

# Inhaltsverzeichnis

<b>1. Einleitung</b>	<b>1</b>
<b>2. Allgemeiner Teil</b>	<b>3</b>
<b>2.1 <math>\beta</math>-Lactam-Antibiotika</b>	<b>3</b>
2.1.1 Historische Entwicklung	3
2.1.2 Zielstrukturen und Wirkungsmechanismus	4
2.1.3 Bakterielle Resistenz	8
2.1.4 Strukturelle Einteilung der $\beta$ -Lactam-Antibiotika	11
<b>2.2 Weitere klinische Einsatzgebiete von <math>\beta</math>-Lactamen</b>	<b>19</b>
<b>2.3 <math>\beta</math>-Lactame als wertvolle synthetische Intermediate</b>	<b>21</b>
<b>2.4 Darstellungsmöglichkeiten von <math>\beta</math>-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>
4.2.1 Acyclische Imine, Hydrazone und Imidsäure-Derivate	40
4.2.2 Cyclische Imine, Hydrazone und Imidsäure-Derivate	45
4.2.3 Enantiomerenreine Imine	49
<b>5. Diastereoselektive <math>\beta</math>-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-<math>\beta</math>-lactame</b>	<b>112</b>
<b>6.2 Hydrolyse der 3-Chlor-<math>\beta</math>-lactame und Freisetzung der enantiomerenreinen Azetidin-2,3-dione</b>	<b>120</b>
<b>7. Selektive Ringöffnung von <math>\beta</math>-Lactamen</b>	<b>127</b>
<b>7.1 Spaltung der C-2/C-3-Bindung des <math>\beta</math>-Lactams</b>	<b>128</b>

7.2	Spaltung der N-1/C-4-Bindung des $\beta$ -Lactams .....	132
7.3	Spaltung der N-1/C-2-Bindung des $\beta$ -Lactams .....	140
7.3.1	Synthese der <i>N</i> -Boc- $\beta$ -lactame .....	141
7.3.2	Ringöffnungsversuche .....	148
8.	Zusammenfassung und Ausblick .....	153
9.	Experimenteller Teil .....	161
9.1	Allgemeine Angaben .....	161
9.2	Synthese der Ausgangsverbindungen .....	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	Synthese der $\beta$ -Lactam-Derivate .....	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	Abspaltung des chiralen Auxiliars .....	247
9.4.1	Synthese der 3-Chlor- $\beta$ -lactame .....	247
9.4.2	Synthese der Azetidin-2,3-dione .....	270
9.5	Selektive Ringöffnung von $\beta$ -Lactamen .....	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.	Röntgenkristallographische Daten .....	317
11.	Anhang .....	339
11.1	Experimentelle, spektroskopische und analytische Angaben zu weiteren isolierten Reaktionsprodukten .....	339
12.	Literatur und Anmerkungen .....	351