

Di-tert.-butyldicarbonat – ein vorteilhaftes Reagenz zur Einführung der tert.-Butyloxycarbonyl-Schutzgruppe

Luis MORODER, Allan HALLETT, Erich WÜNSCH, Oskar KELLER und Gernot WERSIN

Max-Planck-Institut für Biochemie, Abteilung für Peptidchemie, München, und
Fluka AG, Buchs/SG.

(Der Schriftleitung zugegangen am 15. September 1976)

Zusammenfassung: Di-tert.-butyldicarbonat eignet sich vorteilhaft zur Einführung der tert.-Butyloxycarbonyl-Schutzgruppe in Aminosäuren

und Aminosäurederivaten. Die Umsetzungen verlaufen unter milden und umweltfreundlichen Bedingungen rasch und mit hohen Ausbeuten.

Di-tert.-butyl-dicarbonate, a Useful tert.-Butyloxycarbonylating Reagent

Summary: Di-tert.-butyl-dicarbonate is an ideal reagent for tert.-butyloxycarbonylating amino

acids and their derivatives in regard to both reaction rate and simplicity of the procedure.

Key words: Di-tert.-butyldicarbonate, tert.-butyloxycarbonyl amino acids.

In den zur Zeit führenden Methoden und Strategien der Peptidsynthese ist die tert.-Butyloxycarbonyl-(Boc)-Schutzgruppe neben dem Benzylloxycarbonylrest zu einem beherrschenden Faktor geworden^[1]. Als „Acyldonator“ zur Erstellung der Blockierung der Aminofunktion wurde bislang meistens tert.-Butyloxycarbonylazid^[2] seiner Vorteile wegen benützt, auch wenn nicht unbedeutende Nachteile einerseits mit dem Reagenz und andererseits im Zuge des Acylierungsprozesses in Kauf genommen werden mußten. Einer dieser erheblichen Nachteile ist das Auftreten von Stick-

stoffwasserstoffsäure als Nebenprodukt – eine seit kurzem als äußerst umweltfeindlich erkannte Verbindung (ein höchstgefährliches Fischgift). Die im Verlaufe der Zeit angebotenen „Ersatzreagenzien“^[1] zur Einführung der Boc-Schutzgruppe konnten bislang die gestellten Anforderungen eines gleichwertigen Ersatzes für tert.-Butyloxycarbonylazid nicht erfüllen.

D.S. Tarbell et al.^[3] haben zur Herstellung von Boc-Aminosäuren die Umsetzung von Aminosäureester mit Di-tert.-butyldicarbonat vorgeschlagen; das von den Autoren gewählte drasti-

Abkürzungen:

Auf Grund der Vereinbarungen biochemischer Zeitschriften werden hier die von der IUPAC-IUB Commission on Biochemical Nomenclature empfohlenen Abkürzungen für Schutzgruppen verwendet. Die Autoren bevorzugen aber wegen ihrer universellen Anwendbarkeit die in Houben-Weyl (Methoden der Organischen Chemie, 4. Aufl., Bd. 15, S. 20 - 27, Verlag G. Thieme, Stuttgart 1975) verwendeten und eingehend erläuterten Abkürzungen.