

Q.O. 1999.
(20)
13

CURSO DE DOCTORADO

Profesor: Dr. C. Palomo Nicolau

Fecha: 6 - 10 DICIEMBRE 1999

Lugar: Departamento de Química Orgánica. FCEN. UBA

"Diseño y Materialización de Nuevas Estrategias Sintéticas a Compuestos de Interés Biológico. Amino Acidos, Péptidos y Peptidomiméticos a partir de β -lactamas"

PROGRAMA:

1. Interés biológico y médico de las β -Lactamas.
2. Síntesis de β -Lactamas.
 - 2.1 A partir de β -Amino Acidos.
 - 2.2 Condensación de Enlatos con Iminas.
 - 2.3 Cicloadición de Cetenas a Iminas.
 - 2.3.1 α -Amino β -Lactamas
 - 2.3.2 α -Hidroxi β -Lactamas
 - 2.3.3 α -Halo β -Lactamas.
 - 2.3.4 α -Alkyl β -Lactamas
3. α -Amino Acidos y Compuestos Relacionados a partir de β -Lactamas.
 - 3.1 Derivados del Acido Aspártico.
 - 3.2 α -Hydroxy β -Amino Acidos.
 - 3.3 α, β -Diamino Acidos.
4. α -Amino Acidos a partir de β -Lactamas
 - 4.1 Escisión del enlace N_1-C_4 . Procedimiento de Ojima
 - 4.2 Formación de Carboxianhidridos de α -Amino Acidos
5. Peptidomiméticos.



Dr. OSCAR VARELA
DIRECTOR DEPTO. QUIMICA ORGÁNICA

BIBLIOGRAFIA:

Importante: El Dr. Palomo traerá toda la bibliografía enunciada aquí; los alumnos podrán disponer de ella para hacer fotocopias.

1. Compuestos β -lactámicos y Mecanismos de acción:

- C.A. Mascaretti, C.E. Boschetti, G.O. Danelon, E.G. Mata, O.A. Roveri, *Current Med. Chem.* 1995, 1, 441-470
- D. Niccolai, L. Tarsi, R.J. Thomas, *Chem. Commun.* 1997, 2333-2342
- I. Massova, S. Mobashery, *Acc. Chem. Res.* 1997, 30, 162-168
- M.I. Page, A.P. Laws, *Chem. Commun.* 1998, 1609-1617

2. β -Lactams

- *The Organic Chemistry of β -Lactams*, G.I. Georg, Ed. VCH: New York 1993
- F. Southgate, *Contemp. Org. Synth.* 1994, 1, 417
- *The Chemistry of β -lactams*, M.I. Page Ed.: Chapman and Hall: London, 1992
- Backes in Houben- Weyl, *Methoden der Organischen Chemie*, Band E16B, Muller, O. Bayer, Eds. Thieme: Stuttgart 1991, p.31

3. Síntesis de β -Lactamas

- Enolato-Imina Condensación
D.J. Hart, D.C. Ha, *Chem. Rev.* 1989, 89, 1447
M.J. Brown, *Heterocycles* 1989, 29, 2225
- Cetena-Imina Cycloadición
C. Palomo, J.M. Aizperua, I. Ganboa, M. Oiarbide, *Eur. J. Org. Chem.* 1999 (in press)
F.H. Van der Steen, G. Vankoten, *Tetrahedron* 1991, 47, 7503-7524
G.I. Georg, V.T. Ravikumar in *The Organic Chemistry of β -Lactams*, G.I. Georg, Ed. VCH: New York, 1993, 295-368

4. β -Amino Acidos

- G. Cardillo, C. Tomasini, *Chem. Soc. Rev.* 1996, 25, 117-128
- D.C. Cole, *Tetrahedron* 1994, 50, 9517
- E. Juaristi, D. Quintana, J. Escalante, *Aldrichim. Acta* 1994, 27, 3

5. β -Lactámicos como intermedios en síntesis de β -Amino Acidos y compuestos relacionados

- I. Ojima, F. Delalogue, *Chem. Soc. Rev.* 1997, 26, 377-386
- L.S. Hegedus, *Acc. Chem. Res.* 1995, 28, 299-305
- C. Palomo, J.M. Aizperua, I. Ganboa, M. Oiarbide, *Amino Acids* 1999, 16, 321-343
- C. Palomo, J.M. Aizperua, I. Ganboa, In *Enantioselective Synthesis of β -Amino Acids*, E. Juaristi, Ed. Wiley-VCH: New York, 1997, 279-357



Dr. OSCAR VARELA
DIRECTOR DEPTO. QUÍMICA ORGÁNICA