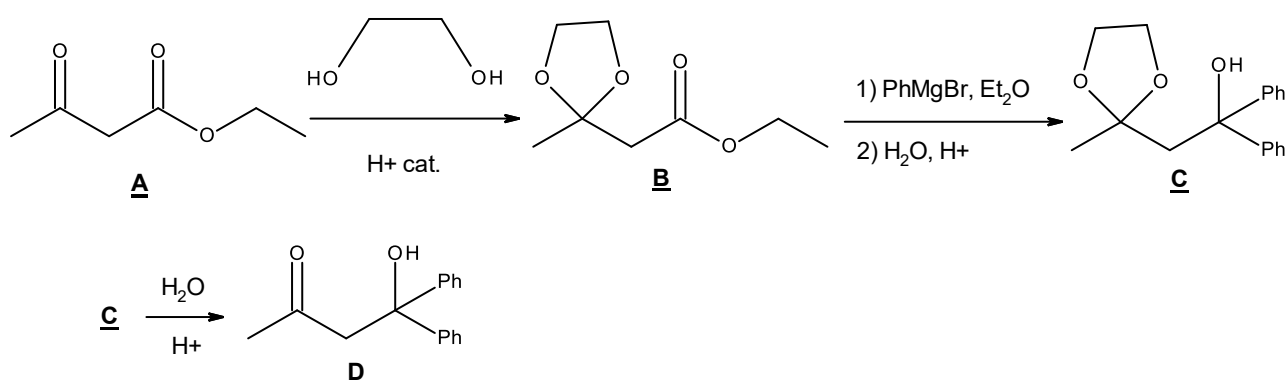


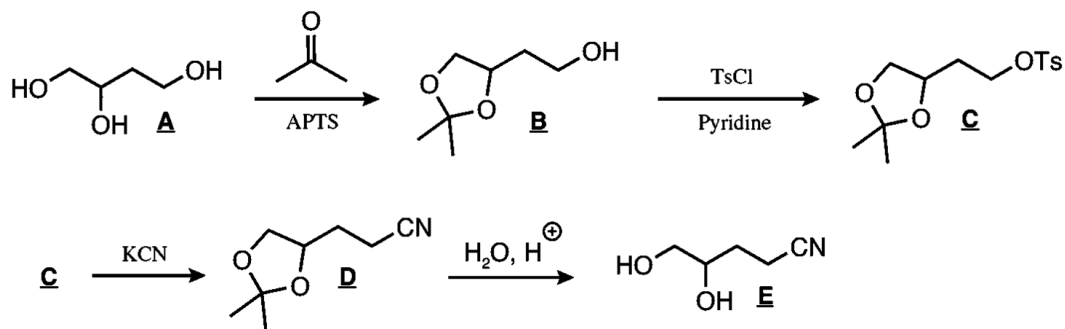
Chapitre 4 : Stratégie de synthèse

I. Protection – déprotection

1. Protection – déprotection du groupe carbonyle ou d'un diol

Exemple 1 :

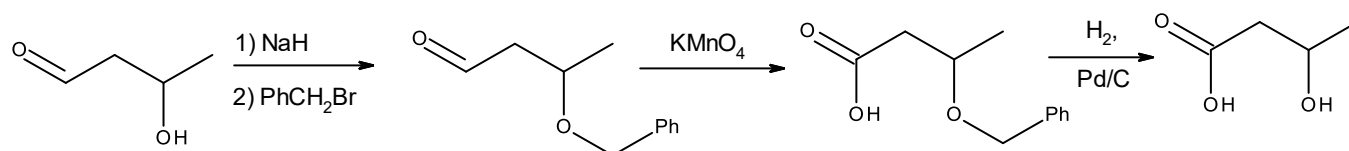
Produit indésirable :

Exemple 2 :

Produit indésirable :

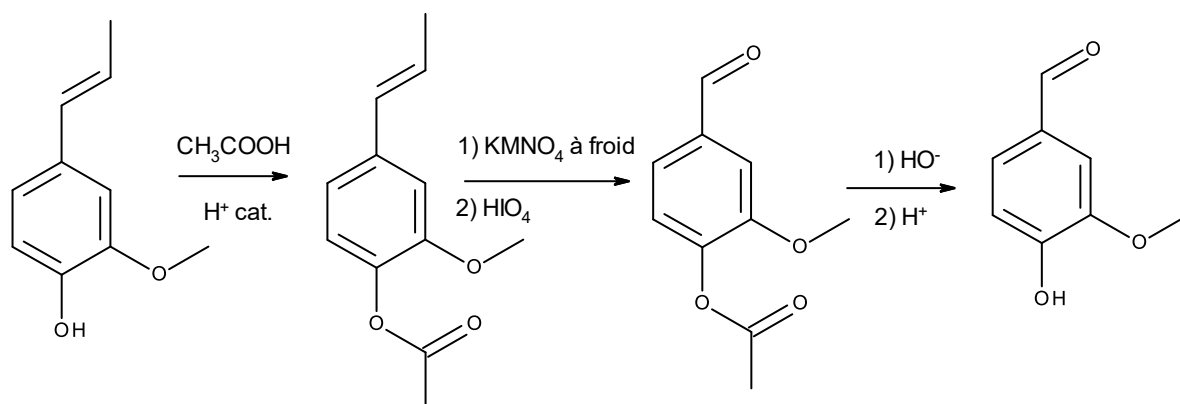
2. Protection – déprotection du groupe hydroxyle

Exemple 1 :

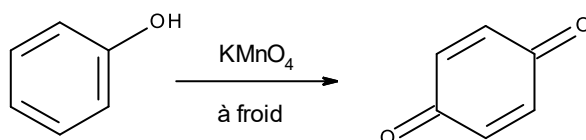


Produit indésirable :

Exemple 2 :



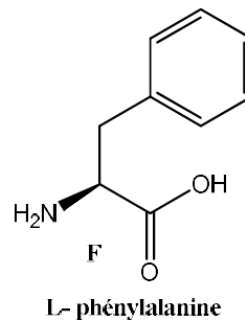
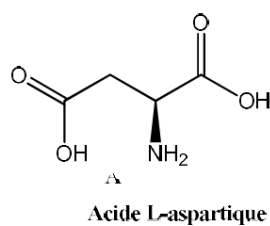
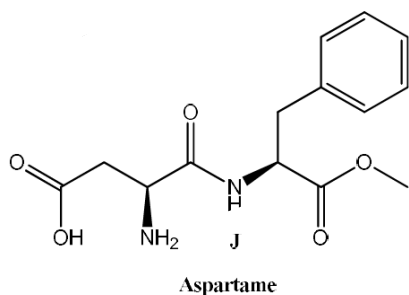
Banque de réaction :



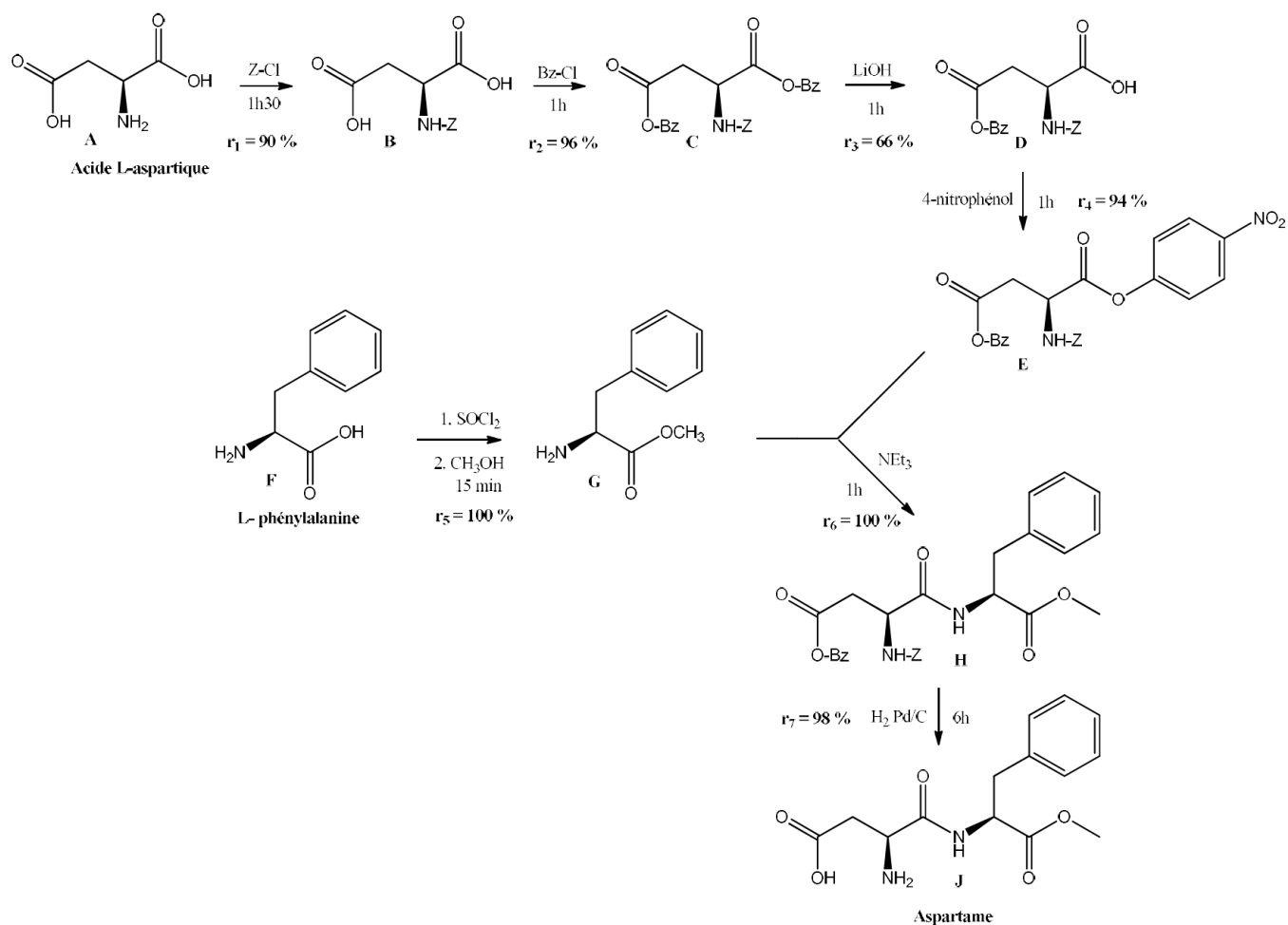
Produit indésirable :

3. Protection – déprotection du groupe amino

Exemple : Synthèse de l'aspartame à partir de l'acide L-aspartique et du L-phénylalanine

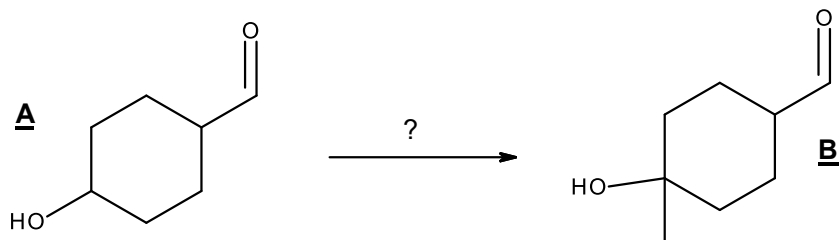


La synthèse peptidique de l'aspartame peut être réalisée au laboratoire selon le schéma réactionnel suivant :

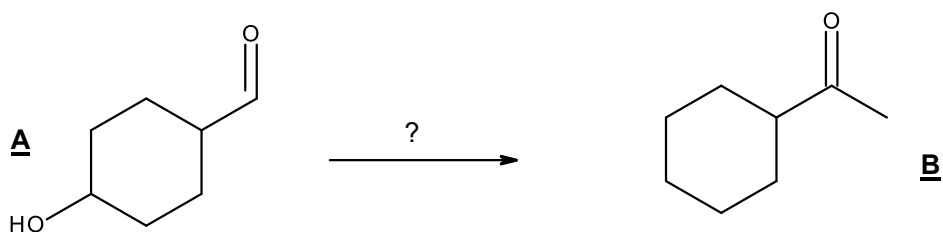


II. Application à la rétrosynthèse

➡ Proposer une voie de synthèse permettant d'obtenir B à partir de A

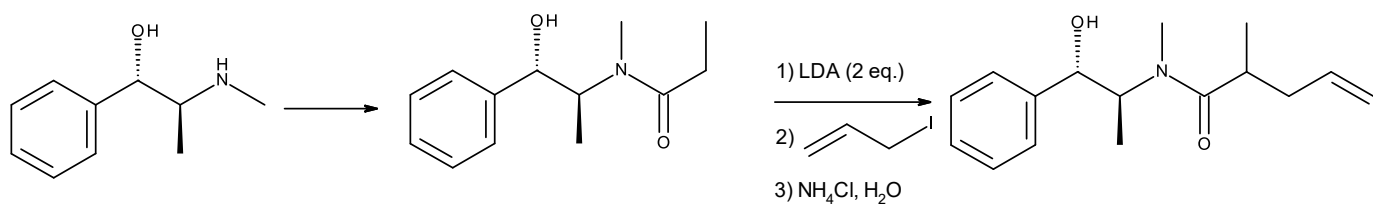


➡ Proposer une voie de synthèse permettant d'obtenir B à partir de A



III. Faut-il toujours protéger ?

Exemple :



IV. Les 12 principes de la chimie verte



V. Rendement d'une synthèse

- Le rendement d'une synthèse (donné en %) est donné par le rapport entre la quantité de matière de produit effectivement obtenue n_{exp} et la quantité de matière maximale qui pourrait théoriquement se former n_{th} :

$$r = 100 \times \frac{n_{exp}}{n_{th}}$$

- Dans le cas d'une synthèse linéaire en plusieurs étapes ($A \rightarrow B \rightarrow C \rightarrow D \rightarrow \dots$), le rendement de la synthèse est égal au produit des rendements de chaque étape

Exemple :

Rendement d'une synthèse de 7 étapes à 80% :

Rendement d'une synthèse de 4 étapes, 3 à 80% et 1 à 50% :

Conclusion :

Les questions à se poser à l'issue de ce chapitre***Protection - déprotection***

- Est-ce que je sais comment protéger et déprotéger un dérivé carbonyle ? un diol ?
- Est-ce que je connais les deux méthodes pour protéger un groupe hydroxyle ?
- Est-ce que je connais les deux méthodes pour passer d'un ester à un acide carboxylique ?
- Est-ce que je sais déprotéger un groupe amino ?

Stratégie de synthèse

- Est-ce que je sais reconnaître dans une synthèse les étapes de protection, de déprotection et d'activation ?

Rétrosynthèse

- Est-ce que je sais par quoi démarrer pour aborder une rétrosynthèse ?
- Est-ce qu'il faut nécessairement protéger ?
- Est-ce que j'ai des éléments pour choisir entre deux voies possibles ?
- Est-ce terminé une fois la rétrosynthèse résolue ?

