



Enno Töpken (Autor)

**Festphasensynthese von Pyrrolidinen und
Piperidinen durch Multikomponenten-
Dominoreaktionen für die kombinatorische Chemie**

Enno Töpken

**Festphasensynthese
von Pyrrolidinen und Piperidinen
durch Multikomponenten-Dominoreaktionen
für die kombinatorische Chemie**



Cuvillier Verlag Göttingen

<https://cuvillier.de/de/shop/publications/3546>

Copyright:

Cuvillier Verlag, Inhaberin Annette Jentsch-Cuvillier, Nonnenstieg 8, 37075 Göttingen,
Germany

Telefon: +49 (0)551 54724-0, E-Mail: info@cuvillier.de, Website: <https://cuvillier.de>

Inhaltsverzeichnis

Allgemeiner Teil

| | | |
|----------|---|-----------|
| 1 | Einleitung..... | 1 |
| 2 | Kombinatorische Chemie..... | 3 |
| 2.1 | Konzept der kombinatorischen Chemie | 3 |
| 2.2 | Diversität..... | 4 |
| 2.3 | Festphasensynthese..... | 4 |
| 2.4 | Harze und Linker | 6 |
| 2.5 | Analytik polymergebundener Substanzen | 10 |
| 2.6 | Bibliotheken aus Einzelsubstanzen und Substanzmischungen..... | 11 |
| 2.7 | Beispiele für Festphasensynthesen | 14 |
| 3 | Multikomponentenreaktionen | 19 |
| 3.1 | Beispiele für Multikomponentenreaktionen | 19 |
| 3.2 | Multikomponentenreaktionen für die kombinatorische Chemie | 23 |
| 4 | Aufgabenstellung | 27 |

Ergebnisse und Diskussion

| | | |
|----------|--|-----------|
| 5 | Reaktionen mit polymergebundenen Tetrahydrocarbolinderivaten..... | 29 |
| 5.1 | Planung der Reaktion am polymeren Träger | 29 |
| 5.2 | Synthese des Merrifield-Cbz-Harzes..... | 31 |
| 5.3 | Synthese des polymergebundenen Tetrahydrocarbolinaldehyds..... | 32 |
| 5.4 | Dominoreaktion am Harz und Hydrogenolyse..... | 35 |
| 5.5 | Andere Hydrogenolysemethoden | 36 |
| 5.6 | Saure Abspaltung..... | 37 |
| 5.7 | Synthesesequenz mit Wang-Cbz-Harz | 39 |
| 5.8 | Zusammenfassung | 42 |
| 6 | Festphasensynthese von Pyrrolidinen..... | 43 |
| 6.1 | Anbindung an das Harz und Dominoreaktion | 43 |
| 6.2 | Abspaltung und Hydrierung | 44 |
| 6.3 | Darstellung anderer Benzylenoether | 46 |
| 6.4 | Variation des Benzylenoethers | 47 |
| 6.5 | Cyclische Enoether | 49 |
| 6.6 | Einsatz von Silylenoethern | 49 |
| 6.7 | Variation der 1,3-Dicarbonylverbindung | 50 |

| | | |
|-----------|---|-----------|
| 7 | Festphasensynthese von Piperidinen | 52 |
| 7.1 | Synthese des polymergebundenen Aldehyds | 52 |
| 7.2 | Dominosequenz..... | 52 |
| 8 | Festphasensynthese größerer Ringe | 55 |
| 8.1 | Synthese der polymergebundenen Aldehyde | 55 |
| 8.2 | Dominosequenz..... | 55 |
| 9 | Untersuchungen zur Stereochemie | 57 |
| 9.1 | Synthese der Verbindungen | 57 |
| 9.2 | Trennversuche | 59 |
| 9.3 | Synthese strukturell vereinfachter Verbindungen..... | 59 |
| 9.4 | Trennversuche | 60 |
| 10 | N-Alkylierung | 61 |
| 10.1 | Alkylierungsversuche an der Festphase | 61 |
| 10.2 | Reduktive Alkylierung des Heterocyclus | 62 |
| 11 | Derivatisierung von Diels-Alder-Produkten mit Aminen | 64 |
| 11.1 | Untersuchungen zur Lactonöffnung mit Aminen | 64 |
| 11.2 | Umsetzung des primären Diels-Alder-Produkts mit Aminen..... | 66 |
| 12 | Zusammenfassung | 67 |

Experimenteller Teil

| | | |
|-----------|---|------------|
| 13 | Allgemeine Methoden | 77 |
| 13.1 | Allgemeine Bemerkungen zu Reaktionen am polymeren Träger..... | 77 |
| 13.2 | Charakterisierung der Verbindungen | 77 |
| 13.3 | Chromatographische Methoden | 78 |
| 14 | Allgemeine Arbeitsvorschriften | 80 |
| 15 | Reaktionen von polymergebundenen Tetrahydrocarbolinderivaten | 82 |
| 16 | Festphasensynthese von Pyrrolidinen | 92 |
| 17 | Festphasensynthese von Piperidinen | 107 |
| 18 | Festphasensynthese größerer Ringe | 114 |
| 19 | Untersuchungen zur Stereochemie | 119 |
| 20 | N-Alkylierung | 125 |
| 21 | Derivatisierung von Diels-Alder-Produkten mit Aminen | 130 |

Anhang

| | | |
|-----------|--|------------|
| 22 | Abkürzungsverzeichnis | 131 |
| 23 | Literaturverzeichnis und Anmerkungen..... | 133 |