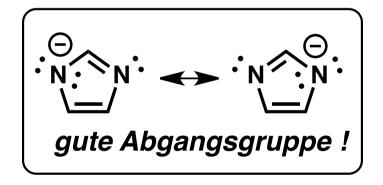
- Die folgenden Folien enthalten keinen neuen Stoff im Vergleich zur alten Version.
- Sie sind aber weniger konzentriert (Stoff ist auf eine grössere Anzahl Folien verteilt) und deshalb übersichtlicher.
- Farbe wurde sparsamer eingesetzt.

Phosgen und praktische Ersatzstoffe

Gute, relativ schwach basische Abgangsgruppen bei all diesen Molekülen! Carbonsäureimidazolide sind reaktive Carbonsäurederivate (hohes Acylgruppenübertragungspotential).

Carbonsäureimidazolide

Einsatz von Carbonsäure-imidazoliden:

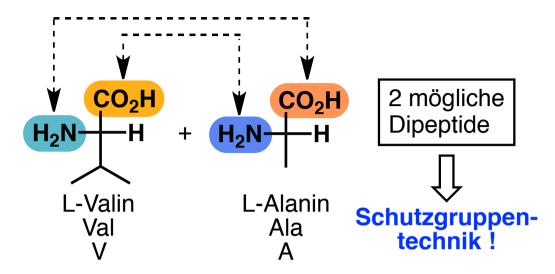


$$pK_a(Im^{NH}/Im^{N-}) \approx 14.4$$

Beispiele für die Verwendung von Carbonyldiimidazol (CDI)

Kohlensäurederivate als Schutzgruppen

Anwendung bei Peptidsynthese



Schutzgruppen für -NH₂

Reagenzien zur Einführung einer BOC-Gruppe

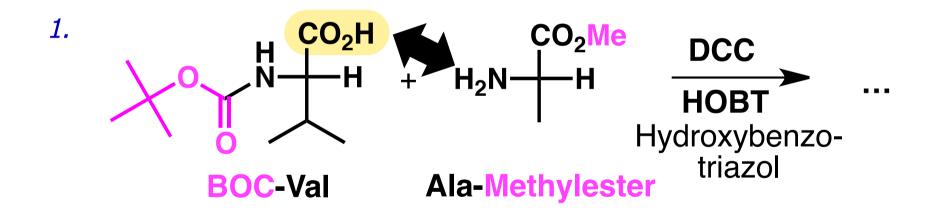
Kohlensäurederivate als Schutzgruppen

Entfernen einer BOC-Gruppe:

Schützen & Aktivieren bei der Peptidsynthese

Prinzip:

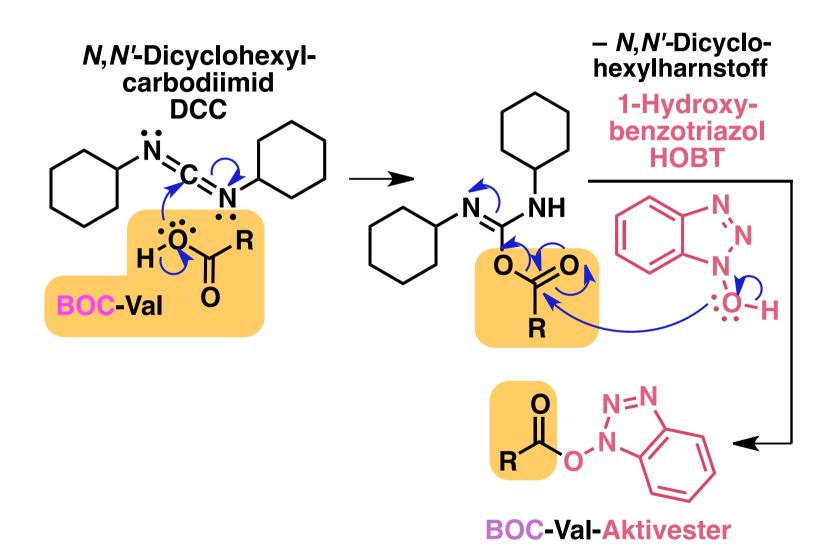
- 1. AS1 N-geschützt, AS2 Carboxy-geschützt
- 2. Aktivierung
- 3. Verknüpfung (Amidbildung)



Ziel: Verknüpfung via Aktivierung der freien Carboxygruppe

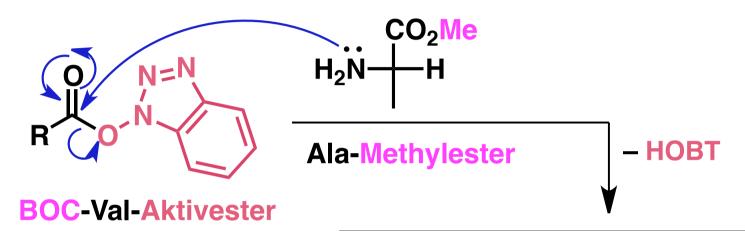
Schützen & Aktivieren bei der Peptidsynthese

2. Aktivierung der Carboxy-Funktion der N-geschützten AS1 (Val):



Schützen & Aktivieren bei der Peptidsynthese

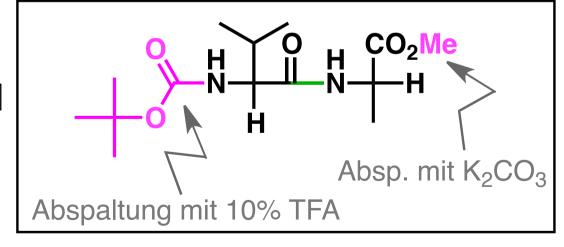
3. Knüpfen der Peptidbindung zwischen N-geschützter + Carboxy-aktivierter AS1 (Val) und Carboxy-geschützter AS2 (Ala):



Beide Termini können unabhängig voneinander entschützt werden



gezielte Verknüpfung mit weiteren AS



BOC-Val-Ala-Methylester (N- und Carboxy-geschütztes Dipeptid)

C. Thilgen, OC II, 2.5.16