

Abstrakt

Enantiomerně obohacené allylové aminy jsou důležité meziprodukty při syntéze biologicky aktivních látek.

Tato diplomová práce se zabývá přípravou těchto aminů prostřednictvím organokatalytické allylové substituční reakce karbamátů odvozených od Moritových-Baylisových-Hillmanových (MBH) alkoholů. V rámci této práce byla nalezena enantioselektivní dekarboxylační reakce MBH karbamátů katalyzovaná komerčně dostupnými dimerickými chinolinovými katalyzátory. Tato reakce poskytuje požadované produkty v izolovaném výtěžku až 98 % a enantiomerním přebytku až 97 %.

Připravené enantiomerně obohacené allylové aminy byly dále transformovány na opticky čisté α -metylen- β -laktamy. Tato transformace založená hydrolýze a následné laktamizací poskytuje β -laktamy s výtěžky až 86 % se zachováním enantiomerního přebytku.

Pomocí této metody byl připraven klíčový enantiomerně obohacený intermediát pro syntézu Ezetimibu.

Na základě provedeného křížového NMR experimentu a výpočtů byl navržen reakční mechanismus této transformace.