

Kurzzusammenfassung

Die vorliegende Arbeit beschreibt die Entwicklung organokatalytischer Verfahren zur Synthese gesättigter Säuren bzw. Ester ausgehend von Enalen durch eine intramolekulare Redox-hydratisierung bzw. -veresterung. Die Säuren konnten NHC- und die Ester Diethylphosphit- katalysiert mit Ausbeuten bis zu 99 % erhalten werden. Des Weiteren war es erstmalig möglich, acht 3-monosubstituierte β -Lactame durch eine *Staudinger*-Cycloaddition mit Ausbeuten von bis zu 94 % darzustellen. Das *N*-ungeschützte 3-Phenylazetidin-2-on konnte mit CAL-B und H₂O als Nukleophil, die 3-Alkyl-, 3-Phthalimido- und 3-Phenyl-*N*-Cbz-Lactame im Sinner einer alkoholischen KR umgesetzt werden. Die korrespondierende β^2 -Aminosäure bzw. ihr Ester und die verbliebenen β -Lactame wurden mit bis zu 50 % Ausbeute und >99 % ee isoliert. Für das 3-Phenyl-Derivat war es zudem möglich durch eine DKR, unter Zusatz von 0.05 eq. DBU, den Aminosäureester mit einer Ausbeute von 98 % und 99 % ee zu erhalten. Durch die organokatalytische enantioselektive Protonierung eines Silylenolethers durch ein Binaphtylbis(sulfuryl)imid konnte erstmals ein 3-Phenyl- β -Lactam mit 95 % Ausbeute und 63 % ee synthetisiert werden. Des Weiteren wurde durch die Entwicklung eines neuen bifunktionellen Organokatalysators die katalytische Aktivität in der DKR von 3-*tert*-Butylazlacton um das 6-fache, im Vergleich zum Benchmark-System, gesteigert.

Abstract

In this work, new protocols for the organocatalytic synthesis of saturated acids and esters *via* the intramolecular redoxhydration and -esterification was developed. Starting from enals, the corresponding acids catalysed by NHCs as well as the corresponding esters catalysed by diethylphosphite could be obtained with yields up to 99 %. In addition, the first synthesis of eight 3-monosubstituted β -lactams *via* *Staudinger*-cycloaddition with yields up to 94 % were presented. The *N*-unprotected 3-phenyl- β -lactam with H₂O as nucleophile and CAL-B as the catalyst could be hydrolysed in a KR. The β^2 -aminoacid and the remaining β -lactam were isolated with yields up to 50 % and 99 % ee. For the *N*-Cbz protected 3-alkyl-, 3-phthalimido- and 3-phenyl-substituted β -lactams the KR was possible with allyl alcohol as the nucleophile and CAL-B as the catalyst. Both, the remainig β -lactam and the β^2 -aminoacid ester were isolated with yields up to 50 % and >99 % ee. For the 3-phenyl-derivative, the DKR was possible with the addition of 0.05 eq. of DBU. The

aminoacid ester was isolated with 98 % yield and 99 % ee. The organocatalytic enantioselective protonation of a silyl enoether with binaphthylbis-(sulfuryl)imide yielded the 3-phenyl- β -lactam with an enantiomeric excess of 63 % for the first time and could be isolated with 95 %. Moreover, the development of a new bifunctional organocatalyst resulted in the increase to the 6-fold of catalytic activity in the DKR of *tert*-butylazlactone compared to the benchmark-system.