

Zusammenfassung

Die Synthese von biologisch aktiven Proanthocyanidinen wurde für ein besseres Verständnis der Grundlagen der Struktur-Bioaktivität Beziehung durchgeführt. Im Hinblick auf die Entwicklung neuer Wirkstoffe für eine wirksamere Behandlung von Krankheiten beim Menschen, wurde die Synthese der oligomeren Flavonoide untersucht. Diese Untersuchungen könnten neue Möglichkeiten für andere Anwendungen, wie zum Beispiel die gezielte Entwicklung von Arzneimitteln eröffnen.

Kapitel 1 beschreibt die Synthese der bioaktiven Proanthocynidin-Oligomeren. Die Synthese des Catechin Dimers und Trimers ausgehend von racemischen Catechin wurde untersucht, erwies sich aber als erfolglos. Die Synthese des bekannten Catechin Dimers und Trimers wurde dann ausgehend von reinem (+)-Catechin durchgeführt. Diese oligomeren Flavonoide werden uns helfen, ihre Rolle auf molekularer Ebene in Biomolekülen zu untersuchen. Sie können als Referenzverbindungen in HPLC-Analysen von verschiedenen Lebensmitteln verwendet werden. Die Totalsynthese des benzylierten (-)-Gallocatechins wurde auf verschiedene Arten durchgeführt. Zudem sollten verschiedene Oligomere des Prodelphinidins wie beispielsweise Prodelphinidin B₃ und T₂ durch den Einsatz von benzyliertem (-)-Gallocatechin synthetisiert werden.

Kapitel 2 gibt einen Überblick über die Untersuchung der enantioselektiven Epoxidierung von Chalkonen durch den Einsatz verschiedener Katalysatoren. Drei Arten von Katalysatoren wurden zu Epoxidierung verwendet. **i.** Katalysatoren basierend auf (+)-Cinchoninen. **ii.** Katalysatoren basierend auf D-Fructose. **iii.** Katalysatoren aus polyamino Säuren. Das Ziel dieser Arbeit war die Verbesserung der Totalsynthese von (+)-Myristinin A. (+)-Myristinin A ist ein natürlicher DNA-Polymerase β Inhibitor und eine stark DNA-schädigende Substanz. Im Falle der nicht-substituierten Chalkone wurde mit einer maximalen Enantioselektivität von 93% bei einer mehr als 80% Ausbeute erzielt. Die Untersuchung der substituierten Chalkone lieferte keine zufriedenstellenden Ergebnisse. Einige neue Katalysatoren basierend auf (+)-Cinchonin wurden hergestellt, diese zeigten eine respektable Enantioselektivität mit einfachen Chalkonen bei niedrigen Temperaturen. Allerdings wurde bei der Reaktion mit substituierten Chalkonen keine Enantioselektivität beobachtet.

Kapitel 3 beschäftigt sich mit der asymmetrischen Reduzierung von Chalkonen zu allylischen Alkoholen. Die Reaktionen wurden mit NaBH_4 unter CBS-Katalyse durchgeführt. Die gebildeten Alkohole wurden dann einer Cyclisierung zum Flaven-Rest unterworfen. Das wichtigste Ziel dieser Untersuchung war es, einen alternativen und kurzen Weg für die Totalsynthese des (+)-Myristinin A zu finden.