

INHALTSVERZEICHNIS

1. Kurzzusammenfassung	1
2. Einleitung	3
2.1 Suche nach neuen Wirkstoffen	3
2.2 Kombinatorische- und Festphasenchemie in der Wirkstoffforschung	4
2.1 Oxazolone als Ausgangspunkt für weitere Verbindungen	5
2.1.1. Struktur und Vorkommen.....	5
2.1.2. Darstellungsmethoden.....	6
2.1.3. Oxazolone als Zwischenstufe für Heterocyclen und Naturstoffe.....	7
2.2 Biologisches Profil von Chinoxalinonen und Chinoxalinen	9
2.2.1. Darstellungsmethoden von Chinoxalinonen	12
2.3 Vorkommen und biologische Aktivität von Benzothiazolen.....	13
2.3.1. Darstellungsmethoden von Benzothiazolen.....	17
3. Ziel der Arbeit.....	21
4. Hauptteil.....	23
4.1 Darstellung von <i>pseudo</i> -Oxazolonen aus Aminosäuren.....	23
4.2 Linker-Synthese und Immobilisierung von <i>pseudo</i> -Oxazolonen	27
4.2.1. Modifizierung festphasengebundener <i>pseudo</i> -Oxazolone	31
4.3 Abspaltungen mit bi-funktionalen Nukleophilen	35
4.3.1. Abspaltungen mit Diaminen zu Chinoxalinonen und Dihydropyrazinonen	36
4.3.2. Abspaltungen mit Aminophenolen zu Benzoxazinonen	40
4.3.3. Abspaltungen mit Aminothiophenolen zu Benzothiazolen.....	43
4.3.4. Abspaltungen mit Dithiolium-Salzen.....	50
4.3.5. Zugang zu Chinoxalinen und deren Derivatisierung.....	58
4.4 Biologische Untersuchungen	63
5. Zusammenfassung und Ausblick	69
5.1 Zusammenfassung	69
5.1.1. Abspaltung mit Diaminen	69
5.1.2. Derivatisierung immobilisierter <i>pseudo</i> -Oxazolone	72
5.1.3. Abspaltung mit 2-Aminothiophenolen.....	72
5.1.4. Abspaltung mit Dithiolium-Salzen.....	74
5.2 Ausblick.....	76
6. Experimenteller Teil.....	77

6.1	Allgemeines	77
6.1.1.	Analytische Geräte	77
6.1.2.	Präparatives Arbeiten und Geräte	81
6.1.3.	Reaktionen an fester Phase	84
6.2	Synthese und Charakterisierung der Einzelverbindungen.....	87
6.2.1.	Allgemeine Arbeitsvorschriften	87
6.2.2.	Darstellung der <i>pseudo</i> -Oxazolone	89
6.2.3.	Linker und immobilisierte <i>pseudo</i> -Oxazolone.....	98
6.2.4.	Derivatisierung der <i>pseudo</i> -Oxazolone am Träger	104
6.2.5.	Abspaltungen mit Diaminen	108
6.2.6.	Abspaltungen mit 2-Aminophenolen	121
6.2.7.	Abspaltungen mit 2-Aminothiophenolen.....	123
6.2.8.	Abspaltungen mit Dithiolium-Salzen.....	137
6.2.9.	Darstellung und Derivatisierung von Chinoxalinen.....	150
6.2.1.	Sonstige Reaktionen.....	163
7.	Abkürzungsverzeichnis.....	167
8.	Literaturverzeichnis.....	171
9.	Kristallographische Daten.....	175
10.	Anhang	179
10.1	Betriebsanleitung LC/MS	179
10.2	Betriebsanleitung GC/MS	187
10.3	Aufbau für erhitzte Festphasenreaktionen.....	195
10.3.1.	Reaktionen im kleinen Maßstab.....	195
10.3.2.	Reaktionen im großen Maßstab	197
10.4	Danksagung	199