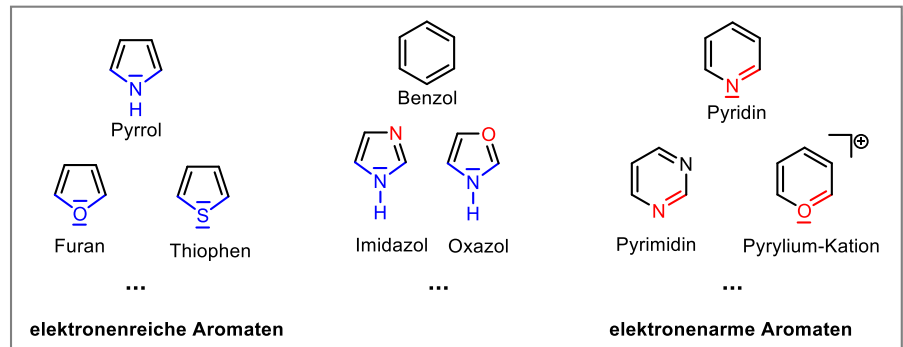


## AUS DEM INHALT DER VORLESUNG

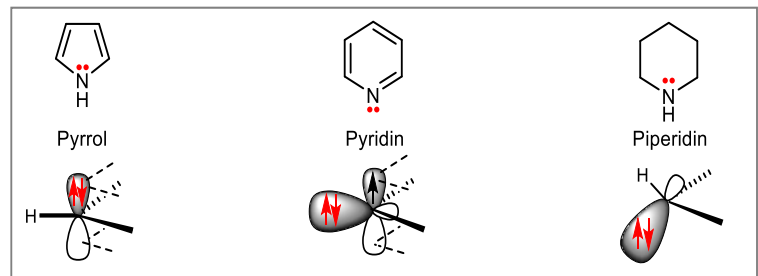
**Motivation:** Heterocyclische Verbindungen sind in der Natur weit verbreitet (Alkaloide, Kohlenhydrate, ...) und sind von entscheidender Bedeutung für viele biologische Prozesse (RNA, DNA, Chlorophyll, Häm, Vitamine, Coenzyme, ...). Zahlreiche industrielle Anwendungsbereiche beruhen auf die Verwendung heterocyclischer Verbindungen (Arzneimittel, Pflanzenschutzmittel, Farbstoffe, ...). Besonders bei der Entwicklung neuer Medikamente spielen Leitstrukturen mit heterocyclischen Strukturmerkmalen eine wichtige Rolle. In der Organischen Synthesechemie beinhalten viele Reagenzien und Katalysatoren heterocyclische Strukturmerkmale.

### Aromatischen Heterocyclen

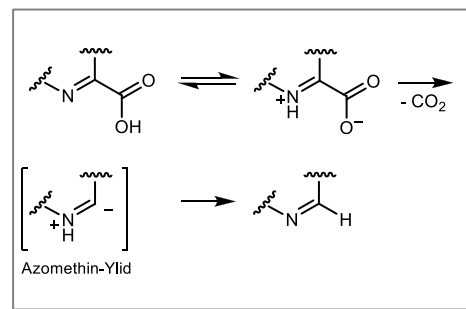
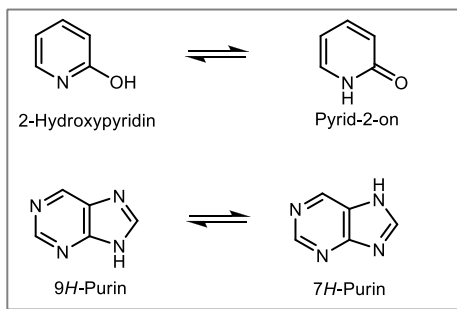
lassen sich z.B. in **elektronenreiche** und **elektronenarme** Verbindungen einteilen und zeigen entsprechende Reaktivitäten gegenüber Elektrophilen und Nucleophilen:



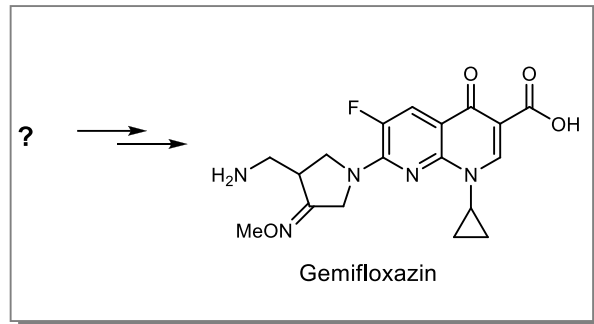
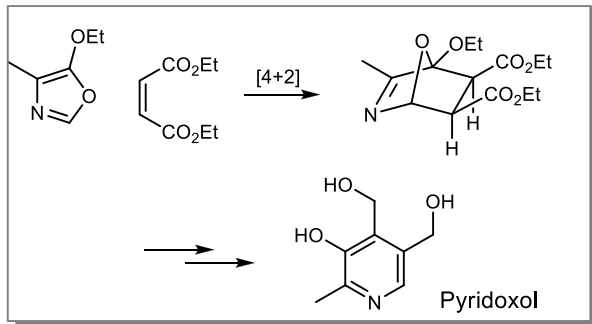
Insbesondere **N-Heterocyclen** zeigen ein interessantes **Säure-Base-Profil** das z.B. beim Vergleich der Verbindungen Pyrrrol, Pyridin und Pyrrolidin diskutiert wird:



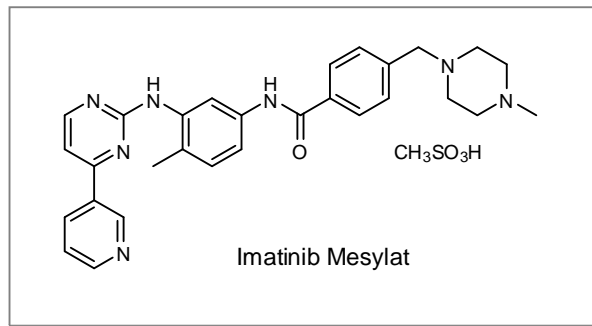
N-Heterocyclen können als **Tautomere** auftreten und zeigen zum Teil eine besondere **Seitenkettenreaktivität** (z.B. bei Decarboxylierungen):



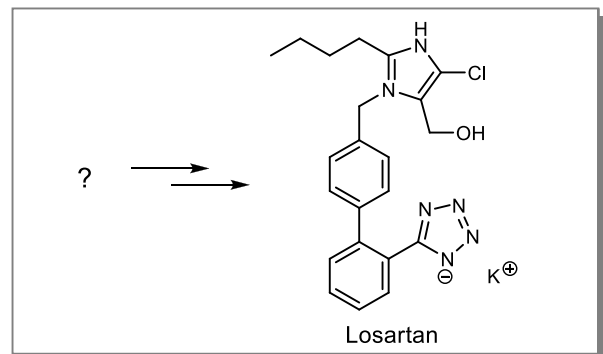
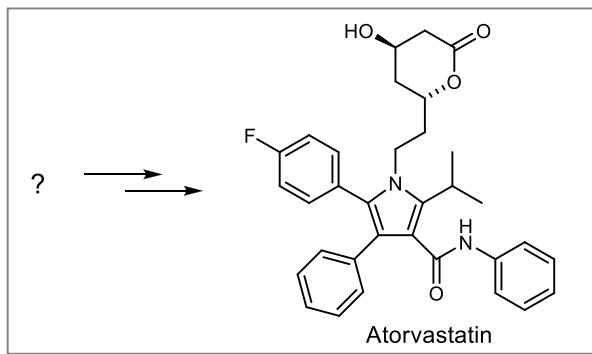
Die **Synthesen und Eigenschaften von sechsgliedrigen Heterocyclen (Pyridine, Pyridone, Chinoline, Isochinoline, Pyrimidine, ...)** wird zum Beispiel anhand der Synthesen des Nahrungszusatzes Pyridoxol (Vitamin B<sub>6</sub>) oder des Chinolon-Antibiotikums Gemifloxacin vertieft:



... auch das Leukämie-Präparat Imatinib (Glivec®) enthält mehrere sechsgliedrige Heterocyclen:

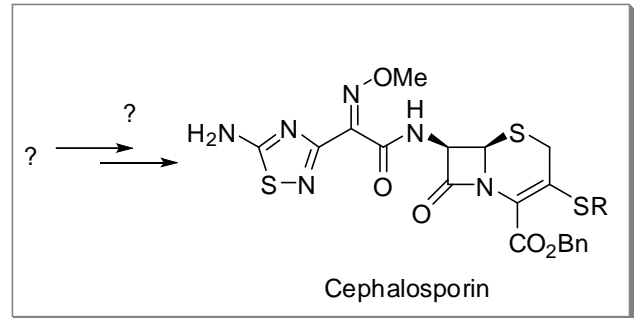
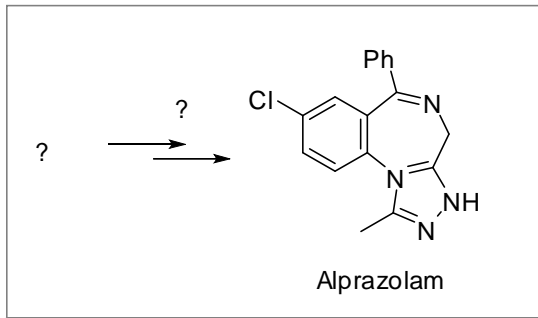


Die **Synthesen und Eigenschaften von fünfgliedrigen Heterocyclen (Pyrrole, Indole, Furane, Thiophene, Azole, Oxazole, Thiazole, ...)** soll u.a. anhand der Synthese des Topsellers Atorvastatin (Lipitor®) oder der Synthese des Blutdrucksenkers Losartan (Cozaar®) näher erläutert werden:

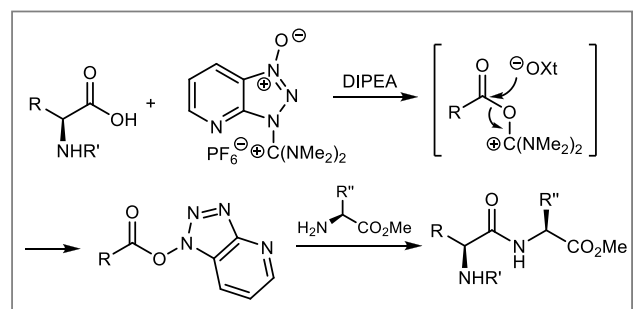
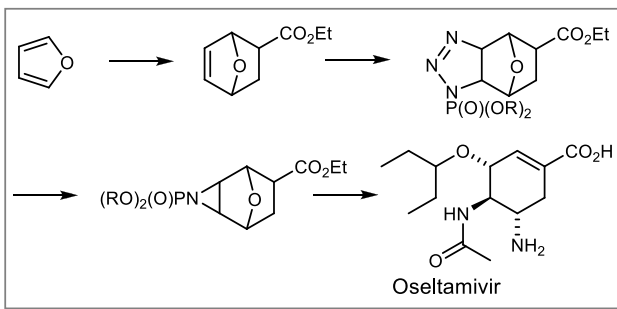


Etliche weitere Wirkstoffe mit heterocyclische Strukturmerkmalen werden während der Vorlesung vorgestellt und deren Synthesen diskutiert.

**Komplexere heterocyclische Systeme in Wirkstoffen und Naturstoffen** werden z.B. bei der Synthese von Alprazolam (ein Vertreter der Benzodiazepam-Sedativa) oder der Synthese von  $\beta$ -Lactamantibiotika diskutiert:



**Komplexere Heterocyklen** dienen oft auch als **Synthesebausteine** bzw. **Intermediate** wie sie z.B. im Zuge der Synthese des Neuramidase-Inhibitors Oseltamivir (Tamiflu®) auftreten, welches 2004/2005 große Bekanntheit wegen der auch für den Menschen tödlichen Vogelgrippe erlangte. Im Bereich der biologischen Chemie sind speziell entworfene **Katalysatoren** und **Reagenzien** z.B. bei Peptidkopplungen von großer Bedeutung.



... oder kommen im Zuge von **Naturstoffsynthesen** wie z.B. der Boger'schen Totalsynthese von Vindolin zum Einsatz:

