

Hibajegyzék

Mészáros Ádám

Fluortartalmú vegyületek fejlesztése és alkalmazása

című doktori értekezéséhez

4. oldal

„5.1.2.1 Nukelofil addíción keresztül történő előállítás” helyett: 5.1.2.1 Nukleofil addíción keresztül történő előállítás

5. oldal

„7.1 Szekvenciális [...]” helyett: 7.1 Szekvenciális [...]

8. oldal

„EtOACetil-acetát (CAS: 141-78-6)” helyett: EtOAc.....etil-acetát (CAS: 141-78-6)

9. oldal

„molecular shieve” helyett: molecular sieve

11. oldal

„A reakciókörülmények módosításával mind az alkalmazható szubsztrátok köre bővíthető, [...]”
helyett: A reakciókörülmények módosításával mind az alkalmazható szubsztrátok köre bővíthető, [...]

12. oldal

„Az aromás jodidok és vinil-bromidok önmagukban is reaktív vegyületeknek tekinthetők, ezenkívül az aromás jódvegyületek fotoszenzitívek is.” helyett: Az aromás jodidok és vinil bromidok a legtöbb kapcsolási reakcióban megfelelő reaktivitással bírnak. Ezek mellett azonban a jódvegyületek fotoszenzitívek is.

13. oldal

„A már említett hordozóhoz kötött katalizátorformák nemcsak a reaktivitást növelhetik, hanem a bioaktív vegyületek szintézise során segítenek csökkenteni a termék palládiumtartalmát is.”

helyett: A már említett, hordozóhoz kötött katalizátortípusok nemcsak a reaktivitást növelhetik, hanem a bioaktív vegyületek szintézise során segítenek csökkenteni a termék palládiumtartalmát is.

„A Sonogashira-kapcsolás határait a fenti módszerekkel szélesíteni tudták, ám az acetilének elérhetőségét, valamint a kereskedelmi árukat ez nem csökkentette.” helyett: A Sonogashira-kapcsolás határait a fenti módszerekkel szélesíteni tudták, ám az acetilének elérhetősége nem javult, valamint a kis tételű kereskedelmi árukat ez nem csökkentette.

„Amennyiben az acetilén másik végét is az elsőtől eltérően funkcionálizálni kívánjuk, szükségünk van a két vég eltérő reaktivására, amely legkönnyebben az egyik végén védőcsoporttal ellátott acetilénszármazékkal érhető el.²⁶” helyett: Amennyiben nemszimmetrikus acetilént kívánunk előállítani, szükségünk van a két vég eltérő reaktivására, amely legkönnyebben 1-es helyzetben védőcsoporttal ellátott acetilénszármazékkal érhető el.²⁶

„Az irodalomban 3 alapvető típust különböztetünk meg, amelyek kapcsolási reakcióban való reaktivása hasonló, a védőcsoport eltávolíthatóságában viszont elemi különbségeket tapasztalunk. Így használhatunk szilil- (18a), kabinol- (18b) és karboxilát- (18c) típusú acetilénszármazékokat.” helyett: Az irodalomban 3 típust különböztetünk meg, amelyek kapcsolási reakcióban való reaktivása hasonló, a védőcsoport eltávolíthatóságában viszont alapvető különbségeket tapasztalunk. Így használhatunk szilil- (**18a**), karbinol- (**18b**) és karboxilát- (**18c**) típusú acetilén-származékokat.

14. oldal

„A leggyakrabban alkalmazott forma a trimetilszilil-származék (TMS), azonban trietilszilil- (TES), triizopropilszilil- (TIPS), terc-butil-dimetilszilil- (TBS) és difenil-metilszilil- (DPMS) származékok szintézisére is találunk példát az irodalomban. A védőcsoport-család nagy előnye, hogy a szililcsoport könnyen eltávolítható közönséges körülmények között, azonban hátránya a másik két szintézisstratégiában használható vegyülethez képest vett magas ára.” helyett: A leggyakrabban alkalmazott védőcsoport a trimetilszilil-származék (TMS), azonban trietilszilil- (TES), triizopropilszilil- (TIPS), terc-butil-dimetilszilil- (TBS) és difenil-metilszilil- (DPMS)

származékokra is találunk példát az irodalomban. A védőcsoport-család nagy előnye, hogy a szililcsoport könnyen eltávolítható, azonban hátránya a másik két védőcsoport-típussal ellátott acetilénhez képest magas ára.

A szilil-védőcsoport hagyományos eltávolítása TBAF-dal történik.²⁸⁻³¹ Megbízható, robusztus módszer, azonban alkalmazása a költségeket tovább növeli. Ezt próbálták más, akár katalitikus eljárásokkal is helyettesíteni. Az alábbiakban a C-Si kötés hasításának eddig feltárt útjait mutatom be.” helyett: A szilil-védőcsoport hagyományos eltávolítása TBAF-dal történik.²⁸⁻³¹ Megbízható, robusztus módszer, azonban alkalmazása a költségeket jelentősen növeli. Ezért próbálták más, akár katalitikus eljárásokkal is helyettesíteni.

„A Si-heteroatom és Si-C kötések leghatékonyabb és leggyorsabb módja a szerves oldószerekben rendkívül jól oldódó TBAF alkalmazása.” helyett: A C-Si kötés hasításának leggyorsabb, és általában a legkevesebb mellékreakcióval járó módja a tetrabutil-ammónium-fluorid alkalmazása.

„A semleges és enyhe reakciókörülmények még átmenetifém-organikus komplexeken történő átalakításokat is lehetővé tesznek (5. ábra).” helyett: A semleges és enyhe reakciókörülmények még érzékeny átmenetifém-komplexeken történő átalakításokat is lehetővé tesznek (5. ábra).

15. oldal

„Főként a trimetilszilil (TMS)-származékok érzékenyek a bázikus közeg jelenlétére. Bázisként használhatóak alkálifém-karbonátok,³³⁻³⁷ ezüst-karbonát,³⁸ de ha a szubsztrát megengedi, erősebb bázisok is. Beszámoltak vizes rendszerű DBU nagy feleslegének jelenlétében végzett deszililezésről is.³⁹ A TMS-acetilén alkalmazásával lehetőségünk nyílik szekvenciális Sonogashira-kapcsolásra (6. ábra).” helyett: A trimetilszilil (TMS)-származékok bázisok segítségével hasíthatók. Bázisként használhatóak alkálifém-karbonátok,³³⁻³⁷ ezüst-karbonát,³⁸ de ha a szubsztrát megengedi, erősebb bázisok is. Így például beszámoltak vizes rendszerű DBU nagy feleslegének jelenlétében végzett deszililezésről is.³⁹ Ez alapján a TMS-acetilén alkalmazásával lehetőségünk nyílik szekvenciális Sonogashira-kapcsolásra (6. ábra).

16. oldal

„A szekvenciális kapcsolásokat túlnyomó többségében belső acetilének szintézisében használják fel, mivel azok már önmagukban is értékes célmolekulák. Lehetőség nyílik azonban a kiindulási acetilénszármazékok megválasztásával benzofurán és indol, illetve azidok segítségével 1H-1,2,3-triazolok szintézisére is. Az oxigéncsoport elemeivel könnyedén kialakul

a kívánt heterociklus, azonban az indolszintézishez megfelelően aktivált környezet szükséges, különben az aromás aminocsoport a hármaskötés jelenlétében intakt marad, és indolváz vegyületek keletkezése helyett belső acetiléneket kapunk. A benzofurán-, indol- és 1,2,3-triazol-származékok rendkívül fontos építőelemek. Számos biológiailag aktív farmakon (API) alapvázát adják.” helyett: A szekvenciális kapcsolásokat túlnyomó többségében belső acetilének szintézisében használják fel, mivel azok már önmagukban is értékes célmolekulák. Lehetőség nyílik azonban a kiindulási acetilénszármazékok megválasztásával benzofurán és indol, illetve azidok segítségével 1H-1,2,3-triazolok szintézisére is. A benzofurán-, indol- és 1,2,3-triazol-származékok rendkívül fontos építőelemek. Számos biológiailag aktív farmakon (API) alapvázát adják. Kalkogénekkal könnyedén kialakul a kívánt heterociklus, azonban az indolszintézishez megfelelően aktivált környezet szükséges, különben az aromás aminocsoport a hármaskötés jelenlétében intakt marad, és indolváz vegyületek keletkezése helyett belső acetiléneket kapunk.

17. oldal

„Az indolváz a gyógyszerek között leggyakrabban alkalmazott N-heterociklusos alapváz. A szervezetben is megtalálható neurotranszmitterek (triptamin, 5-HT, melatonin) formájában, illetve esszenciális aminosavként (triptofán) juttatjuk a szervezetünkbe.” helyett: Az indolváz a gyógyszerhatóanyagok szerkezetében az egyik leggyakrabban megtalálható N-heterociklusos alapváz. A szervezetben is megtalálható neurotranszmitterekként (triptamin, 5-HT, melatonin), illetve esszenciális aminosavként (triptofán) juttatjuk a szervezetünkbe.

„Nagy mennyiségben fordul elő a kőszénkátrányban, azonban rengeteg preparatív szerves kémiai szintézise is elérhető.” helyett: Nagy mennyiségben fordul elő a kőszénkátrányban, azonban preparatív szerves kémiai szintézisére is számos példát találunk az irodalomban.

18. oldal

„A triazoltartalmú, ezen belül is nagyrészt a könnyebben előállítható 1,2,3-triazolok szintén fontos építőkövek a kismolekulás gyógyszerkutatásban.” helyett: A triazoltartalmú, ezen belül is nagyrészt a könnyen előállítható 1,2,3-triazolok, szintén fontos építőkövek a kismolekulás gyógyszerkutatásban.

19. oldal

„A hexafluoroszilikát só is hidrolízist szenved vizes közegben, közel semleges kémhatású közegben az előző folyamathoz hasonlóan.⁶⁷” helyett: - (Redundancia miatt.)

20. oldal

„Az eljárást katalitikus mennyiségben is elvégezték.” helyett: Az eljárást kiterjesztették katalitikus mennyiségű hexafluorkovaszavat felhasználó kemoselektív deszililezési reakciókra is.

„Erre az irodalomban találhatunk példát, ahol a TBAF-ot használnak, a reakció végén sósavas THF-nal kvencselve az elegyet.” helyett: Erre az irodalomban találhatunk példát, ahol TBAF-ot használnak, a reakció végén sósavas THF-nal kvencselve az elegyet.

21. oldal

„A javaslat szerint a hat darab Si-F kötés valamelyikének disszociációja révén képes az elektronban gazdag oxigénatom Lewis-bázisként a szilíciumhoz kötődni, majd a rendszerben lévő víz, mint additív a szilán védőcsoportot lehasítja szilanolként, végül pedig a ciklus elején lehasadt HF leszorítja az alkoholt, és a katalitikus ciklus újraindul.” helyett: A javaslat szerint a hat darab Si-F kötés valamelyikének disszociációja révén képes az oxigénatom Lewis-bázisként a szilíciumhoz kötődni, majd a rendszerben lévő víz a szilán védőcsoportot lehasítja szilanolként, végül pedig a ciklus elején lehasadt HF leszorítja az alkoholt, és a katalitikus ciklus újraindul.

22. oldal

„Ezek közül is széleskörűbb szerves kémiai alkalmazása a benzjodoxolonoknak (70) és Togni-reagensnek (69, illetve ezzel analóg vegyületeknek) és a jodóniumsóknak (71) van.” helyett: Ezek közül is széleskörűbb szerves kémiai alkalmazása a benzjodoxolonoknak (70), Togni-reagensnek (69, illetve ezzel analóg vegyületeknek) és a jodóniumsóknak (71) van.

„A jodóniumsók közül a diaril-jodóniumsók előállítása és felhasználása jól kidolgozott, számos módszer ismert lúgos, semleges, illetve savas és extrém savas közegben történő [...]” helyett: A jodóniumsók közül a diaril-jodóniumsók előállítása és felhasználása részletesen tanulmányozott, számos módszer ismert lúgos, semleges, illetve savas és extrém savas közegben történő [...].”

23. oldal

„Ritkábbak az alkil-, alkenil-és alkinil jodóniumsók. Ezek stabilitása sokszor nem elegendő ahhoz, hogy a reagensek akár középtávon kiszerezhetők legyenek.” helyett: Ritkábbak az alkil-, alkenil- és alkinil-jodóniumsók. Ezek a vegyületek rendkívül instabilak, és vagy nem

állíthatók elő, vagy a tárolásuk során, akár alacsony hőmérsékleten is gyors bomlást szenvednek.

„Bár az előállítása ezen vegyületcsalád első tagjainak szintézisét Thiele és Haakh már 1910-ben bemutatta, ám általánosabb előállításuk és a diaril-jodóniumsókhoz képest még így is korlátozott felhasználásuk az 1990-es évekig váratott magára.” helyett: Bár ezen vegyületcsalád első tagjainak szintézisét Thiele és Haakh már 1910-ben bemutatta, ám általános szintézisstratégia nem létezik, így talán ennek is köszönhető, hogy a felhasználásuk az 1990-es évekig váratott magára.

24. oldal

„5.1.1 Szubsztitúciós reakcióval történő előállítás” helyett: 5.1.1 Alkenil-jodóniumsók szubsztitúciós reakcióval történő előállítása

„A legtöbb esetben szükséges a létrejövő jodóniumsó anionjának cseréje, legtöbbször triflátra vagy tetrafluoroborátra.” helyett: A legtöbb esetben szükséges a létrejövő jodóniumsó anionjának cseréje, leggyakrabban triflát vagy tetrafluoroborát sókat alkalmaznak.

„Szilánokat⁷⁹⁻⁸² vagy bórsavakat illetve bórsav-észtereket⁸² alkalmazva elemorganikus reagensként előny, hogy ezek a reagensek hidroszililezési és hidrobórlási eljárásokban viszonylag könnyen előállíthatók, így az alkalmazható szubsztrátok köre is széles.” helyett: Szilánokat⁷⁹⁻⁸² vagy bórsavakat illetve bórsav-észtereket⁸² alkalmazva elemorganikus reagensként előny, hogy e vegyületek hidroszililezési és hidrobórlási eljárásokban viszonylag könnyen előállíthatók, így az alkalmazható szubsztrátok köre is széles.

„A kényelmetlen anioncserét kikerülendő, Olofsson és munkatársai 2016-ban beszámoltak 2-jódbenzoésavból (80) való benzjodoxolon (82) kialakulásával járó szintézisről.” helyett: Az anioncserés eljárásokban az aniont tartalmazó oldat óriási feleslegére van szükségünk, ezenkívül lehetséges anioncserélő gyanta használata, amely az előállítás idejét és a költségeket jelentősen megnövelheti. Ennek egyik lehetséges alternatívájáról Olofsson és munkatársai 2016-ban számoltak be. 2-Jódbenzoésavból (80) kiindulva benzjodoxolon (82) képezhető, amivel az anioncserét elkerülhetjük.

25. oldal

„A cirkóniumorganikuson (egyetlen irodalmi hivatkozás⁸⁴) kívül a lágú ónorganikus vegyületeket is alkalmazhatjuk alkenil-jodóniumsók (90) előállítása céljából (30. ábra).” helyett: A cirkóniumorganikus származékból kiinduló szintézisen kívül a lágú típusú, Lewis-

savas ónorganikus vegyületeket is alkalmazhatjuk alkenil-jodóniumsók **(90)** előállítására céljából.

„Alapvetően a viniljodóniumsók addíciós reakción keresztüli előállításra a hármaskötés reaktivitását tudjuk felhasználni.” helyett: Alapvetően a viniljodóniumsók addíciós reakción keresztüli előállítására a hármaskötés reaktivitását tudjuk felhasználni.

„Az előbbi esetben erősen polározott hármaskötést tartalmazó alkinil-aril-jodóniumsók nukleofil addíciós reakciójával állíthatók elő viniljodóniumsók.” helyett: Az előbbi esetben erősen polározott hármaskötést tartalmazó alkinil-aril-jodóniumsók nukleofil addíciós reakciójával állíthatók elő vinil-jodóniumsók.

26. oldal

„A nukleofil addíció feltétele, hogy a nukleofil ne a jodónium-részlettel lépjen reakcióba, hanem Michael-addícióban vegyen részt, érintetlenül hagyva a hipervalens jódcentrumot.” helyett: A nukleofil addíció feltétele, hogy a nukleofil ne a jodónium-részlettel lépjen reakcióba, hanem Michael-addícióban vegyen részt, érintetlenül hagyva a hipervalens jódcentrumot.

„Alkinil-jodóniumsóra számos nukleofil addicionálható jó, illetve kiváló termeléssel a megfelelő hidrogén-halogeniddel, vagy halogeniddel protonforrás jelenlétében.⁸⁶⁻⁹⁰ N, O és S-nukleofilek szintén reakcióba lépnek a hipervalens jódcentrum sértetlensége mellett (31. ábra).” helyett: Alkinil-jodóniumsóra számos nukleofil addicionálható jó, illetve kiváló termeléssel. A megfelelő hidrogén-halogeniddel, vagy halogeniddel protonforrás jelenlétében,⁸⁶⁻⁹⁰ illetve N, O és S-nukleofilekkel reakcióba lépnek a hipervalens jódcentrum sértetlensége mellett (31. ábra).

„[...] stabilitásával kapcsolatos problémák miatt az anion célszerű visszacserélni például tetrafluoroborátra.” helyett: [...] stabilitásával kapcsolatos problémák miatt az aniont célszerű visszacserélni, például tetrafluoroborátra.

27. oldal

„Savas körülmények között oxidálva bisz-(trifluoracetát) (107) intermedier nyerhető, mellyel trifluormetánszulfonsav jelenlétében aromás elektrofil szubsztitúciós reakcióban alkil-aril-jodóniumsó (108) képződik.” helyett: Savas körülmények között oxidálva bisz-(trifluoracetát) **(107)** intermedier nyerhető, mellyel trifluormetánszulfonsav jelenlétében aromás elektrofil szubsztitúciós reakcióban alkil-aril-jodóniumsó **(108)** képződik.

29. oldal

„4-*terc*-Butilfenil-szulfiddal reagáltatva mind a jodónium, mind a magányos fluoratomhoz kapcsolódó szénen szubsztitúciót tapasztaltak, termékelegy (**115a** és **b**) képződése közben.”

helyett: 4-*terc*-Butilfenil-szulfiddal reagáltatva mind a jodóniumhoz, mind a magányos fluoratomhoz kapcsolódó szénen szubsztitúciót tapasztaltak, termékelegy (**115a** és **b**) képződése közben.

„A sztiril-jodóniumsókhoz (**112**) egy delokalizált gyűrűs átmeneti állapotot feltételeztek (**102b**), amelyet [...]” helyett: A sztiril-jodóniumsókhoz (**112**) egy delokalizált gyűrűs átmeneti állapotot feltételeztek (**112b**), amelyet [...]

31. oldal

„Aldehyd, amid, illetve a 132 tioamid oxigénje, illetve kánatomja a kénre erősen polarizált határszerkezetén keresztül képes a jodóniumcentrummal kölcsönhatni (40. ábra, C, D).”

helyett: Aldehyd, amid, illetve a 132 tioamid kánatomja a kén irányába mezomer effektuson keresztül negatívan polározott, és az így meglévő nukleofil centrum az elektrofil jodóniumsóval képes reakcióba lépni (40. ábra, C, D).

34. oldal

„Ennek intermediere szintén az alkinből jodozilbenzollal kialakított trifloxivinil-jodonium-triflát (**163**, 45. ábra).” helyett: Ennek intermediere szintén az alkinből jodozilbenzollal kialakított trifloxivinil-jodonium-triflát (**163**, 45. ábra).

36. oldal

„Manapság több szintetikus módszer is létezik az aziridingyűrű kialakítására, köztük számos eljárás kínál lehetőséget a sztereoselektív megvalósításra.” helyett: Manapság több szintetikus módszer is létezik az aziridingyűrű kialakítására, köztük számos eljárás kínál lehetőséget az enantioszelektív megvalósításra.

„Triplet állapot (175b) keresztül „step-by-step” lépéseken keresztül lehetőség nyílik az átmeneti állapot (176) σ -kötés körüli rotációjára, így racém elegyet kapunk.” helyett: Triplet állapot (175b) keresztül „step-by-step” lépéseken keresztül lehetőség nyílik a köztitermék (**176**) σ -kötés körüli rotációjára, így racém elegyet kapunk.

37. oldal

„Az egyéb utakon 1,2-dinukleofilek egyik centrumának elektrofillé alakítása révén zártak gyűrűt az irodalomban.” helyett: Az egyéb utakon 1,2-dinukleofilek egyik centrumának elektrofillé alakítása révén zártak gyűrűt az irodalomban.

39. oldal

„Mechanizmusát tekintve (188 kivételével) az aziridin mezomer határszerkezetein keresztül valósul meg.” helyett: - (Helytelen, félrevezető megfogalmazás.)

„Éppen ezért, a trifluormetil-aziridinek fontos eszközei az belőlük levezethető alifás származékok szintéziséhez.” helyett: Éppen ezért, a trifluormetil-aziridinek fontos eszközei a belőlük levezethető alifás származékok szintéziséhez.

„A trifluormetil-aziridinek előállítására irányuló szintézisek során minden esetben fluorozott elektrofil szintézisekvivalensekből indulnak ki.” helyett: A trifluormetil-aziridinek előállítására irányuló szintézisek során minden esetben fluorozott pozitív C₂-CF₃ szinton szintézisekvivalenseiből indulnak ki.

40. oldal

„Ennek oka, hogy stabilisak, kis illékonyágúak és erélyesebb gyűrűnyitási körülményeket is elviselnek.” helyett: Ennek oka, hogy kis illékonyágúak, és stabilitásuk miatt erélyes gyűrűnyitási körülményeket is elviselnek.

karcinogenitás = rákkeltő hatás (megjegyzés)

41. oldal

„Három, alapvetően különböző szintézisstratégia létezik az irodalomban.” helyett: Három, alapvetően különböző szintézisstratégia található az irodalomban.

43. oldal

„Indoklasként a rotáció kristályszerkezet merevsége miatti gátló hatását említik.” helyett: A jelenséget a kristályszerkezet merevsége miatti gátolt rotációval magyarázták a szerzők.

„Hidrazinszármazékok (230) aziridinálása is megvalósítható, azonban ezek igazán jelentős alkalmazásra nem kerültek.” helyett: Hidrazin-származékok (230) aziridinálása is megvalósítható.

44. oldal

„A trifluormetil-aziridinek reakciói a nemfluoros származékokhoz képest alapvetően nagyon hasonlóak.” helyett: A trifluormetil-aziridinek reaktivitása nagyon hasonló a trifluormetilcsoportot nem tartalmazó származékokéhoz.

45. oldal

„Egy-két példán keresztül bemutattam (64-66. ábra), hogy benzil-védett trifluormetil-aziridinek reakcióját is vizsgálták.” helyett: -

47. oldal

„Célunk az irodalomban gyakran alkalmazott, de költséges és kevésbé atomhatékony deszililező reagens, a tetrabutil-ammónium-fluorid kiváltása.” helyett: Célunk az irodalomban gyakran alkalmazott, de költséges és kevésbé atomhatékony deszililező reagens, a tetrabutil-ammónium-fluorid kiváltása volt.

48. oldal

„A hexafluorokovavasav (55) katalitikus mennyiségben való alkalmazhatóságáról a következő fejezetben számolok be.” helyett: -

51. oldal

„Érdemes megemlíteni, hogy a szubsztituálatlan (258a), illetve csak alkil- (258b, c) vagy csak halogén (258f, g) szubsztituenst tartalmazó származékok esetén a termék polaritása hasonló a melléktermékként kisebb-nagyobb mértékben mindig keletkező homokapcsolt diaril-acetilénnel, amelytől normálfázisú oszlopkromatográfiával nehezen vagy egyáltalán nem tudtuk elválasztani. Másik módszerként, semleges alumínán ezek a termékek elválaszthatók egymástól.” helyett: Érdemes megemlíteni, hogy a szubsztituálatlan (258a), illetve csak alkil- (258b, c) vagy csak halogén (258f, g) szubsztituenst tartalmazó származékok esetén a termék polaritása hasonló a melléktermékként kisebb-nagyobb mértékben mindig keletkező homokapcsolt diaril-acetilénnel. Ezek elválasztása normálfázisú oszlopkromatográfiával nehezen vagy egyáltalán volt megvalósítható, azonban semleges alumínán ezek a termékek elválaszthatók egymástól.

51-52. oldal

„A melléktermékek keletkezése visszaszorítható oldószer abszolútizálásával, és a kihevített reakcióedény (üvegcsé, üveglombik) argon-áramban való hűtésével és a hexafluorokovászav oldatának argonnal való átbuborékoltatásával.” helyett: A melléktermékek keletkezése visszaszorítható az oldószer abszolútizálásával és a kihevített reakcióedény (üvegcsé, üveglombik) argon-áramban való hűtésével, valamint a hexafluorkovászav oldatának argonnal való átbuborékoltatásával.

54. oldal

„Bár az előző fejezetben is szereplő (258I/e, 73. ábra), etil-karboxilát tartalmú vegyületet alacsonyabb hozammal tudtuk izolálni, azonban sor került több, gyógyszerkémiaailag is figyelmet igénylő biheterociklus (258p, q) szintézisére is, az általunk kidolgozott szekvenciális-domino kapcsolási reakcióban deszililezés-kapcsolás-gyűrűzárási szekvenciában.” helyett: Bár az előző fejezetben is szereplő (258I/e, 73. ábra), etoxikarbonil tartalmú vegyületet alacsonyabb hozammal tudtuk izolálni, azonban sor került több, gyógyszerkémiaailag is figyelmet igénylő biheterociklus (258p, q) szintézisére is, az általunk kidolgozott, egy üstben történő deszililezés-kapcsolás-gyűrűzárási reakciókban.

56. oldal

„A hexafluoroszilikátot felhasználtuk TBAF kiváltására a katalitikus mennyiségű H_2SiF_6 (55) alkalmazására épülő eljárásunk alapján.” helyett: A hexafluorszilikátot felhasználtuk TBAF kiváltására a katalitikus mennyiségű H_2SiF_6 (55) alkalmazására épülő eljárásunk alapján.

„Olyan átalakításokban kívántuk felhasználni, amelyekben az irodalomban alapján eddig ekvivalens mennyiségű fluoridot (TBAF, CsF, KF) alkalmaztak (78. ábra).” helyett: Olyan átalakításokban kívántuk felhasználni, amelyekben az irodalomomban fellelhető reakciókban eddig ekvivalens mennyiségű fluoridot (TBAF, CsF, KF) alkalmaztak (78. ábra).

„Ezen kísérletek során a kiindulási anyagok (81. ábra, 262a-c) eltűnését, és a belőle származtatott, trifluoretilcsoportot nem tartalmazó keton képződését tapasztaltuk.” helyett: Ezen kísérletek során a kiindulási anyagok (81. ábra, 262a-c) az elegyből vett minta GC-MS analízise során nem voltak kimutathatók az elegyben, ezenkívül a belőlük származtatott, trifluoretilcsoportot nem tartalmazó keton-származékok képződését tapasztaltuk.

57. oldal

„Az A eljárás nem vezetett eredményre a ciklopentanon esetében. Ennek oka az 1-trimetilsziloxi-ciklopenténnek (262b) a ciklohexenil-származékhoz (262a) képest magasabb reaktivitása a feldolgozás során visszamaradó szennyezőkkel szemben.” helyett: Az A eljárás nem vezetett eredményre a ciklopentanon esetében. Ennek oka az 1-trimetilsziloxi-ciklopenténnek (262c) a ciklohexenil-származékhoz (262a) képest magasabb reaktivitása a feldolgozás során visszamaradó szennyezőkkel szemben.

„Mivel a hexafluorszilikát lúgos körülmények között bomlik, így a tetraalkil-hidroxid vizes oldatát csepegtettük a kovasav szintén vizes oldatához, és ugyanezt az eljárást követtük a hexafluortitanát sók előállításánál.” helyett: Mivel a hexafluorszilikát lúgos körülmények között bomlik, így a tetraalkil-ammónium-hidroxid vizes oldatát csepegtettük a kovasav szintén vizes oldatához, és ugyanezt az eljárást követtük a hexafluortitanát sók előállításánál.

59. oldal

„Az előkísérletek során a feltételezett termékek aránya nagy szórást mutatott, azonban 40 °C-on végezve a reakciót, a TMS-acetilén oldatát csepegtetve a benzaldehid és a katalizátor oldatához, csökkent.” helyett: Az előkísérletek során a feltételezett termékek egyes konverziói az elegyebből vett minták GC-MS analízise alapján nagy szórást mutatottak. Ezt kiküszöböltük a TMS-acetilén folyamatos, lassú adagolásával.

„Az oldószerek közül két potenciálisan megfelelő választottunk, a diklórmétánt (DCM) és a dietil-étert (Et₂O), mivel eltérő szelektivitást mutattak az adott körülmények között a mono- és a bisz-addíciós termék irányába (lsd. 1. táblázat).” helyett: Az oldószerek közül kettőt választottunk ki a további optimalizációs kísérletekhez, a diklórmétánt (DCM) és a dietil-étert (Et₂O), mivel eltérő szelektivitást mutattak az adott körülmények között a mono-, illetve a bisz-addíciós termék irányába (lsd. 1. táblázat).

60. oldal

„Ezek a kísérletek megerősítettek minket abban, hogy a megfelelő ammónium-só a tetrabutil-ammónium származék (265a), illetve a titán alapú hasonló katalizátor (266a, b) alkalmazása a szelektivitást is rontja.” helyett: Ezen kísérletek alapján megállapíthatjuk, hogy a megfelelő ammónium-só a tetrabutil-ammónium származék (265a), illetve a titán alapú hasonló katalizátor (266a, b) alkalmazása a szelektivitást rontja.

61. oldal

„Az adatokból látható, hogy a szililezett és nem-szililezett származékok megjelenése még mindig véletlenszerű volt (vö.! 3. táblázat-4. táblázat).” helyett: Az adatokból látható, hogy a szililezett és nem-szililezett származékok megjelenése még nem volt reprodukálható (vö.! 3. táblázat-4. táblázat).

„Ezért az 1 mol/dm³-es koncentrációt választottuk megfelelőnek.” helyett: Ezért az 1 mol/dm³-es koncentráció alkalmazása mellett döntöttünk.

62. oldal

„A hozzáadott vizet vizsgálva arra a következtetésre jutottunk, hogy 1% víztartalom felett a reakció nem megy végbe, illetve 1% alatt indukciós idő mérhető, aminek következtében a beadagolás lényegtelen, a felhalmozódott reagens batch-szerűen, hirtelen, és kontrollálatlan termékeloszlásban szolgáltatja a detektált termékeket.” helyett: A hozzáadott vizet vizsgálva arra a következtetésre jutottunk, hogy 1% víztartalom felett a reakció nem megy végbe, illetve 1% alatt bizonyos nagyságú indukciós idő mérhető. Ennek következtében a reakcióelegyben folyamatos beadagolás mellett a reagens felhalmozódik, majd rendkívül gyors és nem kontrollálható körülmények között lép reakcióba a kiindulási anyaggal.

64. oldal

„Kutatócsoportunkban számos jodóniumsó szintézisét és szerves szintézisekben való felhasználásához folytattunk és folytatunk jelenleg is vizsgálatokat.” helyett: - (Nem ide illő mondat.)

„Összevetve a megfelelő jodóniumsó aktiválási energiáival, mind alifás, mind aromás aminok esetén az irodalomban leírt halogén- és szulfóniumsó-származékokéval, a gát felére, akár harmadára csökken (vö.! anilin felhasználásával 14,4 kcal/mol jodóniumsó, míg 24,1 kcal/mol szulfóniumsó esetén).” helyett: Összevetve a megfelelő jodóniumsók és anilin közötti reakciók számított aktiválási energiáival, mind alifás, mind aromás aminok esetén az irodalomban leírt halogén- és szulfóniumsó-származékokéval, a gát felére, akár harmadára csökken (vö.! anilin felhasználásával 14,4 kcal/mol jodóniumsó, míg 24,1 kcal/mol szulfóniumsó esetén).

65. oldal

„A kiindulási 3,3,3-trifluor-2-jódpropénre (193a) számítva 64%-os termeléssel izoláltuk a megfelelő jodóniumsót (275a) a reakciósor végén.” helyett: A kiindulási 3,3,3-trifluor-2-

jódpropénre (193a) számítva 64%-os össztermeléssel izoláltuk a megfelelő jodóniumsót (275a).

68. oldal

„A különböző aril-trifluorpropenil-jodónium-triflát (275h-j) szintézisét követően a második lépésben a beadagolás hőmérsékletét $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ -ra csökkentettük.” helyett: A különböző aril-trifluorpropenil-jodónium-triflát (275h-j) szintézisének második lépésében a reakcióelegy hőmérsékletét $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ -ra csökkentettük, és ezt a hőmérsékletet tartva adagoltuk be a reagenseket.

69. oldal

„A trifluorpropenil-jodóniumsó (275j) méretnövelése tehát kedvező volt só termelésére.” helyett: A trifluorpropenil-jodóniumsó (275j) méretnövelése a 12,5 mmol-os méretig kedvező volt a só termelésére.

„Az oldószermentes olajos nyerstermék dietil-éteres kicsapáskor kapott só szemcsemérete befolyásolja a szűrés sebességét, és hogy szívatással a nyerstermék szennyezői mennyire távolíthatóak el.” helyett: Az oldószermentes, olajszerű nyerstermék dietil-éteres kicsapáskor kapott só szemcsemérete befolyásolja a szűrés sebességét, és a szilárd termék szennyezőinek éteres mosással való eltávolíthatóságát is.

„Az optimális reakciókörülmény meghatározásához három fő paraméter optimalizálását valósítottuk meg.” helyett: Az optimalizálási kísérletek során három paraméter hatását vizsgáltuk.

71. oldal

„Az a reakció során keletkező trifluormetánszulfonsav miatt szükség van bázis alkalmazására.” helyett: A reakció során képződő H^+ -kation miatt szükség van bázis alkalmazására.

72. oldal

„A szerves bázisok közül a szervesetlen bázisokhoz hasonló konverziót a szűfolt 2,6-di-terc-butil-piridin és származékának alkalmazása esetén tapasztaltunk.” helyett: A szerves bázisok közül a szervesetlen bázisokhoz hasonló konverziót a zsúfolt 2,6-di-terc-butil-piridin és származékának alkalmazása esetén tapasztaltunk.

74. oldal

„A további példák alapján is, az elektronszívó csoportok az orto- és para- helyzetben (277t, y, z, ac, ad, ag) egyértelműen rontják, legtöbbször teljesen ellehetetlenítik az átalakítást.” helyett: A további kísérletek is azt mutatták, hogy az elektronszívó csoportok az orto- és para- helyzetben (277t, y, z, ac, ad, ag) a konverzió és a termelés csökkenését okozzák.

75. oldal

„A sok pozitív, anilineken történő reakciót követően az eljárásunkat kiterjesztettük a nagyobb kihívást jelentő diaminokra és heterociklusos aminokra is.” helyett: Az anilineken történő sikeres átalakításokat követően az eljárásunkat kiterjesztettük a nagyobb kihívást jelentő diaminokra és heterociklusos aminokra is.

„A szeparált gyűrűn elhelyezkedő aminocsoportok a korábbiakhoz hasonló hatékonysággal alakíthatók át aziridinné (277ai) 2,4 ekvivalens jodóniumsó felhasználásával.” helyett: Bifenilén-diamin esetén, ahol az aminocsoportok eltérő gyűrűn helyezkednek el, mindkét aminocsoport a korábbiakhoz hasonló hatékonysággal alakítható át a megfelelő aziridin-származékká (266ai) 2,4 ekvivalens jodóniumsó felhasználásával.

79. oldal

„Ezért gyökös reakciómechanizmussal nem is foglalkoztunk tovább.” helyett: A gyökös mechanizmus további vizsgálatát ezen eredmények tükrében nem folytattuk sem kísérleti úton, sem kvantumkémiai számítások során.

84. oldal

„Ehhez az irodalomban ilyen célra még nem alkalmazott olcsó és nem toxikus hexafluorokovasavat használtam fel.” helyett: Ehhez az irodalomban ilyen célra még nem alkalmazott olcsó és kevésbé toxikus hexafluorkovasavat használtam fel.

„. Ezenkívül benzofuránok (41-78% termelés) képződésével járó [...]” helyett: Ezenkívül benzofuránok (41-78% termelés) képződésével járó [...]

„[...] cikloaddíciós reakcióját végeztem el, 42-83%-os hatékonysággal.” helyett: [...] cikloaddíciós reakcióját végeztem el, 42-83%-os hatékonysággal.

„Az így kapott jodóniumsót sikerrel használtam primer aminok egy lépésben történő átalakítására, illetve a reakciókörülményeket jól átgondoltan optimáltam.” helyett: Az így

kapott jodóniumsót sikerrel használtam primer aminok egy lépésben történő átalakítására, illetve a reakciókörülményeket optimáltam.

85. oldal

„During the first part of my doctoral work, we studied the sequential Sonogashira coupling, using TMS-acetylene as a C₂-source.” helyett: During the first part of my Ph.D. work, we studied the sequential Sonogashira coupling, using TMS-acetylene as a C₂-source.

„Because of the high standard deviation of conversion data and the problem with purity of synthesized adducts, the results method requires further development.” helyett: Because of the high standard deviation of conversion data and the problem with purity of synthesized adducts, the resulted method requires further development.

93. oldal

„Az általános eljárást követve, 3-jódtiofénből [...]” helyett: Az általános eljárást követve, 2-jódtiofénből [...]