Zusammenfassung im Sinne der Promotionsordnung der Universität zu Köln

Kurzzusammenfassung

Die vorliegende Arbeit beschreibt die Entwicklung eines neuartigen enzymatischen Prozesses zur Darstellung von enantiomerenreinen und synthetisch wertvollen β^2 -Aminosäureestern. Unter Verwendung der robusten und kommerziell erhältlichen Lipase CAL-B gelang die alkoholytische kinetische Racematspaltung (KR) von aromatischen substituierten Oxazinonen, wobei die gebildeten N-acylierten β^2 -Aminosäureester mit sehr guten Enantioselektivitäten von 92 bis 96 % erhalten werden konnten. Zusätzlich dazu konnten unter Zusatz von Triethylamin die Oxazinone im Sinne einer dynamisch kinetischen Racematspaltung (DKR) in die korrespondierenden Allylester mit vollständigen Umsätzen, sehr guten Enantioselektivitäten von bis zu 96 % und isolierten Ausbeuten von 85 % überführt werden.

Im zweiten Teil der Arbeit konnten am Beispiel der 2-Phenylacetyl geschützten Phenylpropansäure und des Cbz-geschützten Valins die korrespondierenden Oxazinone bzw. Azlactone dargestellt und mit zufrieden stellenden Ergebnissen racematgespalten werden. Die Ringöffnung der Oxazinone verlief dabei im Sinne einer DKR, die der Azlactone im Sinne einer KR.

Abstract

In this work, a new enzymatic process for the synthesis of enantiomerically pure and synthetically more useful β^2 -amino acid esters is described. Using the very robust and commercially available lipase CAL-B alcoholytic kinetic resolution (KR) of oxazinones with aromatic substituent was effected, leading to *N*-acylated β^2 -amino acid esters with excellent enantioselectivities up to 96 %. In the presence of triethylamine the oxazinones underwent dynamic kinetic resolution (DKR) with full conversion and were converted to the corresponding allylesters with very good enantioselectivities up to 96 % and isolated yields of 85 %.

In the second part of this work, using 2-phenylacetyl protected phenylpropanoic acid and Cbz protected valine the corresponding oxazinone and azlactone could successfully be synthesised and resolved with satisfactory results. The ring opening of the oxazinone proceeded as DKR, in the case of azlactones KR was possible.