

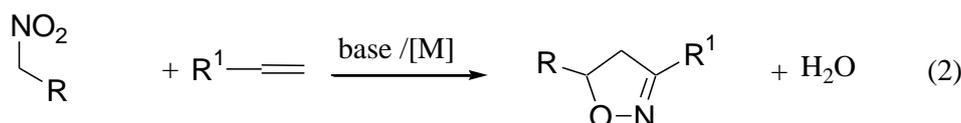
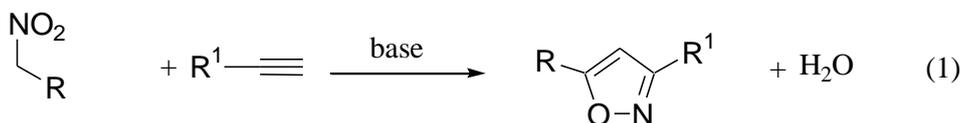
**CICLOADDIZIONE-CONDENSAZIONE DI NITROCOMPOSTI PRIMARI CON ALCHINI TERMINALI:
AMBITO DI APPLICAZIONE E LIMITI**

**CYCLOADDITION-CONDENSATION OF PRIMARY NITRO COMPOUNDS WITH TERMINAL ALKYNES:
SCOPE AND LIMITATIONS**

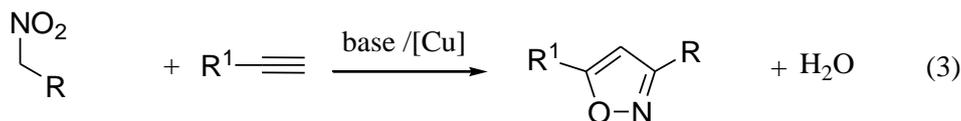
Tesi sperimentale di Laura Del Bimbo

Relatore: Dott. Fabrizio Machetti (fabrizio.machetti@unifi.it)

Gli isossazoli sono un'importante classe di composti eterociclici utilizzati in vari ambiti. La loro struttura è contenuta in numerosi composti ad uso farmaceutico e in questo contesto sono stati oggetto di numerosi studi in campo biologico.ⁱ La via più diretta per la loro preparazione è quella che utilizza la cicloaddizione termica tra nitrilossidi ed alchini. Questa via sintetica presenta diverse problematiche legate sia alla bassa selettività sia alla presenza di reazioni collaterali. In letteratura è riportata la modulazione di un opportuno catalizzatore nella cicloaddizione di nitrilossidi con alchini.ⁱⁱ I nitrocomposti primari condensano in presenza di un'opportuna base con alchini terminali per dare i corrispondenti isossazoli [Equazione(1)].ⁱⁱⁱ



E' noto che il corrispondente processo con alcheni è influenzato dalla presenza di un metallo il quale accelera la reazione diminuendo il tempo di induzione [Equazione(2)].^{iv} Prove preliminari hanno indicato che il processo con alchini può essere modulato dalla presenza di un catalizzatore a base di rame. Scopo della tesi è verificare se il processo descritto nell'[Equazione (1)] in presenza di rame combinato con un'opportuna base possa essere ulteriormente accelerato [Equazione(3)].



E' stato valutato l'ambito di applicazione del processo in funzione di diverse tipologie di nitrocomposti primari ed alchini terminali.

ⁱ J. Sperry, D. Wright *Curr. Opin. Drug. Discov. Devel.* **2005**, *8*, 273.

ⁱⁱ Per esempi simili con nitrilossidi: T. V. Hansen, P. Wu, V. V. Fokin *J. Org. Chem.* **2005**, *70*, 7761

ⁱⁱⁱ F. Machetti, L. Cecchi, E. Trogu, F. De Sarlo *Eur. J. Org. Chem.* **2007**, 4352 - 4359.

^{iv} L. Cecchi, F. De Sarlo, F. Machetti *Chem. Eur. J.* **2008**, *14*, 7903 - 7912.