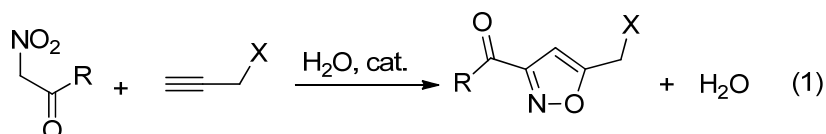


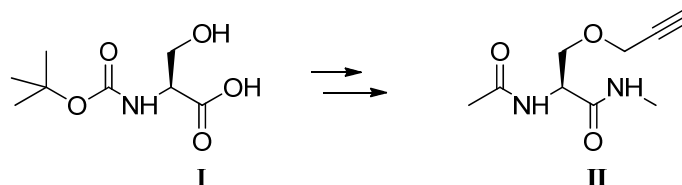
Tesi Sperimentale di **Enea Bruguier** (enea.bruguier@stud.unifi.it)
 Relatore: Fabrizio Machetti (fabrizio.machetti@unifi.it)

Condensazione in acqua di nitrocomposti primari con alchini per catalisi acido-base[#]

I nitrocomposti attivati condensano in acqua con alchini terminali per dare selettivamente i corrispondenti isossazoli 3,5-disostituiti. Il processo è modulato dalla presenza di un delicato sistema catalitico acido-base. [Eq. (1)].[1]

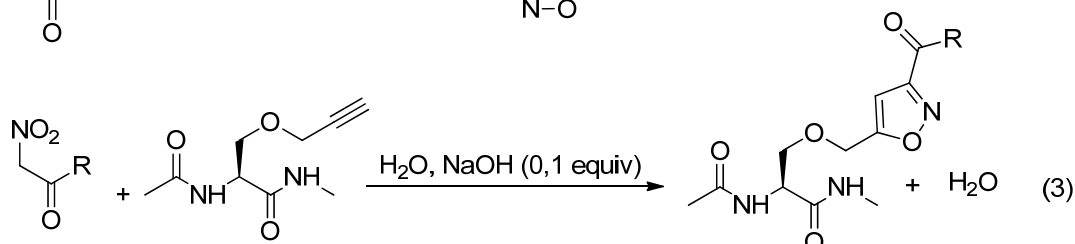
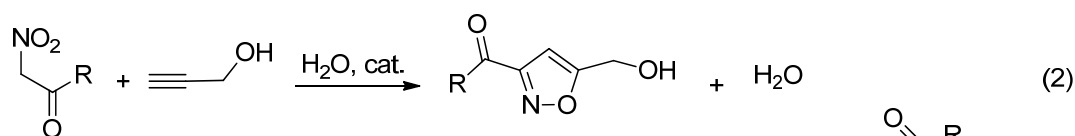


In questa tesi è stato studiato il processo applicato alla funzionalizzazione di piccoli peptidi esemplificati da strutture tipo Ac-Aaa-NHMe.[2] L'α-amminoacido utilizzato è la serina la cui funzionalità idrossilica ha permesso di inserire una struttura propargilica sulla catena laterale. La serina funzionalizzata **II** è stata preparata a partire da Boc-Ser-OH (**I**) (Schema 1).



Schema 1

Sul composto Ac-Ser(OProp)-NHMe (**II**) è stata studiata la condensazione in acqua con nitroacetato di etile (R = OEt) e N-metilnitroacetammide (R = NHMe) [Eq. (3)]. Il catalizzatore utilizzato è stato l'idrossido di sodio. Preliminarmente è stato messo a punto il catalizzare su una reazione modello che ha utilizzato l'alcol propargilico come substrato [Eq. (2)].



La reazione descritta in [Eq. (3)] ha avuto successo e i prodotti sono stati isolati cromatograficamente e caratterizzati attraverso analisi spettroscopiche NMR, IR e MS. Le rese del processo sono risultate buone.

[#] *In Water Acid-Base Catalysed Condensation of Primary Nitro Compounds and Alkynes*

[1] a) E. Trogu, C. Vinattieri, F. De Sarlo, F. Machetti, *Chem. Eur. J.* **2012**, 2081 - 2093 b) L. Guideri, F. De Sarlo, F. Machetti, *Chem. Eur. J.* **2013**, 665 - 677.

[2] H. Zahn, K. Mella *Hoppe-Seyler's Z. Physiol. Chem.* **1966**, (344), 75 - 82.