

Abstract - Kurzzusammenfassung

Abstract

In this work, new methods for the enantioselective synthesis of β^2 -amino acids are described. The alcoholic kinetic resolution (KR) of oxazinones in the presence of immobilized *Candida antarctica* lipase B (CAL-B) yielded corresponding *N*-benzoyl β^2 -amino acid allyl esters in up to 93 % *ee* and the remaining oxazinones in up to 99 % *ee*. Upon addition of triethylamine, dynamic kinetic resolution was attained with full conversion and corresponding allyl esters were obtained in up to 80 % *ee*. The alcoholic kinetic resolution of β -lactams in the presence of the lipase CAL-B provided both *N*-Cbz β^2 -amino acid esters and remaining β -lactams in excellent enantioselectivities (up to 99 % *ee*). The dynamic kinetic resolution of aryl-substituted β -lactams, attained by the addition of catalytic amount of DBN, yielded corresponding *N*-Cbz β^2 -amino acid allyl esters in high enantioselectivities (up to 99 % *ee*).

In addition, kinetics of the dynamic kinetic resolution of the azlactone was investigated by nuclear magnetic spectroscopy. The bifunctional thiourea catalyzed alcoholic ring opening of azlactone was found to exhibit first order kinetics for both azlactone and allyl alcohol.

Kurzzusammenfassung

Im Rahmen dieser Doktorarbeit wurden neue Methoden zur enantioselektiven Synthese von β^2 -Aminosäuren entwickelt und die Kinetik der dynamisch kinetischen Racematspaltung (DKR) von Azlaktonen zu α -Aminosäureestern bestimmt.

Die alkoholische kinetische Racematspaltung von Oxazinonen in Gegenwart von immobilisierter *Candida Antarctica* Lipase B (CAL-B) ermöglichte die Darstellung der korrespondierenden *N*-Benzoyl β^2 -Aminosäureallylester mit bis zu 93 % *ee* und des verbliebenen Oxazinon mit Enantioselektivitäten von bis zu 99 %. Durch die Zugabe von Triethylamin wurde eine DKR mit vollständigem Umsatz zu Allylester und Enantiomerenüberschüssen von bis zu 80 % ermöglicht.

Die alkoholytische kinetische Racematspaltung von β -Lactamen in Gegenwart von CAL-B führte sowohl für die *N*-Cbz β^2 -Aminosäureestern, als auch für die verbleibenden β -Lactame zu exzellenten Enantioselektivitäten von bis zu 99 %. Durch die Verwendung katalytischer Mengen DBN war es möglich die arylsubstituierten β -Lactame, im Sinne einer DKR, zu den jeweiligen *N*-Cbz β^2 -Aminosäureallylester umzusetzen. Es wurden exzellente Enantiomerenüberschüssen von bis zu 99 % erreicht.

Darüber hinaus wurde die Kinetik der dynamischen kinetischen Racematspaltung der Azlactone durch kernmagnetische Spektroskopie untersucht. Der bifunktionelle Thioharnstoff katalysierte die alkoholytische Ringöffnung der Azlactone mit Kinetik erster Ordnung sowohl für die Azlactone als auch für den Allylalkohl.