módon 1,79 g (2,17 mmol, 92 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3050, 2950, 2860, 1715, 1600, 1585, 1510,
1475, 1450, 1425, 1270, 1250, 1110, 1025, 875,
840, 740 és 705 cm^{-1} .

274j) példa

(1R,2S,3R,4S)-2-[1-(terc-Butil-dimetil-szilil-oxi-metil)-1-(4-fluor-fenil)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-ciklopentán-2-il]-1-hidroxi-etán

1,77 g (2,36 mmol) 274k) példa szerint előállított vegyületet 30 ml vízmentes toluolban oldunk, száraz argon atmoszférában 0-5°C-ra hűtjük az oldatot és 8,3 ml 1 mólos

toluolos diizobutil-aluminium-hidrid-oldatot adunk hozzá. A komponenseket 30 percig hagyjuk reagálni, majd a reakcióelegyet az 1e) példában leírt módon feldolgozzuk. Így 1,70 g (2,36 mmol, 100 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-3400, 3070, 3050, 2940, 2860, 1605, 1590, 1470, 1425, 1265, 1250, 1235, 1165, 1130, 1110, 1075, 1025, 875, 840, 740 és 705 cm^{-1} .

274k) példa

(1R,2S,3R,4S)-2-[1-(terc-Butil-dimetil-szilil-oxi-metil)-1-(4-fluor-fenil)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-ciklopentán-2-ill-etánsav-metil-észter

1,55 g (2,44 mmol) 274l) példa szerint előállított hidroxizsót a 11. példában leírtaknak megfelelően terc-butyl-dimetil-klór-szilánnal reagáltatunk, és feldolgozás és kromatográfiás tisztítás után 1,77 g (2,36 mmol, 97 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3070, 3040, 2940, 2850, 1735, 1600, 1585, 1510, 1465, 1425, 1250, 1235, 1160, 1110, 1075, 1030, 1020, 875, 840, 740 és 700 cm^{-1} .

274l) példa

(1R,2S,3R,4S)-2-[1-(Hidroxizsót)-1-(4-fluor-fenil)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropirán-2-il-oxi)-ciklopentán-2-ill-etánsav-metil-észter

1,48 g (2,46 mmol) 274m) példa szerint előállított laktont 15 ml tetrahidrofuranban oldunk, 15 ml 1 n kálium-hidroxid-oldatot adunk hozzá és 16 órán át 23°C-on erőteljesen keverjük az elegyet. A szerves oldószert ledesztilláljuk, a vizes fázist jéghideg telített citromsavval pH 4-5-re savanyítjuk, gyorsan több alkalommal diklór-metánnal extraháljuk, és az egyesített extraktumokat egy előre lehűtött éteres diazometán-oldathoz csepegtetjük. A reakcióelegyet ezután magnézium-szulfáton szárítjuk, szűrjük és az oldószer eltávolítása után 1,55 g (2,44 mmol, 99 %) cím szerinti vegyületet kapunk halványsárga olaj formájában, amelyet gyorsan, tisztítás nélkül reagáltatunk tovább.

274m) példa

(1R,6S,7R,8S)-1-(4-Fluor-fenil)-7-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropiran-2-il-oxi)-3-oxabicyclo [4.3.0]nonán-4-on

1,007 g (1,66 mmol) (1R,4RS,6S,7R,8S)-1-(4-fluor-fenil)-4-hidroxi-7-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropirán-2-il-oxi)-3-oxabicyclo [4.3.0]nonánt, amelyet enantiomer Corey laktonból a 120. példában leírtaknak megfelelően állítunk elő, 20 ml vizmentes acetonban oldunk, száraz argon atmoszférában -30°C-ra hűtünk és 1 ml standardizált Jones-oldatot adunk hozzá, majd -30°C-on 2 órán át keverjük az elegyet. A feldolgozást az 11) példában leírt módon végezzük. Így 994 mg (1,65 mmol, 99 %) cím szerinti vegyületet különítünk el halványsárga olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3040, 2940, 2850, 1750, 1605, 1580, 1510,
1465, 1425, 1260, 1235, 1110, 1080, 1030, 970,
820, 740 és 700 cm^{-1} .

275. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(E)-hepténsav

17,4 mg 276. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12,2 mg (26,6 μmol , a 276. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 54 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3040, 2920, 2860, 1730, 1605,
1515, 1225, 1160, 1115, 970, 900 és 830 cm^{-1} .

276. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(E)-hepténsav-terc-butyl(illetve 4-fluor-benzil)-észter

20,2 mg (49 μmol) 276a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 17,4 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3070, 3040, 2980, 2930, 2860, 1745, 1605, 1510,
1365, 1225, 1160, 1125, 1025, 970, 895 és 830 cm^{-1} .

276a) példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(hidroxil-metil)-
-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(E)-hepténsav-terc-bu-
til-észter

388 mg (602 μ mol) 276b) példa szerint előállított
vegyületet az 1a) példában leírtaknak megfelelően reagáltat-
tunk, és feldolgozás és tisztítás után 218 mg (536 μ mol, 98 %)
cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj alakjá-
ban.

IR (film): 3600-3200, 3070, 3040, 2970, 2920, 2870, 1740,
1605, 1510, 1365, 1300, 1230, 1160, 1130, 1025,
970, 895, és 835 cm^{-1} .

276b) példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(terc-butyl-
-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-3-
-oxa-5(E)-hepténsav-terc-butyl-észter

364 mg (686 μ mol) 276c) példa szerint előállított
A vegyületet az 1. példában leírt módon bróm-ecetsav-terc-
-butyl-észterrel éterezünk, és feldolgozás és tisztítás után
388 mg (602 μ mol, 88 %) cím szerinti vegyületet különítünk
el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3090, 3070, 3040, 3010, 2950, 2930, 2860, 1745,
1605, 1590, 1510, 1470, 1425, 1390, 1365, 1295,
1225, 1160, 1130, 1110, 895, 830, 820, 740 és
700 cm^{-1} .

276c) példa

(1S,4R,5S,6R)-4- [4-(4-Fluor-fenil)-6-(terc-butil-
-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-
-2(E)-butenol (A) és

(1S,4R,5S,6R)-4- [4-(4-fluor-fenil)-6-(terc-butil-
-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-
-2(Z)-butenol (B)

506 mg (883 μ mol) 276d) példa szerint előállított
vegyületet a 274j) példában leírtaknak megfelelően reduká-
lunk, és feldolgozás és kb. 100 ml kovasavgélen n-hexán és
etil-acetát gradienselegyével végzett kromatográfiás tiszt-
ítás után 374 mg (705 μ mol, 80 %) cím szerinti A vegyüle-
tet és 25 mg (47 μ mol, 5 %) cím szerinti B vegyületet külö-
nitünk el színtelen olaj alakjában.

IR (film): A vegyület: 3600-3200, 3070, 3050, 3010, 2950,
2920, 2850, 1605, 1590, 1510, 1470,
1425, 1265, 1230, 1160, 1110, 1025,
1000, 970, 895, 825, 735 és 705 cm^{-1} .

IR (film): B vegyület: 3600-3200, 3070, 3050, 3010, 2950,
2920, 2850, 1605, 1590, 1510, 1470,
1425, 1265, 1230, 1160, 1110, 1025,
1015, 1000, 890, 830, 820, 735 és
705 cm^{-1} .

276d) példa

(1S,4R,5S,6R)-4- [4-(4-Fluor-fenil)-6-(terc-butil-
-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-2(E)-
-buténsav-etil-észter (A) és

(1S,4R,5S,6R)-4-[4-(4-fluor-fenil)-6-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1 [hept-5-yl]-2(Z)-buténsav-etil-észter (B)

683 mg (1,16 mmol) 276e) példa szerint előállított diolt az 1b) példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 516 mg (901 μ mol, 78 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában. IR (film): 3070, 3050, 3010, 2950, 2930, 2860, 1715, 1650, 1605, 1590, 1510, 1465, 1425, 1390, 1365, 1315, 1265, 1230, 1160, 1110, 895, 830, 820, 740 és 705 cm^{-1} .

276e) példa

(1R,2S,3R,4S)-4-[1-(Hidroxi-metil)-1-(4-fluor-fenil)-3-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-4-hidroxi-ciklopentán-2-yl]-2(E)-buténsav-etil-észter és

(1R,2S,3R,4S)-4-[1-(hidroxi-metil)-1-(4-fluor-fenil)-3-(terc-butil-difenil-szilil-oxi-metil)-4-hidroxi-ciklopentán-2-yl]-2(Z)-buténsav-etil-észter

902 mg (1,34 mmol) 276f) példa szerint előállított észterelegyet az 1c) példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 683 mg (1,16 mmol, 86 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában. IR (film): 3600-3200, 3070, 3050, 2950, 2930, 2850, 1710, 1645, 1605, 1585, 1510, 1465, 1425, 1265, 1235, 1160, 1110, 1045, 825, 740 és 700 cm^{-1} .

276f) példa

(1R,2S,3R,4S)-4-[1-(Hidroxi-metil)-1-(4-fluor-fenil)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropirán-2-il-oxi)-ciklopentán-2-il]-2(E)-buténsav-etil-észter és

(1R,2S,3R,4S)-4-[1-(hidroxi-metil)-1-(4-fluor-fenil)-3-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-4-(tetrahidropirán-2-il-oxi)-ciklopentán-2-il]-2(Z)-buténsav-etil-észter

969 mg (1,60 mmol) (1R,4RS,6S,7R,8S)-1-(4-fluor-fenil)-4-hidroxi-7-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi-metil)-8-(tetrahidropirán-2-il-oxi)-3-oxa-biciklo[4.3.0]nonánt, amelyet az 1f)-1l) példákban leírt módon enantiomer Corey-laktonból (ld. a 120a) példát) állítunk elő, 3 ml vizmentes toluolban oldunk, 1,67 g etoxi-karbonil-etil-trifenil-foszfóránt adunk hozzá, és az elegyet száraz argon atmoszférában 36 órán át 80°C-on melegítjük. Lehűtés után közvetlenül kromatográfiásan tisztítjuk az elegyet, amelyhez kb. 70 ml kovásvágyó és n-hexánból és dietil-éterből álló gradienselegyet használunk. Ily módon 902 mg (1,34 mmol, 84 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3400, 3070, 3040, 2940, 2860, 1710, 1645, 1600, 1585, 1510, 1465, 1425, 1365, 1265, 1230, 1200, 1160, 1110, 1070, 1030, 870, 820, 755 és 700 cm⁻¹.

277. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[2-(4-fluor-fenoxi)-etoxi-metil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-il]-3-oxa-5(E)-hepténsav

20,3 mg (50 μ mol) 276a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 9,2 mg (19 μ mol, 38 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3050, 2930, 1735, 1605, 1510, 1455, 1250, 1225, 1210, 1130, 895, 830 és 745 cm^{-1} .

278. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[2-(4-fluor-fenoxi)-etoxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(E)-hepténsav-metil-észter

3 mg (6 μ mol) 277. példa szerint előállított savat a 186. példában leírtaknak megfelelően észterezünk, és feldolgozás után 3 mg cím szerinti vegyületet kapunk színtelen olajként.

IR (film): 3070, 3050, 2930, 2870, 1745, 1605, 1510, 1455, 1295, 1250, 1225, 1210, 1166, 1130, 1030, 970, 895, 830 és 745 cm^{-1} .

279. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[2-(4-fluor-fenoxi)-etoxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(Z)-hepténsav

17,7 mg (44 μ mol) 274a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 8,7 mg (19 μ mol, 41 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2400, 3070, 3050, 3010, 2920, 2870, 1730,
1605, 1510, 1455, 1295, 1250, 1220, 1210, 1160,
1130, 1100, 1030, 895, 830 és 745 cm^{-1} .

280. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[2-(4-fluor-
-fenoxi)-etoxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-
-5(Z)-hepténsav-metil-észter

3,1 mg (6 μmol) 277. példa szerint előállított sa-
vat a 186. példában leírt módon észterezünk, és feldolgozás
után 3 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alak-
jában.

IR (film): 3110, 3070, 3050, 3010, 2930, 2870, 1745, 1605,
1510, 1455, 1425, 1295, 1250, 1225, 1210, 1160,
1130, 1100, 1030, 895, 830 és 745 cm^{-1} .

281. példa

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidroxi-
-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(E)-
-hepténsav

12 mg (24 μmol) 283. példa szerint előállított nem-
poláros A észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően el-
szappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 9,4 mg
(21 μmol , 88 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szinte-
len olajként.

IR (film): 3600-2400, 3040, 2950, 2930, 2870, 2860, 1725,
1605, 1515, 1455, 1425, 1230, 1160, 1115, 995,
970, 895, 835 és 755 cm^{-1} .

282. példa

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(R)-hidroxil-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(E)-hepténsav

13 mg (26 μ mol) 283. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 9,5 mg (21 μ mol, 82 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3040, 2950, 2930, 2860, 1725, 1610, 1515, 1425, 1235, 1160, 1115, 1000, 970, 895, 835 és 755 cm^{-1} .

283. példa

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidroxil-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(E)-hepténsav-terc-butil-észter (A) és

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[3(R)-hidroxil-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(E)-hepténsav-terc-butil-észter (B)

26,7 mg (53 μ mol) 283a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 26 mg (52 μ mol, 98 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3040, 2970, 2950, 2930, 2860, 1745, 1605, 1510, 1365, 1230, 1160, 1130, 965, 895 és 835 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 12 mg (24 μ mol, 45 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 13 mg (26 μ mol, 48 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

283a) példa

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3-oxo-1(E)-
-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(E)-hepténsav-
-terc-butyl-észter

40,9 mg (101 μ mol) 283b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-
-oxo-heptil)-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és
tisztítás után 26,7 mg (53 μ mol, 53 %) cím szerinti vegyületet
különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3040, 2970, 2950, 2930, 2870, 1745, 1690, 1670,
1620, 1510, 1365, 1225, 1160, 1130, 995, 970,
900 és 835 cm^{-1} .

283b) példa

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-formil-2-oxa-
bicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(E)-hepténsav-terc-butyl-
-észter

83 mg (204 μ mol) 276a) példa szerinti alkoholt a
38b) példában leírt módon oxidálunk, és feldolgozás után 83 mg
(204 μ mol, 100 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen
olaj alakjában, amelyet tisztítás nélkül reagáltatunk tovább.

284. példa

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidroxi-
-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(Z)-
-hepténsav

18 mg (36 μ mol) 286. példa szerint előállított nem-
poláros A észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően el-
szappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12 mg (27 μ mol,
75 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj-
ként.

IR (film): 3700-2400, 3070, 3050, 3010, 2950, 2930, 2870,
2860, 1730, 1610, 1515, 1455, 1425, 1300, 1230,
1160, 1120, 1000, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

285. példa

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(R)-hidroxi-
-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(Z)-hep-
ténsav

22 mg (44 μ mol) 286.példa szerint előállított po-
láros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk,
és feldolgozás és tisztítás után 15 mg (34 μ mol, 76 %) cím
szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3040, 3020, 2950, 2930, 2870,
2860, 1730, 1610, 1515, 1455, 1430, 1300, 1235,
1160, 1120, 1000, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

286. példa

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidroxil-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(Z)-hepténsav-terc-butyl-észter (A) és

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[3(R)-hidroxil-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(Z)-hepténsav-terc-butyl-észter (B)

42 mg (84 μ mol) 286a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírt módon redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 42 mg (84 μ mol, 100%) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti termék keveréke. IR (film): 3600-3200, 3050, 2970, 2950, 2930, 2860, 1745, 1605, 1510, 1455, 1365, 1230, 1160, 1125, 995, 970, 940, 895 és 835 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 18 mg (36 μ mol, 43 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 22 mg (44 μ mol, 52 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

286a) példa

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3-oxo-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(Z)-hepténsav-terc-butyl-észter

48,6 mg (120 μ mol) 286b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-heptil)-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 42 mg (84 μ mol, 70 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3050, 2970, 2950, 2930, 2870, 1745, 1690, 1670, 1625, 1515, 1450, 1370, 1230, 1160, 1130, 1040, 995, 975, 940, 900 és 835 cm^{-1} .

286b) példa

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-formil-2-oxa-biciklo [2.2.1]hept-5-ill-3-oxa-5(Z)-hepténsav-terc-butyl-észter

186 mg (458 μmol) 274a) példa szerint előállított alkoholt a 38b) példában leírtaknak megfelelően oxidálunk, és feldolgozás után 185 mg (457 μmol , 100 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában, amelyet tisztítás nélkül reagáltatunk tovább.

287. példa

(1S,4R,5S(5E),6S(1E,3S,4S))- [7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxil-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabiciklo [2.2.1]-hept-5-ill-3-oxa-5-hepténsav

11,2 mg (21 μmol) 289. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 9,8 mg (21 μmol , 99 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3040, 2970, 2930, 2880, 1730, 1605, 1515, 1455, 1430, 1230, 1160, 1115, 995, 970, 895, 835 és 760 cm^{-1} .

288. példa

(1S,4R,5S(5E),6S(1E,3R,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-

-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-yl]-3-oxa-5-hepténsav

12,8 mg (24 μ mol) 289. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 11 mg (23 μ mol, 97 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3040, 2970, 2920, 2870, 1725, 1605, 1515, 1455, 1430, 1230, 1160, 1110, 995, 970, 895, 835 és 755 cm^{-1} .

289. példa

(1S,4R,5S(5E),6S(1E,3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-yl]-3-oxa-5-hepténsav-terc-butyl-észter (A) és

(1S,4R,5S(5E),6S(1E,3R,4S))-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-yl]-3-oxa-5-hepténsav-terc-butyl-észter (B)

29 mg (55 μ mol) 289a) példa szerint előállított ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 26 mg (49 μ mol, 90 %) szintelen olajat kapunk, amely a cím szerinti két vegyület keveréke. IR (film): 3600-3200, 3050, 2970, 2930, 2870, 1745, 1605, 1510, 1450, 1370, 1230, 1160, 1130, 970, 895 és 835 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 11,2 mg (21 μ mol, 38 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 12,8 mg (24 μ mol, 44 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

289a) példa

(1S,4R,5S(5E),6S(1E,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-oxo-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-il]-3-oxa-5-hepténsav-terc-butyl-észter

42,8 mg (106 μ mol) 283b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-[2-oxo-3(S)-metil-okt-5-inil]-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 29 mg (55 μ mol, 52 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3070, 3040, 2970, 2930, 2870, 1745, 1690, 1665, 1620, 1510, 1450, 1365, 1225, 1160, 1130, 1040, 995, 970, 940, 900 és 835 cm^{-1} .

290. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxil-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-il]-3-oxa-5-hepténsav

15 mg (28 μ mol) 292. példa szerint előállított nem-poláros A észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 13,2 mg (28 μ mol, 100 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3050, 3010, 2970, 2930, 2920, 2880, 2240, 1730, 1605, 1515, 1455, 1430, 1410, 1230, 1160, 1115, 995, 970, 940, 910, 895, 830 és 730 cm^{-1} .

291. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3R,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-
-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo[2.2.1]-
hept-5-ill-3-oxa-5-hepténsav

23 mg (44 μ mol) 292. példa szerint előállított po-
láros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk,
és feldolgozás és tisztítás után 16,4 mg (35 μ mol, 80 %)
cim szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formá-
jában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3040, 3010, 2970, 2930, 2920,
2880, 2240, 1730, 1605, 1510, 1455, 1430, 1230,
1160, 1115, 995, 970, 940, 910, 895, 835 és 735 cm^{-1} .

292. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-
-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo[2.2.1]-
hept-5-ill-3-oxa-5-hepténsav-terc-butil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3R,4S))-7-[4-(4-fluor-fenil)-
-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo[2.2.1]-
hept-5-ill-3-oxa-5-hepténsav-terc-butil-észter

45 mg (86 μ mol) 292a) példa szerint előállított
telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően re-
dukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 41 mg (78 μ mol,
91 %) szintelen olajat kapunk, amely a cim szerinti két ve-
gyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3050, 2970, 2930, 2870, 1745, 1605, 1510, 1450, 1370, 1230, 1160, 1125, 970, 940, 895 és 835 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeképpen 15 mg (28 μmol , 33 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 23 mg (44 μmol , 51 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

292a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-oxo-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5-hepténsav-terc-butil-észter

43,7 mg (108 μmol) 286b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-[2-oxo-3(S)-metil-okt-5-inil]-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 45 mg (86 μmol , 79 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3050, 3010, 2970, 2930, 2870, 1745, 1690, 1665, 1620, 1510, 1455, 1365, 1225, 1160, 1130, 1040, 995, 975, 945, 900 és 835 cm^{-1} .

293. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(1-butil-amino-karbonil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

20 mg (48 μmol) 293a) példa szerint előállított alkohol 400 μl vízmentes dimetil-formamiddal készült olda-

tához 6 mg réz(I)-kloridot és 10 μ l n-butyl-izocianátot adunk, és az elegyet 2 órán át 25°C-on, száraz argon atmoszférában keverjük. Ezután dietil-éterrel higitjuk, vízzel mosuk, és magnézium-szulfáton való szárítás után az oldószert eltávolítjuk. A maradékot két analitikai vékonyréteg-lemezen kromatográfiásan tisztítjuk. A kifejlesztéshez n-hexán és etil-acetát elegyét alkalmazzuk, az eluáláshoz dietil-étert használunk. Ily módon 16 mg (31 μ mol, 65 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3340, 3060, 3030, 2950, 2930, 2870, 1720, 1600, 1505, 1485, 1245, 1145, 1115, 1005, 970, 895, 830, 765, 730 és 695 cm^{-1} .

293a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(hidroximetil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

13,7 g (49,6 mmol) enantiomer Corey-laktont a 17a)-17g) és az 1h)-1l) példákban leírt módon reagáltatunk, és 1,44 g (3,41 mmol, 6,9 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1730, 1710, 1600, 1505, 1455, 1295, 1250, 1210, 1130, 1095, 895, 830, 765, 750, 730 és 700 cm^{-1} .

294. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(1-butyl-amino-karbonil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

16 mg (31 μ mol) 293. példa szerint előállított észter a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 13,7 mg (27 μ mol, 88 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában. IR (film): 3600-2400, 3330, 3080, 3050, 3030, 2950, 2930, 2870, 1710, 1600, 1525, 1505, 1490, 1455, 1250, 1225, 1145, 1035, 1020, 1010, 970, 895, 835, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

295. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[2-(4-fluor-fenoxi)-etoxi-metil-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-(illetve 2-(4-fluor-fenoxi)-etil)-észter

20,6 mg (49 μ mol) 293a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon 4-fluor-fenoxi-2-etil-bromiddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 15 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában. IR (film): 3080, 3050, 3030, 3000, 2930, 2870, 1745, 1600, 1510, 1490, 1455, 1295, 1250, 1215, 1125, 1095, 1010, 895, 830, 765, 745, 730 és 700 cm^{-1} .

296. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[2-(4-fluor-fenoxi)-etoxi-metil]-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

15 mg 295. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és

feldolgozás és tisztítás után 10,7 mg (19,6 μmol , a 295. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 22 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2500, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1730, 1710, 1600, 1505, 1490, 1455, 1295, 1250, 1210, 1130, 1095, 1010, 895, 830, 765, 750, 730 és 700 cm^{-1} .

297. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil) illetve benzil)-észter

19,4 mg (46 μmol) 293a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon benzil-kloriddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 24 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3090, 3060, 3030, 3010, 2930, 2870, 1745, 1600, 1490, 1450, 1405, 1365, 1300, 1240, 1210, 1115, 1095, 1075, 1010, 895, 835, 765, 730 és 695 cm^{-1} .

298. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

24 mg 297. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 20,4 mg (41 μmol , a 297. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 89 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1730,
1705, 1600, 1490, 1450, 1405, 1365, 1300, 1240,
1205, 1120, 1095, 1070, 1010, 895, 835, 765,
730 és 695 cm^{-1} .

299. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(4-ciano-
-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-
-metil(illetve 4-ciano-benzil)-észter

19,6 mg (47 μmol) 293a) példa szerint előállított
alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 4-ciano-benzil-
-bromiddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után
16,5 mg cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj
formájában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 2230, 1745,
1610, 1600, 1490, 1450, 1405, 1365, 1240, 1210,
1135, 1110, 1095, 1020, 1010, 970, 895, 835, 820,
765, 730 és 695 cm^{-1} .

300. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(4-ciano-
-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

16,5 mg 299. példa szerint előállított észterele-
gyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldol-
gozás és tisztítás után 14,7 mg (28 μmol , a 299. példa sze-
rinti kiindulási anyagra számítva 61 %) cím szerinti vegyüle-
tet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 2230,
1725, 1705, 1610, 1600, 1490, 1450, 1405, 1365,
1240, 1210, 1125, 1110, 1095, 1020, 1010, 970,
895, 835, 820, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

301. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(3-nitro-
-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-
-metil(illetve 3-nitro-benzil)-észter

19,4 mg (46 μmol) 293a) példa szerint előállított
alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 3-nitro-benzil-
-kloriddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után
21 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 3010, 2930, 2870, 1740, 1600,
1580, 1530, 1490, 1450, 1350, 1240, 1210, 1125,
1095, 1010, 895, 835, 805, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

302. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(3-nitro-
-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

21 mg 301. példa szerint előállított észterelegyet
a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás
és tisztítás után 15,2 mg (28 μmol , a 301.példa szerinti ki-
indulási anyagra számítva 61 %) cím szerinti vegyületet kü-
lönítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3060, 3030, 3000, 2930, 2870, 1730,
1710, 1600, 1580, 1530, 1490, 1450, 1350, 1240,
1210, 1125, 1095, 1010, 895, 835, 810, 765, 730
és 700 cm^{-1} .

303. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(4-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil(illetve 4-fluor-benzil)-észter

19,5 mg (46 μmol) 293a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 4-fluor-benzil-kloriddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 26 mg cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3070, 3050, 3030, 3010, 2930, 2870, 1745, 1600,
1510, 1490, 1445, 1405, 1295, 1220, 1155, 1115,
1090, 1015, 1010, 970, 895, 835, 765, 730 és
700 cm^{-1} .

304. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(4-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

26 mg 303. példa szerint előállított észterelegyet a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 20,7 mg (40 μmol , a 303. példa szerinti kiindulási anyagra számítva 87 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3030, 3010, 2930, 2870, 1730,
1705, 1600, 1510, 1490, ^{1450,} 1405, 1295, 1225, 1155,
1115, 1090, 1010, 970, 895, 830, 765, 730 és
700 cm^{-1} .

305. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(fenil-
-amino-karbonil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-il]-5-
-hepténsav-metil-észter

19,6 mg 293a) példa szerint előállított alkoholt
a 293. példában leírtaknak megfelelően fenil-izocianáttal
reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 24 mg (45 μmol ,
95 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj
formájában.

IR (film): 3400, 3080, 3050, 3030, 2950, 2930, 2880, 1740,
1600, 1540, 1500, 1485, 1445, 1405, 1315, 1220,
1055, 1030, 895, 835, 765, 735 és 695 cm^{-1} .

306. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(fenil-
-amino-karbonil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-il]-5-
-hepténsav

24 mg (45 μmol) 305. példa szerint előállított
észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldol-
gozás és tisztítás után 17,7 mg (34 μmol , 72 %) cím szerinti
vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3030, 3010, 2930, 2870, 1730, 1705, 1600, 1510, 1490, 1450, 1405, 1295, 1225, 1155, 1115, 1090, 1010, 970, 895, 830, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

307. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[(1E,3S)-3-hidroxi-3-ciklohexil-prop-1-enil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fenil-fenil)-6-[(1E,3E)-3-hidroxi-3-ciklohexil-prop-1-enil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (B)

42,5 mg ($81\text{ }\mu\text{mol}$) 307a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 34 mg ($64\text{ }\mu\text{mol}$, 79 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület elegye.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3030, 2920, 2850, 1735, 1600, 1485, 1455, 1245, 1195, 1005, 995, 970, 895, 835, 765, 730 és 695 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 17,5 mg ($33\text{ }\mu\text{mol}$, 41 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 12,6 mg ($24\text{ }\mu\text{mol}$, 30 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

307a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[(1E)-3-oxo-3-ciklohexil-prop-1-enil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

50,4 mg (120 μmol) 307b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-(2-oxo-2-ciklohexil-etil)-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 42,5 mg (81 μmol , 67 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3050, 3030, 2920, 2850, 1735, 1685, 1600, 1485, 1455, 1245, 1150, 1000, 970, 895, 835, 765, 730 és 695 cm^{-1} .

307b) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-formil-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

258 mg (613 μmol) 293a) példa szerint előállított alkoholt a 38b) példában leírt módon oxidálunk, és feldolgozás után 256 mg (612 μmol , 100 %) cím szerinti vegyületet kapunk, amelyet tisztítás nélkül reagáltatunk tovább.

308. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[(1E,3S)-3-hidroxi-3-ciklohexil-prop-1-enyl]-2-oxa-bicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

17,5 mg (33 μmol) 307. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 17 mg (33 μmol , 100 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3000, 2930, 2850,
1710, 1600, 1490, 1450, 1405, 1295, 1240, 1195,
1005, 995, 970, 910, 890, 840, 765, 730 és 695 cm^{-1} .

309. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[(1E,3R)-
-3-hidroxi-3-ciklohexil-prop-1-enil]-2-oxa-biciklo [2.2.1]hept-
-5-il]-5-hepténsav

12,6 mg (24 μmol) 307. példa szerint előállított
poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk,
és feldolgozás és tisztítás után 12 mg (23 μmol , 98 %) cím
szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3050, 3030, 3000, 2930, 2850,
1715, 1600, 1490, 1445, 1405, 1300, 1240, 1195,
1010, 995, 970, 910, 890, 835, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

310. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3S,4S))-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-
-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-
-5-il]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3R,4S))-7-[4-(4-fenil-fenil)-
-6-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyklo [2.2.1]-
hept-5-il]-5-hepténsav-metilészter (B)

41,6 mg (77 μmol) 310a) példa szerint előállított
telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redu-
kálunk, és feldolgozás és tisztítás után 36 mg (67 μmol ,
86 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyü-
let keveréke.

IR (film): 3600- 3200, 3060, 3030, 2970, 2930, 2880, 1745,
1600, 1490, 1450, 1405, 1320, 1295, 1245, 1195,
1110, 995, 970, 895, 835, 765, 730 és 695 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 15,8 mg (29 μmol , 38 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 17,3 mg (32 μmol , 42 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

310a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,4S))-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-
-(3-oxo-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-
-il]-5-hepténsav-metil-észter

51,8 mg (124 μmol) 307b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-[2-oxo-3(S)-metil-okt-5-in]-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 41,6 mg (77 μmol , 62 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3060, 3030, 2970, 2930, 2880, 1735, 1685, 1600,
1490, 1450, 1430, 1245, 1195, 995, 970, 895, 835,
765, 730 és 700 cm^{-1} .

311. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3S,4S))-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-
-(3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-
-5-il]-5-hepténsav

15,8 mg (29 μmol) 310. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 13,7 mg (26 μmol , 90 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3700-2400, 3080, 3060, 3030, 2970, 2930, 2880, 1710, 1600, 1490, 1450, 1405, 1320, 1295, 1245, 1195, 1110, 995, 970, 895, 835, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

312. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S(1E,3R,4S))-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(3-hidroxil-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo[2.2.1]-hept-5-yl]-5-hepténsav

17,3 mg (32 μmol) 310. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 16,6 mg (32 μmol , 99 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3050, 3030, 2970, 2930, 2880, 1710, 1600, 1490, 1455, 1405, 1320, 1295, 1245, 1195, 1105, 995, 970, 910, 895, 835, 765, 730 és 695 cm^{-1} .

313. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3S,4S))-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(2-bróm-3-hidroxil-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo-

[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3R,4S))-7-[4-(4-fenil-fenil)-
-6-(2-bróm-3-hidroxil-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo-

[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter (B)

61,3 mg (99 μ mol) 313a) példa szerint előállított
telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően re-
dukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 58,7 mg (95 μ mol,
96 %) színtelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti ve-
gyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3060, 3030, 2970, 2930, 2870, 1730,
1600, 1485, 1450, 1435, 1315, 1265, 1035, 990,
895, 835, 765, 735 és 700 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 24,5 mg
(40 μ mol, 40 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerke-
zetet rendeljük, és 33 mg (53 μ mol, 54 %) poláros alkoholt
különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

313a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6R,(1E/Z,4S))-7-[4-(4-Fenil-fenil)-
-6-(2-bróm-3-oxo-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo [2.2.1]-
hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

67,5 mg (161 μ mol) 307b) példa szerint előállított
aldehidet a 190a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-
-[2-oxo-3(S)-metil-okt-5-in]-foszfonáttal reagáltatunk, és
feldolgozás és tisztítás után 61,3 mg (99 μ mol, 62 %) cím
szerinti vegyületet kapunk színtelen olaj formájában.

IR (film): 3060, 3030, 2970, 2930, 2870, 1730, 1685, 1600,
1485, 1450, 1435, 1240, 1150, 985, 900, 835,
765, 730 és 695 cm^{-1} .

314. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3R,4S))-7-[4-(4-Fenil-fenil)-
-6-(2-bróm-3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyklo-
[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

6,3 mg (10 μmol) 313. példa szerint előállított
poláros B észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszap-
panositunk, és feldolgozás és tisztítás után 5,5 mg (9 μmol ,
88 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj
formájában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3030, 2970, 2930, 2870, 1710,
1600, 1485, 1450, 1435, 1315, 1265, 1240, 1195,
1035, 990, 895, 835, 765, 735 és 695 cm^{-1} .

315. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3S,4S))-7-[4-(4-Fenil-fenil)-
-6-(2-bróm-3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyklo-
[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

5,7 mg (9 μmol) 313. példa szerint előállított nem-
poláros A észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk,
és feldolgozás és tisztítás után 4,8 mg (8 μmol , 86 %) cím
szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3⁰50, 3030, 2970, 2930, 2870, 1715,
1600, 1485, 1450, 1435, 1315, 1265, 1240, 1195, 1035,
990, 895, 835, 765, 735 és 695 cm⁻¹.

316. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3R,4S))-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-
-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-
-5-il]-5-hepténsav

26 mg (42 μmol) 313. példa szerint előállított po-
láros B alkoholt a 187. példa szerint reagáltatunk, és fel-
dolgozás és tisztítás után 18 mg (34 μmol, 82 %) cím szerin-
ti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3030, 2970, 2930, 2880, 2230,
1705, 1600, 1485, 1450, 1435, 1405, 1320, 1240,
1145, 1020, 1005, 990, 895, 835, 765, 730 és 695 cm⁻¹.

317. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3R,4S))-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-
-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-
-5-il]-5-hepténsav-metil-észter

2,7 mg (5 μmol) 316. példa szerint előállított savat
a 186. példában leírtaknak megfelelően észterezünk, és az ol-
dószer eltávolítása után 2,7 mg (5 μmol, 97 %) cím szerinti
vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3030, 2970, 2930, 2870, 2230,
1745, 1600, 1485, 1445, 1435, 1405, 1320, 1240,
1145, 1020, 1005, 990, 895, 835, 765, 730 és 700 cm⁻¹.

318. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3S,4S))-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-
-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-
-5-ill]-5-hepténsav

18 mg (29 μ mol) 313. példa szerint előállított A
alkoholt a 187. példában leírt módon reagáltatunk, és feldol-
gozás és tisztítás után 3,2 mg (25 μ mol, 87 %) cím szerinti
vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3050, 3030, 2970, 2930, 2880,
2230, 1710, 1600, 1525, 1485, 1450, 1435, 1405,
1320, 1290, 1240, 1145, 1020, 1005, 990, 940,
895, 835, 765, 730 és 695 cm^{-1} .

319. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3S,4S))-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-
-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-
-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

3,1 mg (6 μ mol) 318. példa szerint előállított sa-
vat a 186. példában leírtaknak megfelelően észterezünk, és
az oldószer eltávolítása után 3,1 mg (6 μ mol, 98 %) cím sze-
rinti vegyületet kapunk színtelen olajként.

IR (film): 3600-3200, 3070, 3050, 3030, 2970, 2930, 2880,
2230, 1740, 1600, 1485, 1450, 1435, 1405, 1320,
1290, 1240, 1145, 1020, 1000, 940, 895, 835,
765, 730 és 695 cm^{-1} .

320. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3(S)-
-hidroxi-1(E)-oktenil]-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-il]-5-heptén-
sav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fenil-fenil)-6-[3(R)-hidr-
oxi-1(E)-oktenil]-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-
-metil-észter (B)

41,6 mg (81 μ mol) 320a) példa szerint előállított
telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően re-
dukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 35,3 mg (64 μ mol,
85 %) szintelen olajat kapunk, amely a két cím szerinti ve-
gyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3060, 3030, 2950, 2930, 2860, 1735,
1600, 1485, 1450, 1435, 1245, 1195, 995, 970,
895, 835, 765, 730 és 695 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 18,7 mg
(36 μ mol, 45 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerke-
zetet rendeljük, és 14,3 mg (28 μ mol, 34 %) poláros alkoholt
különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

320a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3-oxo-
-1(E)-oktenil]-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-il]-5-hepténsav-
-metil-észter

49,8 mg (118 μ mol) 307b) példa szerint előállított
aldehidet a 23a) példában leírt módon dimetil-(2-oxo-heptil)-

-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 41,4 mg (80 μ mol, 68 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3060, 3030, 2950, 2930, 2860, 1740, 1690, 1600, 1485, 1440, 1245, 1195, 1005, 995, 970, 895, 835, 730, 765 és 695 cm^{-1} .

321. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3(R)-hidroxi-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

14,3 mg (28 μ mol) 320. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 13,8 mg (27 μ mol, 96 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3060, 3030, 3010, 2950, 2930, 2870, 2860, 1710, 1600, 1490, 1455, 1405, 1295, 1240, 1195, 1045, 1010, 995, 970, 910, 835, 765 és 700 cm^{-1} .

322. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3(S)-hidroxi-1(E)-oktenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

18,7 mg (36 μ mol) 320. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 18,1 mg (36 μ mol, 100 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

telen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3060, 3030, 2950, 2930, 2870, 1710,
1600, 1490, 1450, 1405, 1295, 1240, 1195, 1010,
995, 970, 910, 835, 765 és 700 cm^{-1} .

323. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(4-fluor-
-benzil-oxi-imino-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-il]-5-hep-
ténsav-metil-észter

19,9 mg (48 μmol) 307b) példa szerint előállított
aldehidet a 26. példában leírt módon p-fluor-fenil-metoxi-
-aminnal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 17 mg
(31 μmol , 66 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj
alakjában.

IR (film): 3060, 3030, 2940, 2870, 1730, 1600, 1510, 1485,
1220, 1155, 1045, 1005, 995, 900, 835, 765, 730
és 595 cm^{-1} .

324. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(4-fluor-
-benzil-oxi-imino-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-il]-5-
-hepténsav

17 mg (31 μmol) 323. példa szerint előállított ész-
tert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldol-
gozás és tisztítás után 16 mg (30 μmol , 98 %) cím szerinti
vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2500, 3060, 3030, 3010, 2930, 2880, 1730, 1705, 1600, 1510, 1490, 1445, 1405, 1295, 1220, 1155, 1045, 1005, 995, 895, 835, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

325. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(ciklohexil-metoxi-imino-metil)-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

18,3 mg (44 μmol) 307b) példa szerint előállított aldehidet a 26. példában leírtaknak megfelelően ciklohexil-metoxi-aminnal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 18 mg (34 μmol , 78 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3060, 3030, 3000, 2920, 2850, 1735, 1600, 1485, 1445, 1240, 1190, 1160, 1035, 1000, 900, 835, 765, 730 és 695 cm^{-1} .

326. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(ciklohexil-metoxi-imino-metil)-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

18 mg (34 μmol) 325. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 17 mg (33 μmol , 97 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3080, 3050, 3030, 3000, 2930, 2850, 1730, 1705, 1600, 1490, 1450, 1405, 1295, 1240, 1190, 1080, 1040, 1025, 1010, 995, 900, 835, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

327. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-3-oxa-heptánsav

19,5 mg (48 μmol) 327a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 17,5 mg (38 μmol , 80 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3040, 2930, 2860, 1725, 1605, 1510, 1425, 1365, 1225, 1160, 1115, 1025, 900 és 830 cm^{-1} .

327a) példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(hidroxil-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-3-oxa-heptánsav-terc-butil-észter

84 mg (207 μmol) 276a) példa szerint előállított alkoholt 3 ml etil-acetátban oldunk, 30 mg 10 %-os, szénhordozós palládiumkatalizátort adunk az oldathoz, és környezeti nyomáson addig hidrogénezzük, amíg a hidrogénfelvétel jelentősen lelassul. A katalizátort kiszűrjük, az oldatot vízgárral létesített vákuumban bepároljuk, és a maradékot négy analitikai vékonyréteg-lemezen kromatográfiásan tisztítjuk.

Futtatószerként triklór-metán és acetón elegyét, eluálószerként etanol és etil-acetát elegyét használjuk. Ily módon 49 mg (120 μmol , 58 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3700-3200, 3050, 2980, 2930, 2860, 1740, 1605, 1510, 1365, 1230, 1160, 1135, 1020, 895, 830, 815 és 735 cm^{-1} .

328. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fluor-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-il]-3-oxa-heptánsav-metil-észter

2,9 mg (6 μmol) 327. példa szerint előállított savat a 186. példában leírt módon észterezünk, és feldolgozás után 3 mg (6 μmol , 100 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3070, 3050, 2930, 2860, 1745, 1605, 1515, 1425, 1365, 1225, 1160, 1120, 1100, 1025, 895 és 830 cm^{-1} .

329. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-ciano-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-il]-3-oxa-heptánsav

19 mg (47 μmol) 327a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 12,1 mg (26 μmol , 56 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3050, 2930, 2860, 2215, 1725, 1610, 1515, 1415, 1230, 1160, 1125, 1100, 1020, 895, 830 és 815 cm^{-1} .

330. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-ciano-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-heptánsav-metil-észter

3,4 mg (7 μ mol) 329. példa szerint előállított savat a 186. példában leírt módon észterezünk, és az oldószer eltávolítása után 3,3 mg (7 μ mol, 94 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3070, 3050, 2930, 2860, 2215, 1740, 1610, 1515, 1415, 1230, 1160, 1125, 1110, 1020, 895, 830 és 820 cm^{-1} .

331. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-bróm-3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-ynil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5-hepténsav-terc-butyl-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3R,4S))-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-(2-bróm-3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-ynil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5-hepténsav-terc-butyl-észter (B)

92 mg (151 μ mol) 331a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és feldolgozás és tisztítás után 77 mg (126 μ mol, 84 %) szintelen olajat különítünk el, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3050, 2970, 2930, 2870, 1745, 1605, 1515, 1450, 1370, 1230, 1160, 1125, 1040, 995, 940, 895, 835 és 735 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 29 mg (48 μmol , 32 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 46 mg (77 μmol , 50 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

331a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-bróm-3-oxo-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyklo [2.2.1]-hept-5-ill-3-oxa-5-hepténsav-terc-butyl-észter

88 mg (218 μmol) 286b) példa szerint előállított aldehidet a 190a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-[2-oxo-3(S)-metil-okt-5-inill-foszfónáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 92 mg (151 μmol , 70 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj alakjában.

IR (film): 3050, 2970, 2930, 2870, 1745, 1690, 1600, 1510,

1455, 1365, 1230, 1160, 1130, 1040, 990, 905,

835 és 735 cm^{-1} .

332. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3R,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-bróm-3-hidroxil-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill-3-oxa-5-hepténsav

8,3 mg (14 μmol) 331. példa szerint előállított B észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 6,5 mg (12 μmol , 85 %) cím szerinti vegyületet kapunk színtelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3050, 2970, 2930, 1710, 1605, 1510,

1455, 1365, 1230, 1160, 1125, 1040, 995, 940, 895,

835 és 735 cm^{-1} .

333. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(1E/Z,3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(2-bróm-3-hidroxi-4-metil-non-1-én-6-inil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-3-oxa-5-hepténsav

5,1 mg (8 μ mol) 331. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 4,2 mg (8 μ mol, 96 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR(film): 3600-2400, 3050, 2970, 2930, 2870, 1710, 1605, 1510, 1455, 1370, 1230, 1160, 1125, 1035, 995, 940, 895, 835 és 735 cm^{-1} .

334. példa

(1S,4R,5S,(5Z),6R(3R,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-3-oxa-5-hepténsav

31 mg (51 μ mol) 331. példa szerint előállított poláros B alkoholt a 187. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 12 mg (25 μ mol, 49 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 3010, 2970, 2930, 2870, 2230, 1710, 1605, 1515, 1450, 1230, 1160, 1125, 1040, 990, 900, 835 és 735 cm^{-1} .

335. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3R,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-3-oxa-5-hepténsav-metil-észter

4 mg (9 μmol) 334. példa szerint előállított savat a 186. példában leírt módon észterezünk, és az oldószer eltávolítása után 4 mg (8 μmol , 97 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3010, 2970, 2930, 2870, 2230, 1740, 1605, 1515, 1450, 1230, 1160, 1130, 1035, 995, 900, 835 és 735 cm^{-1} .

336. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5-hepténsav

19,6 mg (32 μmol) 331. példa szerint előállított nempoláros A alkoholt a 187. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 8,2 mg (17 μmol , 54 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3050, 2970, 2930, 2870, 2230, 1710, 1605, 1510, 1455, 1230, 1160, 1120, 1035, 995, 895, 835 és 735 cm^{-1} .

337. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R(3S,4S))-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(3-hidroxi-4-metil-nona-1,6-diinil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-hepténsav-metil-észter

2,7 mg (6 μ mol) 336. példa szerint előállított savat a 186. példában leírt módon észterezünk, és az oldószer eltávolítása után 2,8 mg (6 μ mol, 100 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-3200, 3050, 3010, 2970, 2930, 2870, 2230, 1745, 1605, 1515, 1455, 1230, 1160, 1120, 1040, 995, 895, 835 és 735 cm^{-1} .

338. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(ciklohexil-metoxi-imino-metil-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-il]-3-oxa-5-hepténsav-terc-butyl-észter

16,3 mg (40 μ mol) 286b) példa szerint előállított aldehidet a 26. példában leírtaknak megfelelően ciklohexil-metoxi-aminnal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 16,1 mg (31 μ mol, 78 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3070, 3040, 3010, 2930, 2850, 1745, 1610, 1515, 1450, 1430, 1235, 1165, 1115, 1040, 1025, 1000, 945, 900, 835 és 820 cm^{-1} .

339. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(ciklohexil-metoxi-imino-metil)-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-il]-3-oxa-5-hepténsav

16,1 mg (31 μ mol) 338. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és fel-

dolgozás és tisztítás után 12,8 mg (28 μ mol, 90 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3050, 3020, 2930, 2850, 1730, 1610, 1515, 1450, 1235, 1160, 1115, 1040, 1025, 1000, 900, 835 és 820 cm^{-1} .

340. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fluor-benzil-oxi-imino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-3-oxa-5-hepténsav-metil-észter

16,8 mg (42 μ mol) 286b) példa szerint előállított ladehidet a 26. példában leírtaknak megfelelően p-fluor-metoxi-aminnal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 17,6 mg (33 μ mol, 80 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3070, 3050, 3010, 2930, 2880, 1745, 1605, 1515, 1430, 1415, 1365, 1225, 1160, 1120, 1100, 1040, 1015, 945, 900 és 835 cm^{-1} .

341. példa

(1S,4R,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-fluor-benzil-oxi-imino-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-3-oxa-5-hepténsav

17,6 mg (33 μ mol) 340. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12,8 mg (27 μ mol, 82 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2400, 3070, 3050, 3020, 2930, 2880, 1730,
1605, 1515, 1430, 1225, 1160, 1120, 1045, 1015,
945, 900 és 835 cm^{-1} .

342. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(benzil-oxi-
-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-3-oxa-5(Z)-hepténsav

19 mg (47 μmol) 274a) példa szerint előállított
alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően reagáltatunk,
és feldolgozás és tisztítás után 14,5 mg (33 μmol , 70 %) cím
szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2300, 3090, 3060, 3030, 2920, 2870, 1725,
1605, 1515, 1455, 1230, 1160, 1115, 1100, 1030,
900, 835, 740 és 700 cm^{-1} .

343. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(benzil-oxi-
-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-3-oxa-5(Z)-hepténsav-
-metil-észter

3,1 mg (7 μmol) 342. példa szerint előállított sa-
vat a 186. példában leírt módon észterezünk, és az oldószer
eltávolítása után 3,1 mg (7 μmol , 97 %) cím szerinti vegyü-
letet kapunk színtelen olajként.

IR (film): 3090, 3060, 3030, 2970, 2920, 2870, 1745, 1605,
1515, 1455, 1430, 1230, 1160, 1115, 1100, 1030,
975, 900, 835, 740 és 700 cm^{-1} .

344. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(trifluorometil-karbonil-amino)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

15 mg (30 μ mol) 344a) példa szerinti előállított B észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12 mg (25 μ mol, 83 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2600, 3430, 3310, 3080, 3060, 3030, 2940, 2880, 1710, 1600, 1555, 1490, 1215, 1185, 1115, 1005, 900, 840, 815, 730 és 695 cm^{-1} .

344a) példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-amino-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-fenil-fenil)-6-(trifluorometil-karbonil-amino)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (B)

409 mg (903 μ mol) 344b) példa szerint előállított savklorid 1,4 ml diklór-metánnal készült és 0-5°C-ra lehűtött oldatához 71,7 mg nátrium-azid 240 μ l vízzel készült oldatát adjuk, és 0,9 mg tetrabutil-ammónium-hidrogén-szulfát hozzáadása után az elegyet jeges hűtés közben 1 órán át keverjük. A szerves fázist elválasztjuk, a vizes fázist több alkalommal diklór-metánnal mossuk, és az egyesített szerves extraktumokat 2 napon át vízmentes magnézium-szulfáton hagyjuk állni. Szűrés után kb. 2 ml-re bepároljuk az oldatot, 300 μ l trifluor-ecetsavat adunk hozzá, és 24 órán át forral-

juk. Az oldószer eltávolítása után kapott maradékot kb. 75 ml kovasavgélen kromatográfiásan tisztítjuk, eluálószerként di-klór-metán és metanol gradienselegyét használjuk. Ily módon 277 mg (683 μ mol, 76 %) cím szerinti A vegyületet és 103 mg (205 μ mol, 23 %) cím szerinti B vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): A vegyület: 3360, 3290, 3050, 3030, 2930, 2860, 1730, 1605, 1485, 1265, 1075, 1045, 1005, 895, 835, 765, 735 és 700 cm^{-1} .

IR (film): B vegyület: 3300, 3060, 3030, 2940, 2880, 1725, 1705, 1600, 1550, 1485, 1440, 1210, 1180, 1155, 1005, 900, 840, 765, 730 és 695 cm^{-1} .

344b) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(klór-karbonil)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

400 mg (921 μ mol) 344c) példa szerint előállított sav 10 ml vízmentes diklór-metánnal készült oldatához, amelyet száraz argon atmoszférában 0-5 °C-ra hűtünk, 160 μ l tionil-kloridot adunk, az elegyet hagyjuk 23 °C-ra melegedni, és még 6 órán át keverjük. Az oldószert vákuumban lepároljuk, így 409 mg (903 μ mol, 98 %) cím szerinti vegyületet kapunk halványsárga olaj alakjában, amelyet tisztítás nélkül reagáltatunk tovább.

344c) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(hidroxikarbonil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

540 mg (1,28 mmol) 293a) példa szerint előállított alkoholt a 274m) példában leírtaknak megfelelően oxidálunk, és az 1i) példa szerint végzett feldolgozás után az anyagot kb. 70 ml kovásvégelen kromatográfiásan tisztítjuk, eluálószerként n-hexán és acetone gradienseleget használjuk. Ily módon 400 mg (921 μ mol, 72 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2500, 3050, 3030, 2950, 2870, 1730, 1700, 1600, 1485, 1440, 1300, 1220, 1170, 1005, 990, 895, 835, 765, 730 és 695 cm^{-1} .

345. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(3,5-diklór-2-hidroxibenzolszulfonamino)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

22 mg (54,2 μ mol) 344a) példa szerint előállított amint 800 μ l vízmentes diklór-metánban oldunk, 100 μ l trietil-amint és 17 mg 3,5-diklór-2-hidroxibenzolszulfonsav-kloridot adunk hozzá, és száraz argon atmoszférában 5 órán át 23 °C-on keverjük. A reakcióeleget egy analitikai vékonyréteg-lemezen kromatografáljuk. Futtatószerként kloroform és acetone eleget, eluálószerként etanol és etil-acetát ele-

gyét használjuk. Ily módon 11 mg (17 μ mol, 31 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3450-3150, 3280, 3080, 3060, 3030, 2940, 2870, 1730, 1600, 1580, 1485, 1465, 1265, 1240, 1160, 1070, 1000, 900, 870, 835, 805, 765, 735, 700 és 580 cm^{-1} .

346. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(3,5-diklór-2-hidroxi-benzolszulfonamino)-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav

11 mg (17 μ mol) 345. példa szerint előállított észter a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 10 mg (16 μ mol, 95 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2400, 3270, 3080, 3060, 3030, 2930, 2870, 1710, 1600, 1580, 1485, 1465, 1415, 1315, 1300, 1240, 1150, 1090, 1075, 1010, 995, 900, 870, 835, 765, 735, 695 és 580 cm^{-1} .

347. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(4-metil-benzoilszulfonamino)-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-ill-5-hepténsav-metil-észter

25 mg 344a) példa szerint előállított amint a 345. példában leírt módon 4-metil-benzolszulfonsav-kloriddal

reagáltatunk, és tisztítás után 15,7 mg (28 μ mol, 46 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3300, 3060, 3030, 2940, 2880, 1725, 1715, 1600, 1550, 1485, 1435, 1330, 1215, 1180, 1160, 1090, 1005, 900, 835, 765, 735, 700 és 660 cm^{-1} .

348. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(4-metil-benzolszulfonamino)-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

15,7 mg (28 μ mol) 347. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12,9 mg (24 μ mol, 84 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3700-2400, 3270, 3050, 3010, 2940, 2880, 1710, 1600, 1555, 1435, 1325, 1230, 1160, 1090, 1005, 905, 835, 815, 765, 735, 700 és 600 cm^{-1} .

349. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(4-fluor-benzolszulfonamino)-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

22,7 mg (56 μ mol) 344a) példa szerint előállított amint a 345. példában leírt módon 4-fluor-benzolszulfonsav-kloriddal reagáltatunk, és tisztítás után 15 mg (27 μ mol, 48 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3300, 3060, 3030, 2940, 2880, 1725, 1710, 1595,
1550, 1490, 1435, 1330, 1215, 1165, 1155, 1090,
1005, 900, 840, 765, 735, 700 és 660 cm^{-1} .

350. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(4-fluor-
-benzolszulfonamino)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill]-5-heptén-
sav

15 mg (27 μmol) 349. példa szerint előállított ész-
tert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk,
és feldolgozás és tisztítás után 11,4 mg (21 μmol , 77 %) cím
szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj alakjában.

IR (film): 3700-2500, 3300, 3060, 3030, 2940, 2880, 1710,
1600, 1550, 1490, 1435, 1325, 1215, 1160, 1155, 1090,
1005, 900, 835, 765, 735, 700 és 660 cm^{-1} .

351. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(naftalin-
-2-szulfonamino)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-
-metil-észter

23,3 mg (57,5 μmol) 344a) példa szerint előállított
amint a 345. példában leírtaknak megfelelően naftalin-2-szul-
fonsav-kloriddal reagáltatunk, és tisztítás után 18,4 mg
(31 μmol , 54 % cím szerinti vegyületet kapunk színtelen olaj-
ként.

IR (film): 3280, 3060, 3030, 2940, 2870, 1730, 1600, 1485, 1435, 1330, 1265, 1245, 1160, 1130, 1090, 1075, 1005, 900, 835, 815, 765, 735, 700 és 600 cm^{-1} .

352. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(naftalin-2-szulfonamino)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

18,4 mg (31 μmol) 351. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 14,9 mg (26 μmol , 83 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2500, 3280, 3060, 3030, 2940, 2880, 1705, 1600, 1485, 1435, 1330, 1265, 1245, 1160, 1130, 1090, 1075, 1005, 895, 835, 815, 765, 735, 695 és 660 cm^{-1} .

353. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(kinolin-8-szulfonamino)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

22,5 mg (55,5 μmol) 344a) példa szerint előállított amint a 345. példában leírtaknak megfelelően kinolin-8-szulfonsav-kloriddal reagáltatunk, és tisztítás után 20 mg (33,5 μmol , 60 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3280, 3060, 3030, 2940, 2870, 1730, 1615, 1595, 1560, 1490, 1370, 1330, 1210, 1170, 1145, 1090, 1070, 1005, 900, 835, 790, 765, 735, 700 és 675 cm^{-1} .

354. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(kinolin-8-szulfonamino)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

20 mg (33,5 μmol) 353. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feloldozás és tisztítás után 17 mg (29 μmol , 87 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2500, 3420, 3250, 3060, 3030, 3010, 2930, 2870, 1710, 1615, 1595, 1565, 1490, 1450, 1405, 1330, 1215, 1165, 1145, 1090, 1005, 995, 970, 895, 830, 790, 765, 700, 675 és 580 cm^{-1} .

355. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(hexil-karbonil-amino)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

20,9 mg (51,5 μmol) 344a) példa szerint előállított amint a 345. példában leírtaknak megfelelően n-hepténsav-kloriddal reagáltatunk, és tisztítás után 21,7 mg (41,9 μmol , 81 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3290, 3060, 3030, 2950, 2930, 2860, 1735, 1715, 1640, 1540, 1485, 1450, 1435, 1365, 1245, 1215, 1165, 1125, 1050, 1005, 970, 900, 835, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

356. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(hexil-karbonil-amino)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

21,7 mg (41,9 μmol) 355. példa szerint előállított észter a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 21 mg (41,7 μmol , 99 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3700-2500, 3450, 3060, 3030, 3010, 2960, 2930, 2870, 1710, 1645, 1545, 1490, 1445, 1405, 1380, 1300, 1245, 1220, 1125, 1050, 1010, 975, 900, 835, 765, 730 és 695 cm^{-1} .

357. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(4-fluor-fenil-karbonil-amino)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

20,2 mg (49,8 μmol) 344a) példa szerint előállított amint a 345. példában leírt módon 4-fluor-benzoesav-kloriddal reagáltatunk, és tisztítás után 24,7 mg (46,8 μmol , 94 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3310, 3060, 3030, 2940, 2870, 1735, 1715, 1655, 1630, 1605, 1535, 1500, 1440, 1315, 1235, 1160, 1095, 1045, 1005, 970, 900, 850, 765, 735 és 700 cm^{-1} .

358. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(4-fluor-fenil-karbonil-amino)-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

24,7 mg (46,8 μ mol) 357. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítottunk, és feldolgozás és tisztítás után 18 mg (35 μ mol, 75 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2500, 3330, 3060, 3030, 3010, 2940, 2880, 1710, 1635, 1605, 1540, 1505, 1235, 1160, 1095, 1010, 970, 900, 850, 765, 735 és 700 cm^{-1} .

359. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(perfluor-benzolszulfonamino)-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

19 mg (46,9 μ mol) 344a) példa szerint előállított amint a 345. példában leírt módon perfluor-benzolszulfonsav-kloriddal reagáltatunk, és tisztítás után 19,5 mg (30,7 μ mol, 65 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3260, 3060, 3030, 2940, 2880, 1735, 1710, 1645, 1610, 1515, 1495, 1440, 1360, 1295, 1170, 1100, 990, 900, 835, 765, 735, 700, 645 és 605 cm^{-1} .

360. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(perfluor-benzolszulfonamino)-2-oxabiciklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

19,5 mg (30,7 μ mol) 359. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítottunk, és feldolgozás és tisztítás után 16,8 mg (17 μ mol, 88 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2500, 3260, 3030, 2940, 2880, 1705, 1640, 1610, 1515, 1495, 1445, 1365, 1295, 1170, 1095, 990, 900, 835, 765, 735, 700, 645 és 605 cm^{-1} .

361. példa

(1R,4S,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-metil-benzolszulfonamino)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter

38 mg (109 μ mol) 361a) példa szerint előállított amint a 345. példában leírt módon 4-metil-benzolszulfonsav-kloriddal reagáltatunk, és tisztítás után 36,7 mg (73,2 μ mol, 67 %) cím szerinti vegyületet kapunk színtelen olaj alakjában.
IR (film): 3270, 3060, 3010, 2940, 2970, 1730, 1710, 1600, 1515, 1435, 1325, 1230, 1160, 1090, 1000, 970, 900, 830, 815, 735 és 665 cm^{-1} .

361a) példa

(1R,4S,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-amino-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1R,4S,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-(trifluor-metil-karbonil-amino)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav-metil-észter (B)

142 mg (392 μmol) 17a) példa szerint előállított alkoholt a 344a)-344c) példákban leírt módon reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 38 mg (109 μmol , 28 %) cím szerinti A vegyületet, valamint 47 mg (102 μmol , 26 %) cím szerinti B vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): A vegyület: 3340, 3040, 3010, 2940, 2870, 1735, 1605, 1510, 1435, 1360, 1230, 1200, 1160, 1100, 1035, 1000, 895, 835 és 720 cm^{-1} .

IR (film): B vegyület: 3310, 3070, 3010, 2950, 2880, 1725, 1705, 1605, 1550, 1515, 1435, 1365, 1300, 1220, 1180, 1160, 1090, 1045, 1005, 970, 945, 900, 835 és 725 cm^{-1} .

37 mg (80,5 μmol) B vegyületet 500 μl metanol és 200 μl víz elegyében oldunk, 30 mg kálium-karbonátot adunk hozzá és az elegyet 24 órán át 50 °C-on keverjük. Ezután híg citromsavval semlegesítjük, és két analitikai vékonyréteg-lemezen kromatográfiásan tisztítjuk. Futtatószerként kloroform és acetone, eluálószerként acetone és etil-acetát elegyét használjuk. Ily módon 22 mg (60,4 μmol , 75 %) cím szerinti A vegyületet különítünk el.

362. példa

(1R,4S,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-metil-benzolszulfonamido)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

36,7 mg (73,2 μmol) 361. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk,

és feldolgozás és tisztítás után 27,8 mg (57/ μ mol, 78 %) cim szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3700-2400, 3270, 3050, 3010, 2980, 2940, 1710, 1600, 1515, 1435, 1410, 1325, 1310, 1235, 1160, 1090, 1000, 975, 905, 835, 815, 735 és 665 cm^{-1} .

363. példa

(1R,4S,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(naftalin-2-szulfonamino)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter

20 mg (57,6 μ mol) 361a) példa szerint előállított amint a 345. példában leírtaknak megfelelően naftalin-2-szulfonsav-kloriddal reagáltatunk és tisztítás után 16 mg (30 μ mol, 52 %) cim szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3270, 3060, 3010, 2940, 2870, 1730, 1605, 1590, 1510, 1435, 1325, 1230, 1160, 1095, 1075, 1000, 900, 860, 830, 820, 735 és 660 cm^{-1} .

364. példa

(1R,4S,5S(5Z),6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(naftalin-2-szulfonamino)-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

16 mg (30 μ mol) 363. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 15,3 mg (29 μ mol, 97 %) cim szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2500, 3270, 3060, 3010, 2930, 2870, 1705,
1605, 1590, 1515, 1455, 1435, 1410, 1325, 1235,
1160, 1130, 1095, 1075, 1000, 975, 900, 865, 830,
815, 750, 660 és 550 cm^{-1} .

365. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(3-fenil-
-propil-karbonil-amino)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-hep-
ténsav-metil-észter

19,7 mg (48 μmol) 344a) példa szerint előállított
amint a 345. példában leírtaknak megfelelően 4-fenil-vajsav-
-kloriddal reagáltatunk, és tisztítás után 22,8 mg (41 μmol ,
85 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj
alakjában.

IR (film): 3300, 3080, 3060, 3030, 2940, 2870, 1730, 1635,
1535, 1485, 1450, 1245, 1160, 1005, 900, 835,
765, 730 és 700 cm^{-1} .

366. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(3-fenil-
-propil-karbonil-amino)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-ill-5-
-hepténsav

22,8 mg (41 μmol) 365. példa szerint előállított
észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldol-
gozás és tisztítás után 21 mg (39 μmol , 95 %) cím szerinti
vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3430, 3060, 3030, 2930, 2860, 1705, 1635, 1540, 1490, 1450, 1150, 1005, 970, 900, 835, 765, 730 és 695 cm^{-1} .

367. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(2-fenoxi-etil-karbonil-amino)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-yl]-5-heptén-sav-metil-észter

17,2 mg (42 μmol) 344a) példa szerint előállított amint a 345. példában leírtaknak megfelelően 3-fenoxi-propil-kloriddal reagáltatunk, és tisztítás után 17,7 mg (32 μmol , 76 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3300, 3060, 3030, 2940, 2870, 1735, 1640, 1600, 1540, 1490, 1240, 1170, 1040, 1005, 895, 835, 765, 755, 730 és 695 cm^{-1} .

368. példa

(1S,4R,5R(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-(2-fenoxi-etil-karbonil-amino)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-yl]-5-heptén-sav

17,7 mg (32 μmol) 367. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 14 mg (26 μmol , 81 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3430, 3060, 3030, 2930, 2870, 1705, 1640, 1600, 1550, 1495, 1490, 1240, 1040, 1005, 900, 835, 765, 755, 730 és 690 cm^{-1} .

369. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3(S)-
-hidroxi-4(RS)-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-
-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fenil-fenil)-6-[3(R)-
-hidroxi-4(RS)-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-
-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (B)

62 mg (113 μ mol) 369a) példa szerint előállított
ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk, és
feldolgozás és tisztítás után 54 mg (98 μ mol, 87 %) szintelen
olajat kapunk, amely a cím szerinti két vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3080, 3060, 3030, 2960, 2870, 1735,
1600, 1485, 1450, 1245, 1195, 1005, 995, 970,
895, 835, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 20,1 mg
(36 μ mol, 32 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkeze-
tet rendeljük, és 30,1 mg (55 μ mol, 48 %) poláros alkoholt
különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

369a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3-oxo-
-4(RS)-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-
-hepténsav-metil-észter

54,1 mg (129 μ mol) 307b) példa szerint előállított
aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-2-
-oxo-3(RS)-fenil-butyl]-foszfonáttal reagáltatunk, és feldol-

gozás és tisztítás után 62 mg (113 μ mol, 87 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3080, 3050, 3⁰30, 2970, 2940, 2870, 1735, 1690, 1670, 1620, 1600, 1485, 1445, 1310, 1240, 1195, 1165, 1075, 1030, 995, 970, 900, 835, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

370. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3(R)-
-hidroxi-4(RS)-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-
-5-yl]-5-hepténsav

30,1 mg (55 μ mol) 369. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 25,4 mg (47 μ mol, 86 %) cím szerinti vegyületet kapunk viaszszerű szilárd anyag alakjában.

IR (KBr): 3430, 3080, 3060, 3030, 2970, 2930, 2870, 1705, 1600, 1485, 1450, 1400, 1240, 1195, 1005, 995, 970, 895, 835, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

371. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3(S)-
-hidroxi-4(RS)-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-
-5-yl]-5-hepténsav

20,1 mg (36 μ mol) 369. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 19 mg (35 μ mol, 98 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

55,5 mg (133 μ mol) 307b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírt módon dimetil-(2-oxo-4-fenil-butil)-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 65 mg (118 μ mol, 89 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3080, 3060, 3030, 2940, 2870, 1735, 1690, 1665, 1620, 1600, 1485, 1450, 1435, 1365, 1240, 1190, 1170, 995, 975, 900, 835, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

373. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3(R)-hidrox-oxi-5-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

26,7 mg (48 μ mol) 372. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 21,7 mg (40 μ mol, 84 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3700-2600, 3080, 3060, 3030, 2930, 2870, 1705, 1600, 1490, 1450, 1405, 1195, 1125, 1095, 1005, 955, 970, 890, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

374. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3(S)-hidrox-oxi-5-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-5-hepténsav

30 mg (54 μ mol) 372. példa szerint előállított nem-poláros A észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszap-

IR (film): 3430, 3060, 3030, 2950, 2870, 1705, 1600, 1550,
1485, 1400, 1240, 1040, 1005, 995, 970, 895, 835, 765,
730 és 700 cm^{-1} .

372. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3(S)-
-hidroxi-5-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-
-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fenil-fenil)-6-[3(R)-
-hidroxi-5-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-
-5-hepténsav-metil-észter (B)

65 mg (118 μmol) 372a) példa szerint előállított
telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redu-
kálunk, és feldolgozás és tisztítás után 59 mg (107 μmol ,
91 %) szintelen olajat kapunk, amely a cím szerinti két vegyü-
let keveréke.

IR(film): 3600-3200, 3080, 3050, 3020, 2940, 2860, 1735,
1600, 1485, 1450, 1435, 1245, 1195, 1165, 1045,
1005, 995, 970, 895, 835, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 30 mg
(54 μmol , 46 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkeze-
tet rendeljük, és 26,7 mg (48 μmol , 41 %) poláros alkoholt
különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

372a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3-oxo-5-
-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxa-bicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hep-
ténsav-metil-észter

panositunk, és feldolgozás és tisztítás után 24,5 mg (46 μ mol, 85 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj formájában.

IR (film): 3700-2600, 3080, 3060, 2930, 2870, 1710, 1600, 1490, 1450, 1405, 1345, 1195, 1125, 1095, 1005, 995, 970, 895, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

375. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3(S),5-dihidroxi-4(RS)-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-yl-5-hepténsav-metil-észter (A) és

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-fenil-fenil)-6-[3(R),5-dihidroxi-4(RS)-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]-hept-5-yl]-5-hepténsav-metil-észter (B)

33,6 mg (42 μ mol) 375a) példa szerint előállított telítetlen ketont a 23. példában leírtaknak megfelelően redukálunk. A feldolgozás és kromatográfiás tisztítás után elkülönített diasztereoizomer alkoholokat az 1a) példa szerint végzett szilil-éter-hasítással választjuk el. Ismételt feldolgozás és kromatográfiás tisztítás után 15,3 mg (27 μ mol, 64 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkezetet rendeljük, és 8,2 mg (14 μ mol, 34 %) poláros alkoholt különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

IR (film): A vegyület: 3600-3200, 3060, 3030, 2940, 2880, 1730, 1600, 1485, 1450, 1425, 1265, 1195, 1110, 995, 970, 835, 765, 735 és 700 cm^{-1} .

375a) példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3-oxo-4(RS)-fenil-5-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi)-1(E)-pentenil]-2-oxa-biciklo [2.2.1]hepténsav-metil-észter

54 mg (129 μmol) 307b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-[2-oxo-3(RS)-fenil-4-(terc-butyl-difenil-szilil-oxi)-butyl]-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 33,6 mg (42 μmol , 32 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3050, 3030, 2940, 2860, 1735, 1690, 1665, 1620, 1600, 1485, 1450, 1425, 1190, 1110, 995, 970, 900, 820, 765, 735 és 700 cm^{-1} .

376. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3(R),5-dihidroxil-4(RS)-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabiciklo [2.2.1]-hept-5-ill-5-hepténsav

8,2 mg (14 μmol) 375. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 6,6 mg (12 μmol , 85 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3700-2400, 3080, 3050, 3030, 2930, 2880, 1710, 1600, 1485, 1450, 1405, 1295, 1240, 1195, 1045, 1005, 995, 970, 890, 835, 765, 735 és 700 cm^{-1} .

377. példa

(1S,4R,5S(5Z),6S)-7-[4-(4-Fenil-fenil)-6-[3(S),5-dihidroxi-4(RS)-fenil-1(E)-pentenil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

15,3 mg (27 μ mol) 375. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 14 mg (25 μ mol, 94 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként. IR (film): 3700-2400, 3080, 3060, 3030, 2930, 2880, 1705, 1600, 1490, 1450, 1400, 1240, 1195, 1045, 1005, 995, 970, 890, 835, 765, 730 és 700 cm^{-1} .

378. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-ciano-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(Z)-hepténsav-terc-butyl-észter

13,2 mg (32 μ mol) 274a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon 4-ciano-benzil-bromiddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 13,7 mg (26 μ mol, 82 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában. IR (film): 3050, 2980, 2930, 2870, 2230, 1745, 1610, 1510, 1365, 1230, 1160, 1125, 1030, 945, 895, 835, 820 és 735 cm^{-1} .

379. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-ciano-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(Z)-hepténsav

13,7 mg (26 μ mol) 378. példa szerint előállított észter a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 10,5 mg (23 μ mol, 88 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-2500, 3070, 3040, 2920, 2870, 2230, 1725, 1610, 1510, 1230, 1160, 1115, 1030, 1020, 975, 895, 835 és 820 cm^{-1} .

380. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-ciano-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-3-oxa-5(E)-hepténsav

11,2 mg (28 μ mol) 276a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon 4-ciano-benzil-bromiddal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 10 mg (21 μ mol, 77 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-2500, 3040, 2920, 2860, 2220, 1720, 1610, 1510, 1420, 1370, 1230, 1160, 1115, 1100, 1030, 970, 895, 830 és 820 cm^{-1} .

381. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(4-ciano-benzil-oxi-metil)-2-oxabicyklo [2.2.1]hept-5-ill]-3-oxa-5(E)-hepténsav-metil-észter

3 mg (6 μ mol) 380. példa szerint előállított savat a 186. példában leírt módon észterezünk, és az oldószer

eltávolítása után 3 mg (6 μmol , 99 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3070, 3040, 2920, 2860, 2220, 1735, 1605, 1510, 1420, 1230, 1160, 1105, 1025, 970, 895, 830 és 820 cm^{-1} .

382. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-naft-2-il-metoxi-metil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-il]-3-oxa-5(E)-hepténsav-terc-butyl-észter

11,7 mg (29 μmol) 276a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírtaknak megfelelően 2-bróm-metil-naftalinnal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 15,6 mg (28 μmol , 98 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3050, 2970, 2920, 2860, 1745, 1600, 1510, 1365, 1225, 1160, 1125, 1030, 970, 895, 830, 820 és 750 cm^{-1} .

383. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(naft-2-il-metoxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-il]-3-oxa-5(E)-hepténsav

15,6 mg (28 μmol) 382. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 10,8 mg (22 μmol , 79 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3600-2400, 3050, 2920, 2860, 1730, 1605, 1510, 1230, 1160, 1120, 1030, 970, 895, 830, 820 és 750 cm^{-1} .

384. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(naft-2-il-metoxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(Z)-hepténsav-terc-butyl-észter

14,3 mg (35 μmol) 274a) példa szerint előállított alkoholt az 1. példában leírt módon 2-(bróm-metil)-naftalin-nal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 18,2 mg (33 μmol , 95 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olaj formájában.

IR (film): 3050, 2970, 2920, 2860, 1745, 1600, 1510, 1365, 1230, 1160, 1120, 1030, 945, 895, 830, 820 és 750 cm^{-1} .

385. példa

(1S,4R,5S,6R)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-(naft-2-il-metoxi-metil)-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(Z)-hepténsav

18,2 mg (33 μmol) 384. példa szerint előállított észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12,9 mg (26 μmol , 79 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olaj alakjában.

IR (film): 3700-2500, 3050, 3010, 2920, 2860, 1725, 1605,
1510, 1230, 1160, 1125, 1100, 1030, 975, 950,
895, 830, 820 és 750 cm^{-1} .

386. példa

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidrox-
-4(RS)-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-
-oxa-5(Z)-hepténsav-terc-butyl-észter (A) és

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-fluor-fenil)-6-[3(R)-hidrox-
-4(RS)-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-
-oxa-5(Z)-hepténsav-terc-butyl-észter (B)

39 mg ($73\text{ }\mu\text{mol}$) 386a) példa szerint előállított
telítetlen ketont a 23. példában leírt módon redukálunk, és
feldolgozás és tisztítás után 34 mg ($63\text{ }\mu\text{mol}$, 87 %) szintelen
olajat kapunk, amely a két cím szerinti vegyület keveréke.

IR (film): 3600-3200, 3060, 3020, 2970, 2930, 2870, 1740,
1600, 1510, 1450, 1370, 1230, 1160, 1125, 1000,
970, 945, 895, 835, 735 és 700 cm^{-1} .

A kromatográfiás elválasztás eredményeként 13,1 mg
($24\text{ }\mu\text{mol}$, 33 %) nempoláros alkoholt, amelyhez az A szerkeze-
tet rendeljük, és 18,7 mg ($35\text{ }\mu\text{mol}$, 48 %) poláros alkoholt
különítünk el, amelyhez a B szerkezetet rendeljük.

386a) példa

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3-oxo-4(RS)-
-fenil-1(E)-pentenil]-2-oxabicyclo [2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(Z)-
-hepténsav-butyl-észter

56,8 mg (140 μ mol) 286b) példa szerint előállított aldehidet a 23a) példában leírtaknak megfelelően dimetil-[2-oxo-3(RS)-fenil-butil]-foszfonáttal reagáltatunk, és feldolgozás és tisztítás után 39 mg (73 μ mol, 52 %) cím szerinti vegyületet különítünk el szintelen olajként.

IR (film): 3060, 3020, 2970, 2930, 2870, 1740, 1690, 1665, 1620, 1600, 1510, 1450, 1370, 1230, 1160, 1125, 1040, 1000, 975, 940, 900, 835 és 700 cm^{-1} .

387. példa

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(R)-hidroxil-4(RS)-fenil]-1(E)-pentenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-3-oxa-5(Z)-hepténsav

18,7 mg (35 μ mol) 386. példa szerint előállított poláros B észtert a 2. példában leírt módon elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 12,8 mg (27 μ mol, 76 %) cím szerinti vegyületet kapunk szintelen olajként.

IR (film): 3600-3200, 3080, 3050, 3020, 2970, 2930, 2870, 1730, 1610, 1510, 1450, 1230, 1160, 1110, 1015, 995, 970, 895, 835 és 700 cm^{-1} .

388. példa

(1S,4R,5S,6S)-7-[4-(4-Fluor-fenil)-6-[3(S)-hidroxil-4(RS)-fenil]-1(E)-pentenil]-2-oxabicyclo[2.2.1]hept-5-yl]-5-hepténsav

13,1 mg (24 μ mol) 386. példa szerint előállított nempoláros A észtert a 2. példában leírtaknak megfelelően

elszappanosítunk, és feldolgozás és tisztítás után 8,5 mg (18 μ mol, 74 %) cím szerinti vegyületet különítünk el színtelen olaj alakjában.

IR (film): 3600-3200, 3080, 3060, 3020, 2970, 2930, 2870, 1725, 1605, 1510, 1450, 1425, 1230, 1160, 1105, 1015, 995, 970, 940, 895, 835 és 700 cm^{-1} .

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. (I) általános képletű 2-oxa-biciklo [2.2.1]heptán-
-származékok és enantiomerjeik - a képletben

- A $-(CH_2)_n-$, (E)- vagy (Z)-CH=CH- vagy $-C\equiv C-$ csoport
vagy oxigén- vagy kénatom,
- n értéke 0-7,
- B hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkilcsoport, $-OR^2$,
 $-COOR^3$ általános képletű csoport, halogénatom,
cianocsoport, azidocsoport, (a), (b), (c), (d),
(e), (f) vagy (g) általános képletű csoport, 5-
vagy 6-tagu heterogyűrűs csoport, amely legalább
egy nitrogén-, oxigén- vagy kénatomot tartalmaz,
- R^1 oxigénatom, közvetlen kötés vagy metilén-csoport,
- R^2 hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkilcsoport, X cso-
porttal helyettesített 6-12 szénatomos arilcsoport
vagy X csoporttal helyettesített 7-16 szénatomos
aralkilcsoport,
- R^3 hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkilcsoport, 5-6
szénatomos cikloalkilcsoport, 6-12 szénatomos
arilcsoport vagy 7-16 szénatomos aralkilcsoport,
- X hidrogénatom, 1-5 szénatomos alkilcsoport, halogén-
atom, cianocsoport, azidocsoport, nitrocsoport,
trifluor-metil-csoport, (t), $-OR^2$ vagy $-COOR^3$ álta-
lános képletű csoport,

- R^4 (u) vagy (v) képletű csoport, $-\text{COOR}^5$ általános képletű csoport, amelyben R^5 hidrogénatom, adott esetben halogénatommal, fenilcsoporttal, 1-4 szénatomos alkoxycsoporttal vagy di(1-4 szénatomos)alkil-amino-csoporttal helyettesített 1-10 szénatomos alkil-csoport, 5-6 szénatomos cikloalkilcsoport, 7-16 szénatomos aralkilcsoport, X csoporttal helyettesített fenacilcsoport vagy 6-12 szénatomos arilcsoport vagy 5-6-tagu heterogyűrűs csoport, amely legalább egy nitrogén-, oxigén- vagy kénatomot tartalmaz, vagy $-\text{CONHR}^6$ általános képletű csoport, amelyben R^6 hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkanoilcsoport, 1-10 szénatomos alkánszulfonilcsoport vagy $-\text{CONR}^2\text{R}^3$ vagy (w) általános képletű csoport, amelyben t értéke 2 vagy 3, vagy morfolino-karbonil-csoport,
- Z $-(\text{CH}_2)_p-$ vagy $-\text{CH}=\text{CR}^7-$ általános képletű csoport, amelyben p értéke 0-5, (E)- $\text{CH}=\text{CH}-$ vagy $-\text{C}\equiv\text{C}-$ csoport,
- W közvetlen kötés, $-\text{O}-\text{CO}-$, $-\text{NH}-\text{CO}-$, $\begin{array}{c} \diagup \text{C} \diagdown \\ \parallel \\ \text{NH} \end{array} \begin{array}{c} \text{O} \\ \diagup \end{array}$ képletű csoport, szabad vagy funkcionálisan átalakított $\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \mid \\ \text{C} \\ \mid \\ \text{OH} \end{array}$ csoport, amelyben a hidroxycsoport alfa- vagy béta-állásu lehet,
- D közvetlen kötés, (x) vagy $-\text{NR}^2-$ általános képletű csoport, (y) képletű vagy $-\text{NH}-\text{SO}_2-$ csoport,

- 1-5 szénatomos egyenes szénláncu telített alkilén-csoport, elágazó láncu telített vagy egyenes vagy elágazó szénláncu 2-5 szénatomos telítetlen alkilén-csoport, amely adott esetben fluoratómmal helyettesített, s értéke 2-4,
- E közvetlen kémiai kötés, $-C\equiv C-$ csoport vagy $-CH=CR^7-$ általános képletű csoport, amelyben R^7 hidrogénatom, 1-5 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy trifluor-metil-csoport,
- R^8 hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkilcsoport, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, adott esetben X csoporttal helyettesített 7-16 szénatomos aralkilcsoport, adott esetben X csoporttal helyettesített 6-12 szénatomos arilcsoport vagy 5- vagy 6-tagu heterogyűrűs csoport, amely legalább egy nitrogén-, oxigén- vagy kénatomot tartalmaz, vagy, ha E közvetlen kötést jelent, 1-8 szénatomos alkoxics csoport, (h), (i), (j), (k), (l), (m), (n), (o), (p), (q), (r), (s), $-O-Si(B^3)_3$ vagy $-O(CH_2)_s-L-(CH_2)_o-X$ általános képletű csoport, morfolino-, pirrolidino-, piperidino- vagy imidazol-1-il-csoport, a képletekben $-(X)_p$ jelentésében, amennyiben p értéke 2 vagy 3, X azonos vagy különböző lehet, o értéke 0-5, B^1 és B^2 azonos vagy különböző és a halogénatom kivételével jelentésük megegyezik B jelentésével,

a B³ csoportok azonosak vagy különbözőek, és 1-4 szénatomos alkilcsoportot, fenilcsoportot vagy 7-16 szénatomos aralkilcsoportot jelentenek,

L oxigén- vagy kénatom,

és amennyiben R⁵ hidrogénatomot jelent, a vegyületek fiziológiasan elfogadható bázisokkal alkotott sói, alfa-, béta- vagy gamma-ciklodextrinnel alkotott komplexei, valamint liposzómákkal kapszulázott formái.

2. Gyógyászati készítmények, amelyek egy vagy több 1. igénypont szerinti vegyületet és szokásos segéd-, hordozó- és adalékanyagokat tartalmaznak.

3. Eljárás (I) általános képletű 2-oxa-biciklo [2.2.1]-heptán-származékok előállítására, azzal jellemezve, hogy egy (II) általános képletű 6-(hidroximetil)-vegyületet - a képletben A, B, Z és R¹ jelentése a fenti és R⁴ egy -COOR⁵ általános képletű csoport, amelyben R⁵ a hidrogénatom kivételével az előzőekben megadott jelentésű - egy (III) általános képletű vegyülettel - a képletben Hal bróm- vagy klóratomot jelent és W, D, E és R⁸ jelentése a fenti - reagáltatunk, vagy oxalkil-klorid/dimetil-szulfoxid rendszerrel végzett oxidáció után egy (V) általános képletű dimetil-foszfónáttal - a képletben D, E és R⁸ jelentése a fenti - nátrium-hidrid vagy nátrium-hidrid/Br₂ jelenlétében reagáltatunk, és végül redukálunk, és adott esetben hidrogén-bromidot hasítunk ki belőle, vagy a (II) képletű vegyületből oxalil-klorid/dimetil-szulfoxid

rendszerrel kapott oxidációs terméket egy (IX) általános képletű aminnal - a képletben R^{10} jelentése difenil-metoxi- vagy fenil-ureido-csoport - vagy szén-tetrabromiddal és trifenil-foszfinnal, végül egy (X) általános képletű vegyülettel - a képletben R^8 jelentése a fenti - reagáltatunk, vagy az oxidáció és az azt követő tionil-kloriddal és nátrium-aziddal végzett reakció után a közbenes termék amint egy (III) általános képletű halogén-vegyülettel reagáltatjuk, és a kapott észtert elszappanosítjuk, sóvá alakítjuk, ciklo-dextrin-komplexet képezünk belőle vagy liposzómákkal kapszulázzuk.

A meghatalmazott:

+ Cley 72
R 12

2007
S.S.C.A.E.
BUDAPESTI NEMZETKÖZI ÜGYVÉDI
ÉS SZABADALMI IRODA
1061 BUDAPEST, DALSZÍNHÁZ U. 10.
TELEFON: 183-5723

6000/89

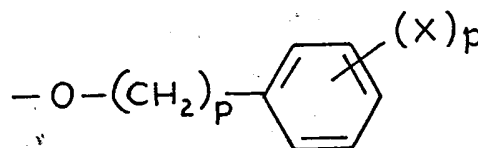
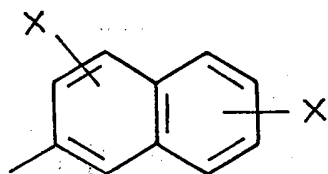
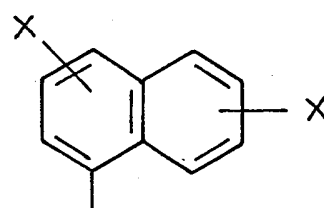
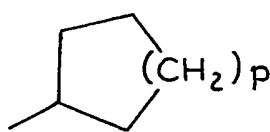
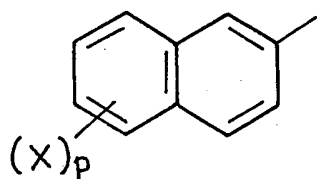
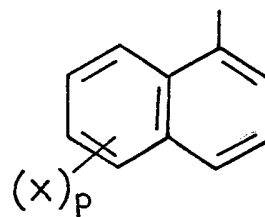
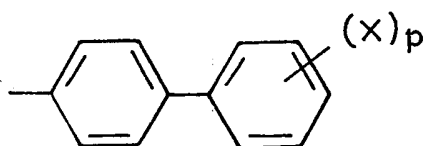
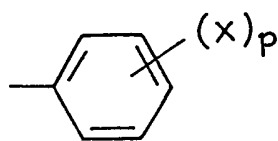
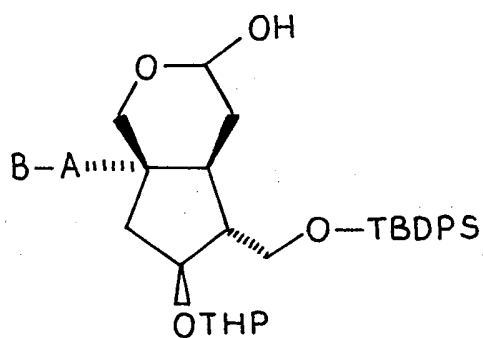
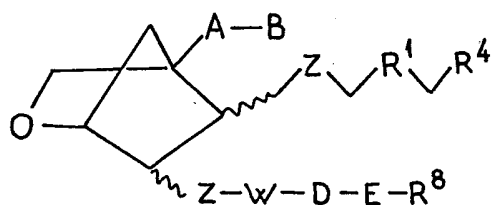
58712

53671/PA

LETÉTELI
DÁNY

58712

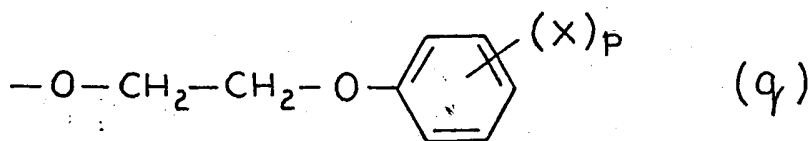
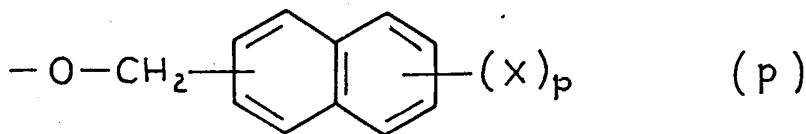
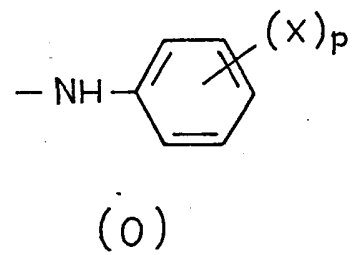
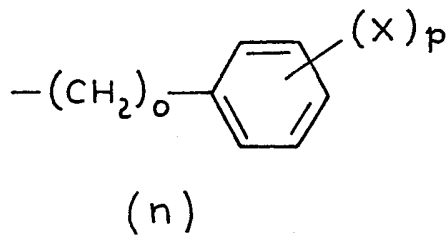
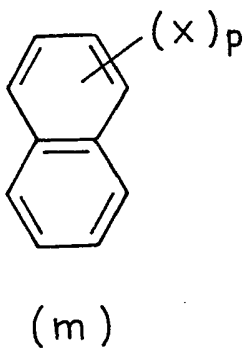
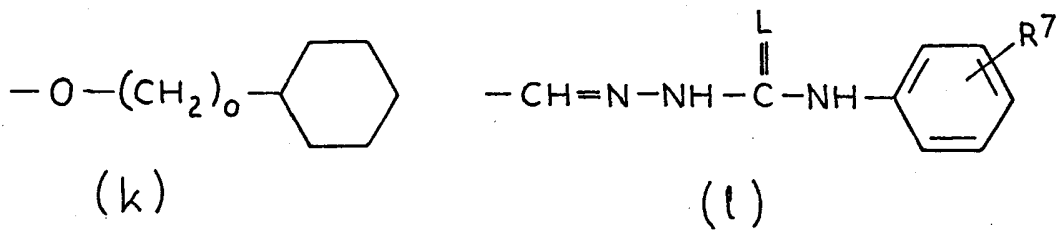
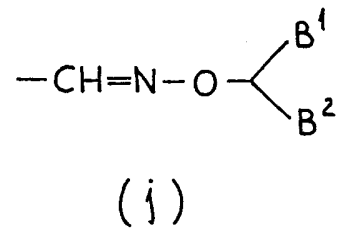
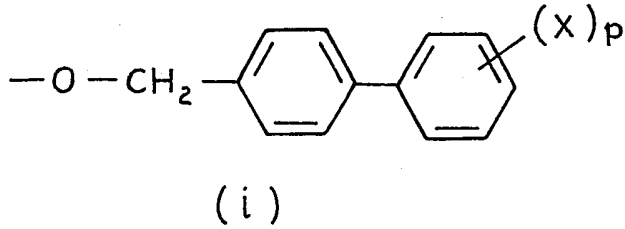
6/1



S.B.G. & K.
BUDAPESTI NEMZETKÖZI ÜGYVÉRSÉG
ÉS SZABADALMI IRODA
1061 BUDAPEST, DALSZÍNHÁZ U. 10.
TELEFON: 155-5733

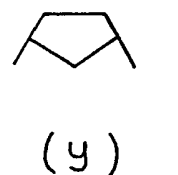
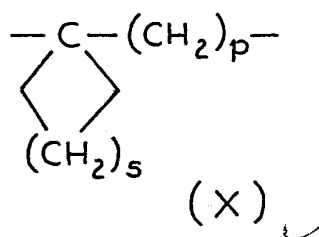
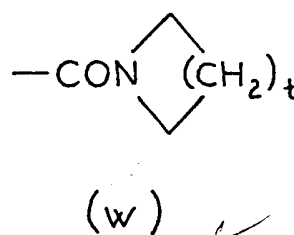
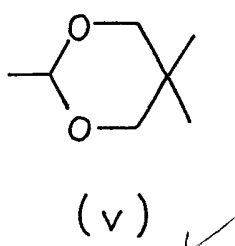
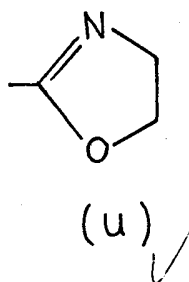
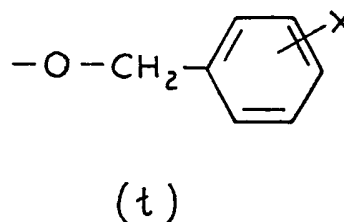
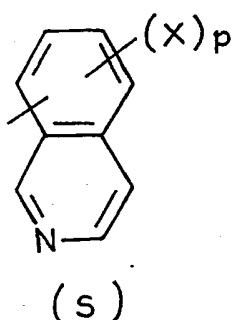
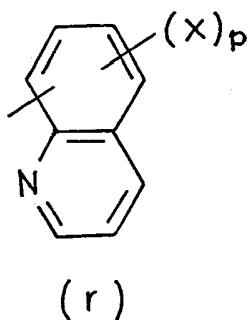
KÖZZÉTÉTELI
PÉLDÁNY

6/2

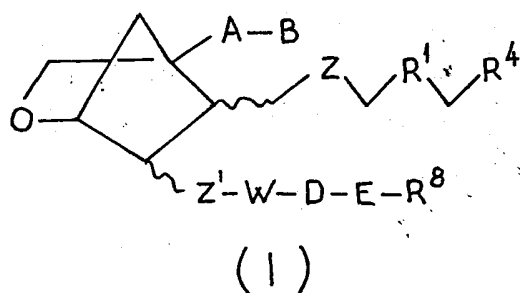
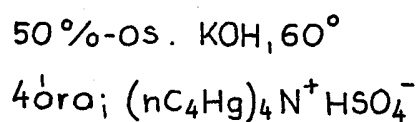
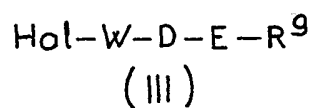
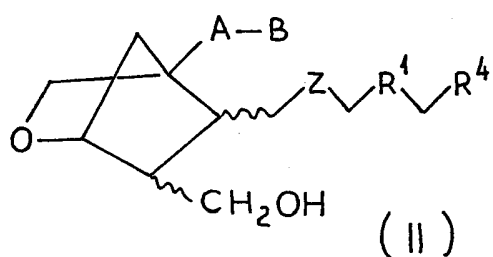


KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

6/3



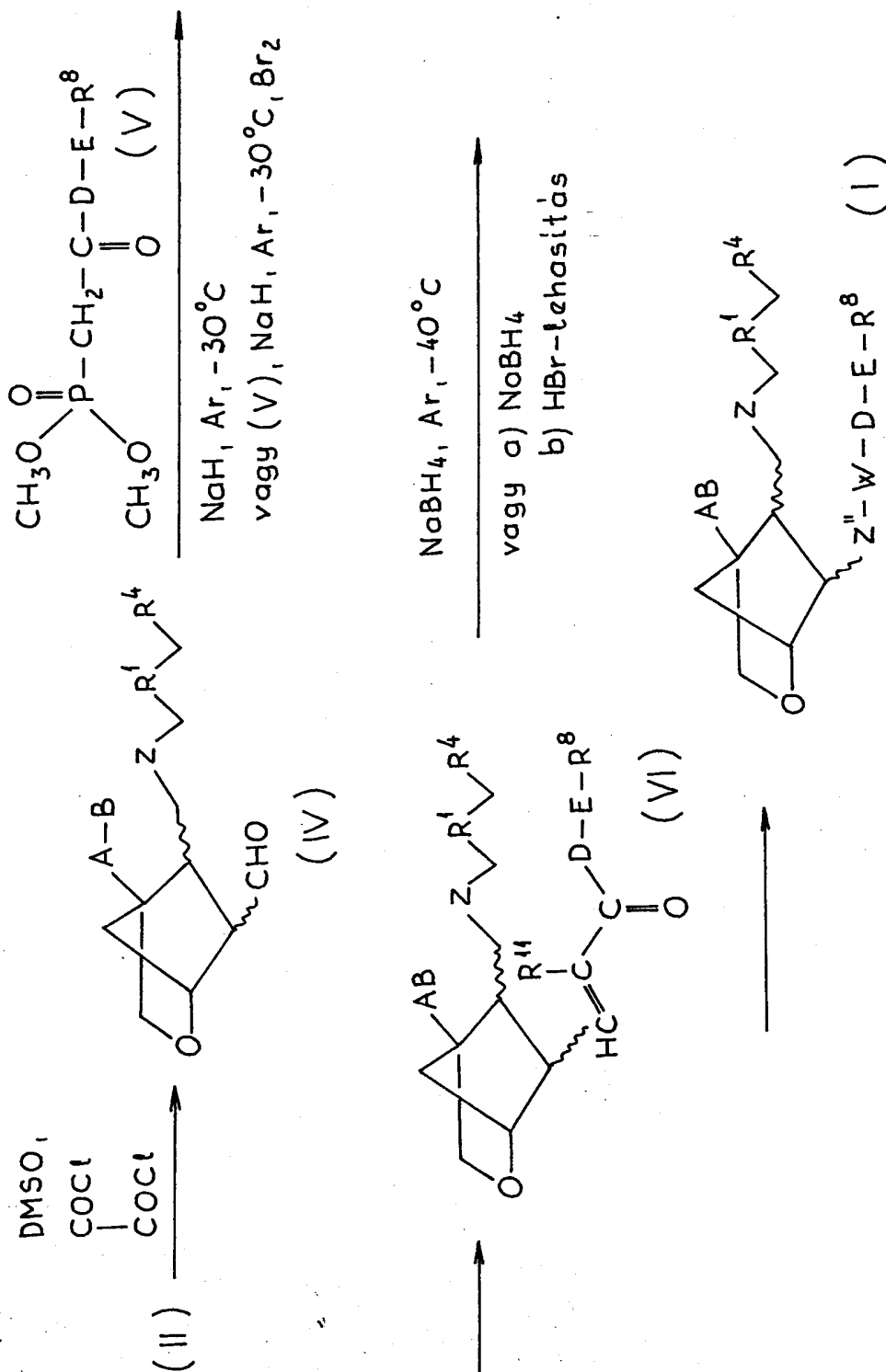
[A] reakcióvázlat



KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

6/4

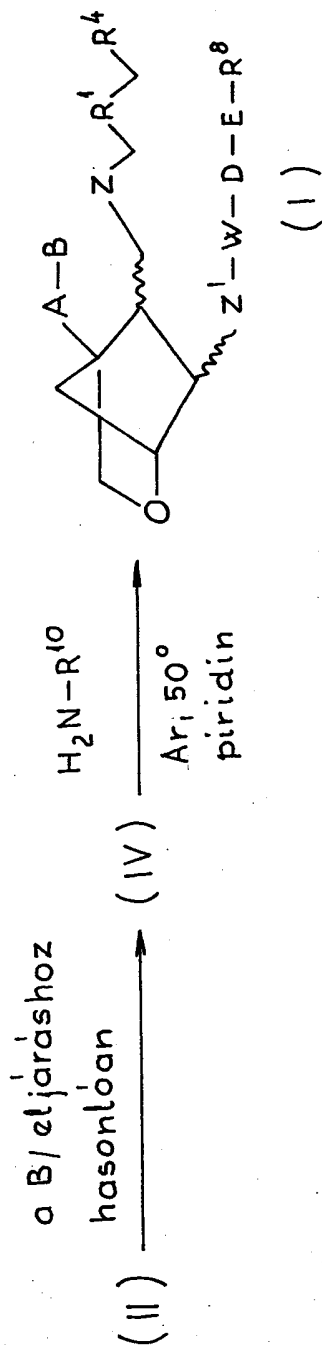
[B] reakcióvázlat



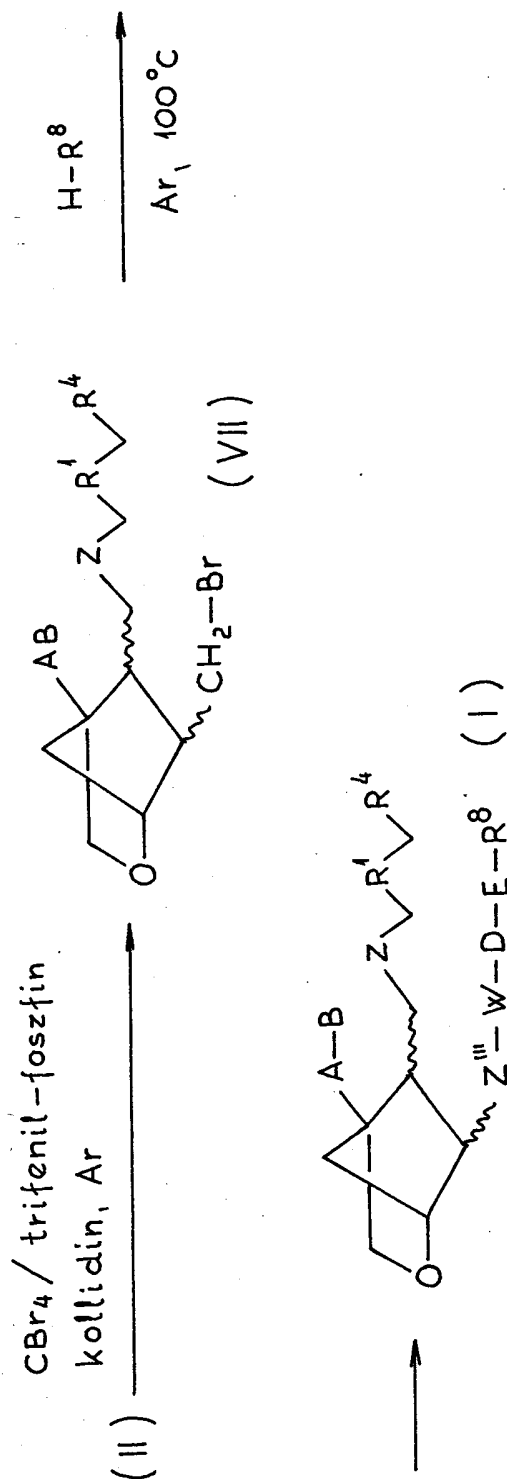
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

6/5

[C] reakcióvázzlat



[D] reakcióvázzlat



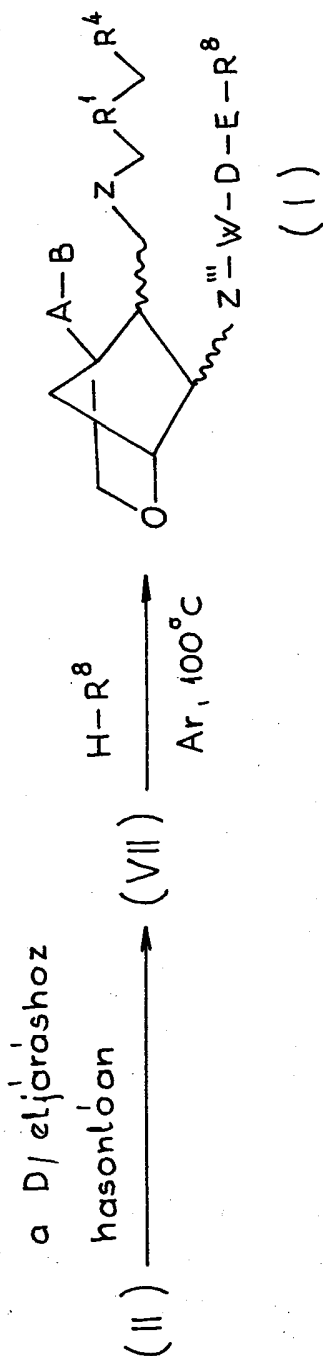
52671/PA

52671/PA

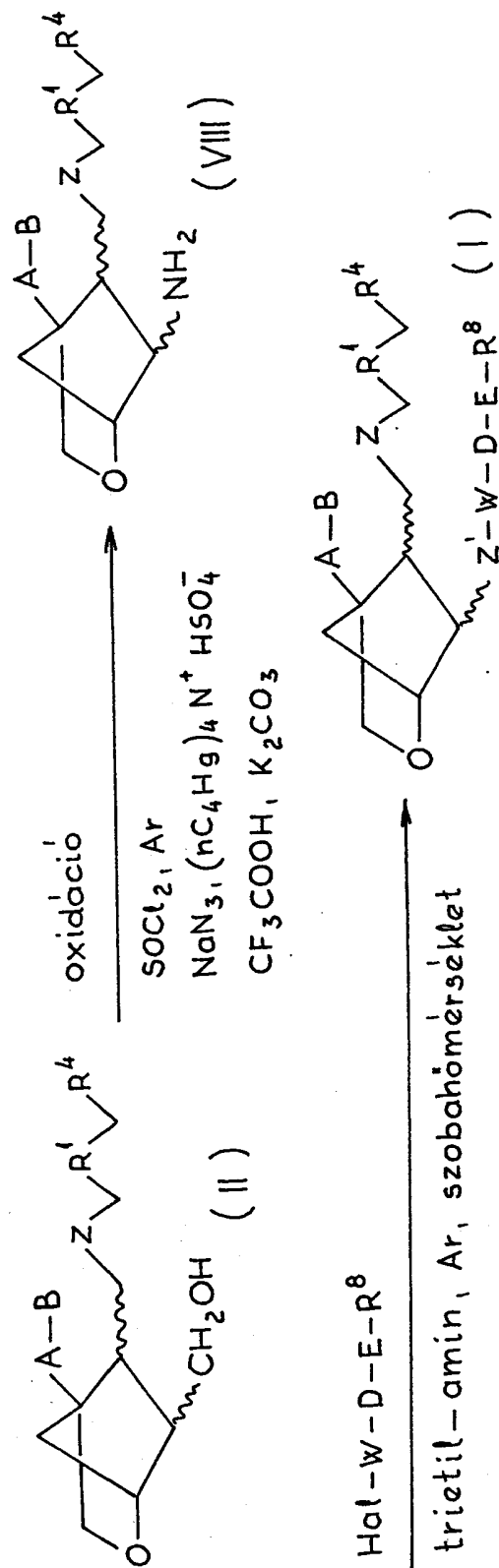
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

6/6

[E] reakcióvázlat



[F] reakcióvázlat



Handwritten signature