

TALLINNA TEHNIKAÜLIKOOL

Matemaatika-loodusteaduskond

Keemiainstituut

**TSÜKLOPROPÜÜLATSEETALDEHÜÜDI DERIVAADI
ENANTIOSELEKTIIVNE KONJUGEERITUD LIITUMINE
NITROALKEENIDELE JA SELLE RAKENDUSED AMINOHAPETE**

SÜNTEESIS

Magistritöö

Mikk Kaasik

Juhendaja: Tõnis Kanger, orgaanilise keemia õppetool

Professor

Kaasjuhendaja: Artur Noole, orgaanilise keemia õppetool

teadur

Rakenduskeemia ja biotehnoloogia

Tallinn 2015

LÜHIKOKKUVÕTE

Tsüklopropani fragment leidub mitmetes looduslikes ja sünteetilistes bioaktiivsetes ühendites, sealhulgas mitteproteino-geneses aminohapetes. Välja töötatud organokatalüütilise konjugeeritud liitumisreaktsiooniga on võimalik sünteesida enantiomeerselt rikastatud tsüklopropani sisaldavaid aldehüüde/alkohole. Reaktsiooni iseloomustab keskpärane kuni väga hea enantio- ja diastereoselektiivsus (93-99% *ee*; dr 69/31-95/05) ning saagis (47-86%), lisaks omapärane *anti*-selektiivsus. Konjugeeritud liitumisreaktsiooni produktist sünteesiti γ -aminohape ja kaitstud β -aminohape. Konjugeeritud liitumisreaktsiooni produktist sünteesiti pürrolidiini derivaat, millega modifitseeriti kinolooni derivaati.

ABSTRACT

The cyclopropane ring can be found in many natural and synthetic biologically active compounds, including proteinogenic amino acids. A new organocatalytic asymmetric Michael reaction has been developed with unusual *anti*-selectivity for the synthesis of cyclopropane containing aldehydes/alcohols. All the products were isolated in moderate to good yields (47-86%) with moderate to excellent enantio- and diastereoselectivities (93-99% *ee*; dr 69/31-95/05). γ -Amino acid and a protected β -amino acid were synthesised from the Michael product. The Michael product was also used for the synthesis of a pyrrolidine derivative that was further used to modify a quinolone derivative.