

1. Kurzzusammenfassung .....	1
2. Einleitung .....	2
2.1. Molekulare Transporter .....	4
2.2. Peptidomimetika .....	5
2.3. Polyamine .....	6
2.4. Peptoide .....	9
2.4.1. Synthese von Peptoiden .....	10
2.4.1.1. Monomermethode .....	11
2.4.1.2. Submonomermethode .....	13
2.4.2. Anwendung von Peptoiden .....	14
2.5. Kupfer-katalysierte Alkin-Azid-Cycloaddition (CuAAC) .....	15
2.5.1. CuAAC-Reaktionen in der Synthese von Peptoiden .....	17
3. Ziel der Arbeit .....	18
4. Hauptteil .....	19
4.1. Vorbetrachtungen .....	19
4.1.1. Analytik-Methoden an der festen Phase .....	19
4.1.2. Benennung der Moleküle .....	22
4.1.2.1. Polyamine .....	22
4.1.2.2. Peptoide .....	22
4.1.2.3. Triazol-Peptide .....	24
4.1.3. Peptoid-Synthese – Nebenreaktionen .....	25
4.2. Reduktion an der festen Phase .....	26

4.2.1. Vorbetrachtungen .....	26
4.2.2. Hydrierungen an einem Testsystem .....	27
4.2.3. Erweiterung des Testsystems auf unterschiedliche C-C-Mehrfachbindungen .....	30
4.2.4. Stabilität funktioneller Gruppen gegenüber den Hydrierungsbedingungen.....	34
4.3. Synthese neuartiger Polyaminstrukturen.....	37
4.3.1. Erste Versuche zum Aufbau an fester Phase.....	38
4.3.2. Optimierung der Iminbildung <sup>[200]</sup> .....	40
4.3.3. Weitere Anwendungen der Methode <sup>[200]</sup> .....	46
4.3.3.1. Darstellung eines neuartigen fluoreszenzmarkierten Polyamins .....	47
4.4. Transporter auf Peptoidbasis .....	49
4.4.1. Peptoidanaloga von SynB3 und Oktaarginin .....	49
4.4.1.1. Vorbetrachtungen .....	49
4.4.1.2. Synthese der benötigten Submonomere .....	52
4.4.1.3. Synthese der Peptoide .....	54
4.4.2. Untersuchung der modularen Synthese von Peptoiden mittels CuAAC-Reaktion <sup>[223]</sup> .....	60
4.4.2.1. Vorbetrachtung.....	60
4.4.2.2. Synthese der geschützten Alkine und deren Verwendung als Submonomere ....	63
4.4.2.3. Untersuchungen zur Markierung der synthetisierten Systeme mit verschiedenen Fluoreszenzmarkern .....	66
4.4.2.4. Untersuchungen zur orthogonalen Entschützung von Silylschutzgruppen an der festen Phase .....	70
4.4.2.5. Funktionalisierung der synthetisierten Systeme durch CuAAC-Reaktion.....	72

4.4.3. Synthese einer kleinen Peptoid-Bibliothek für biologische Untersuchungen <sup>[230]</sup> .....	79
4.4.3.1. Synthese der Peptoide .....	80
4.4.3.2. Erweiterung der Bibliothek .....	87
4.5. Triazol-Peptidomimetika als molekulare Transporter .....	90
4.5.1. Retrosynthetische Betrachtung.....	91
4.5.2. Synthese der Triazol-Peptide <sup>[254]</sup> .....	91
4.6. Untersuchung eines „click“-baren Carbazol-Fluoreszenzfarbstoffes .....	99
4.7. Biologische Untersuchungen mit den dargestellten Verbindungen .....	103
4.7.1. Polyamin-Transporter <sup>[200]</sup> .....	103
4.7.2. Peptoide.....	104
4.7.2.1. Computer-gestützte Auswertung der zellulären Aufnahme von Peptoid <b>149</b> ...	104
4.7.2.2. Untersuchung der Peptoid-Bibliothek an HeLa-Zellen.....	105
4.7.2.3. Untersuchung der Peptoid-Bibliothek an HaCaT-Zellen .....	111
4.7.2.4. Untersuchung der Peptoid-Bibliothek an Hefe-Zellen.....	114
4.7.2.5. Untersuchung der Peptoid-Bibliothek an Zebrafischen ( <i>dania rerio</i> ) <sup>[230]</sup> .....	117
4.7.2.6. Untersuchung der antibiotischen Aktivität.....	118
4.7.3. Triazol-Peptide .....	119
5. Zusammenfassung und Ausblick .....	120
5.1. Synthese von Polyaminen .....	120
5.2. Synthese von Peptoiden .....	121
5.3. Synthese von Triazol-Peptiden .....	122
5.4. Synthese von Triazol-Carbazolen .....	123

6. Experimenteller Teil.....	125
6.1. Allgemeines.....	125
6.1.1. Präparatives Arbeiten.....	125
6.1.2. Analytik und Geräte.....	126
6.1.3. Zelltests.....	130
6.2. Allgemeine Arbeitsvorschriften.....	133
6.3. Synthesevorschriften & analytische Daten.....	141
6.3.1. Flüssigphasenreaktionen.....	141
6.3.2. Festphasensynthese der Polyamine.....	157
6.3.3. Synthese der Peptoide.....	192
6.3.4. Synthese der Triazol-Peptide.....	233
6.3.5. Synthese des Carbazol-Peptoids.....	239
7. Kristallographische Daten.....	241
7.1. Verbindung <b>220a</b> .....	241
7.2. Verbindung <b>220b</b> .....	243
7.3. Verbindung <b>74</b> .....	245
8. Abkürzungsverzeichnis.....	247
9. Literaturverzeichnis.....	255
10. Anhang.....	280
10.1. Lebenslauf.....	280
10.2. Publikationen und Konferenzbeiträge.....	282
10.3. Danksagung.....	284