

Inhaltsverzeichnis

1.	Kurzzusammenfassung	1
2.	Einleitung	3
2.1	<i>N</i> -Heterocyclen als Strukturmotiv in biologisch aktiven Verbindungen	3
2.2	Organokatalytische asymmetrische DIELS-ALDER-Reaktion und Synthese neuartiger Bisindol-Derivate	7
2.2.1	Die POVAROV-Reaktion	10
2.3	Pyrazol – wichtiges Strukturmotiv in der Wirkstoffentwicklung	11
2.4	Cyclische Peptide – Bedeutung, Aufbau und chemische Synthese	18
2.4.1	Apicidin – Entdeckung, Struktur und biologische Aktivität	20
2.4.2	Totalsynthese von Apicidin	26
2.4.3	Chemische Synthese von Apicidin-Derivaten	29
2.5	Thioamide – Modifikation eines Peptidrückgrats	31
3.	Ziel der Arbeit	35
4.	Hauptteil	37
4.1	Asymmetrische organokatalytische Synthese neuartiger Bisindol-Derivate	37
4.1.1	Derivatisierungsexperimente	47
4.2	Azacyclooctine – Spannungsgesteuerte Synthese neuartiger Pyrazol-Derivate	54
4.3	Thioamid-funktionalisierte Apicidin-Derivate	58
4.3.1	Chemische Synthese	58
4.3.2	Biologische Untersuchungen der synthetisierten Moleküle	68
5.	Zusammenfassung und Ausblick	71
5.1	Zusammenfassung	71
5.1.1	Asymmetrische organokatalytische Synthese von Bisindol-Derivaten	71
5.1.2	Azacyclooctine – Synthese neuartiger Pyrazol-Derivate	73

5.1.3	Synthese Thioamid-funktionalisierter Apicidin-Derivate	74
5.2	Ausblick	76
6.	Experimenteller Teil	79
6.1	Analytik und Geräte	79
6.1.1	Kernresonanzspektroskopie (NMR)	79
6.1.2	Massenspektrometrie (MS)	80
6.1.3	Infrarotspektroskopie (IR)	80
6.1.4	Dünnschichtchromatographie (DC)	81
6.1.5	Säulenchromatographie	81
6.1.6	Combiflash	81
6.1.7	Analysenwaage	81
6.1.8	Drehwerte	81
6.1.9	Schmelzpunkte	82
6.1.10	Sonstige Geräte	82
6.2	Lösungsmittel und Chemikalien	82
6.3	Arbeitsweise	83
6.3.1	Festphasensynthese	84
6.4	Allgemeine Arbeitsvorschriften (AAV)	84
6.5	Synthesevorschriften und analytische Daten	86
6.5.1	Asymmetrische organokatalytische Synthese von Heterocyclen	86
6.5.2	Synthese von Pyrazol-Derivaten	150
6.5.3	Apicidin-Derivate	155
7.	Abkürzungsverzeichnis	191
8.	Literaturverzeichnis	199
9.	Anhang	207
9.1	Lebenslauf	207

9.2	Publikationen und Konferenzbeiträge	209
9.3	Danksagung	210