

# Inhaltsverzeichnis

<b>1. Einleitung</b>	<b>1</b>
<b>2. Allgemeiner Teil</b>	<b>3</b>
<b>2.1 β-Lactam-Antibiotika</b>	<b>3</b>
<b>2.1.1 Historische Entwicklung</b>	<b>3</b>
<b>2.1.2 Zielstrukturen und Wirkungsmechanismus</b>	<b>4</b>
<b>2.1.3 Bakterielle Resistenz</b>	<b>8</b>
<b>2.1.4 Strukturelle Einteilung der β-Lactam-Antibiotika</b>	<b>11</b>
<b>2.2 Weitere klinische Einsatzgebiete von β-Lactamen</b>	<b>19</b>
<b>2.3 β-Lactame als wertvolle synthetische Intermediate</b>	<b>21</b>
<b>2.4 Darstellungsmöglichkeiten von β-Lactamen</b>	<b>22</b>
<b>2.5 Die Keten-Imin-Cycloaddition</b>	<b>23</b>
<b>3. Zielsetzung</b>	<b>29</b>
<b>4. Synthese der Ausgangsverbindungen</b>	<b>35</b>
<b>4.1 Synthese der Auxiliare und Keten-Vorstufen</b>	<b>35</b>
<b>4.2 Synthese der Imine</b>	<b>40</b>
<b>4.2.1 Acyclische Imine, Hydrazone und Imidsäure-Derivate</b>	<b>40</b>
<b>4.2.2 Cyclische Imine, Hydrazone und Imidsäure-Derivate</b>	<b>45</b>
<b>4.2.3 Enantiomerenreine Imine</b>	<b>49</b>
<b>5. Diastereoselektive β-Lactam-Synthesen</b>	<b>55</b>
<b>5.1 Umsetzung der acyclischen, achiralen Imine</b>	<b>57</b>
<b>5.2 Umsetzung der cyclischen Imine</b>	<b>80</b>
<b>5.3 Umsetzung der enantiomerenreinen Imine</b>	<b>92</b>
<b>6. Abspaltung des chiralen Auxiliars</b>	<b>107</b>
<b>6.1 Synthese der 3-Chlor-β-lactame</b>	<b>112</b>
<b>6.2 Hydrolyse der 3-Chlor-β-lactame und Freisetzung der enantiomerenreinen Azetidin-2,3-dione</b>	<b>120</b>
<b>7. Selektive Ringöffnung von β-Lactamen</b>	<b>127</b>
<b>7.1 Spaltung der C-2/C-3-Bindung des β-Lactams</b>	<b>128</b>

7.2	<b>Spaltung der N-1/C-4-Bindung des <math>\beta</math>-Lactams .....</b>	132
7.3	<b>Spaltung der N-1/C-2-Bindung des <math>\beta</math>-Lactams .....</b>	140
7.3.1	Synthese der <i>N</i> -Boc- $\beta$ -lactame .....	141
7.3.2	Ringöffnungsversuche .....	148
8.	<b>Zusammenfassung und Ausblick .....</b>	153
9.	<b>Experimenteller Teil .....</b>	161
9.1	<b>Allgemeine Angaben .....</b>	161
9.2	<b>Synthese der Ausgangsverbindungen .....</b>	165
9.2.1	Synthese der Auxiliare und Keten-Vorstufen.....	165
9.2.2	Synthese der Imine .....	176
9.2.2.1	Acyclische Imine, Hydrazone und Imidsäure-Derivate .....	176
9.2.2.2	Cyclische Imine, Hydrazone und Imidsäure-Derivate .....	179
9.2.2.3	Enantiomerenreine Imine .....	180
9.3	<b>Synthese der <math>\beta</math>-Lactam-Derivate</b>	182
9.3.1	Umsetzung der acyclischen, achiralen Imine .....	182
9.3.2	Umsetzung der cyclischen Imine .....	213
9.3.3	Umsetzung der enantiomerenreinen Imine .....	230
9.4	<b>Abspaltung des chiralen Auxiliars</b>	247
9.4.1	Synthese der 3-Chlor- $\beta$ -lactame .....	247
9.4.2	Synthese der Azetidin-2,3-dione .....	270
9.5	<b>Selektive Ringöffnung von <math>\beta</math>-Lactamen</b>	282
9.5.1	Spaltung der C-2/C-3-Bindung .....	282
9.5.2	Spaltung der N-1/C-4-Bindung .....	287
9.5.3	Spaltung der N-1/C-2-Bindung .....	296
9.5.3.1	Synthese der <i>N</i> -Boc- $\beta$ -lactame .....	296
9.5.3.2	Ringöffnungsversuche .....	311
10.	<b>Röntgenkristallographische Daten</b>	317
11.	<b>Anhang</b>	339
11.1	<b>Experimentelle, spektroskopische und analytische Angaben zu weiteren isolierten Reaktionsprodukten</b>	339
12.	<b>Literatur und Anmerkungen</b>	351