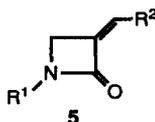




Tableau :  $\alpha$ -(1-Hydroxy)alkylazétidin-2-ones 4(a-h)

Amine	1	R <sup>1</sup>	<i>n</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	<i>i</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	<i>n</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	<i>i</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	<i>t</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	<i>c</i> -C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	Ph-CH <sub>2</sub>	<i>c</i> -C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>
Ester	2	R <sup>2</sup>	H	H	H	H	H	H	H	Me
$\beta$ -Lactame	4		a	b	c	d	e	f	g	h
Rdt%			76	80	68	44	89	81	51	41
mp °C			158	167	159	165	207	188	171	-

En conclusion, le résultat obtenu dans ce travail, constitue à notre connaissance, une des méthodes les plus simples qui permettent de préparer des  $\beta$ -lactames  $\alpha$ -(1-hydroxy)alkylés. Nous nous proposons d'en étudier la réactivité afin d'accéder, en particulier, aux  $\alpha$ -alkylidèneazétidin-2-ones 5, importants précurseurs de plusieurs séries d'antibiotiques<sup>9, 10</sup>.



#### Références et notes.

- 1 - Mukerjee, A. K. ; Singh, A. K., *Tetrahedron* **1978**, *34*, 1731 - 1767.
- 2 - Cinquini, M. ; Cozzi, F. ; Cozzi, P. G. ; Consolandi, E., *Tetrahedron* **1991**, *47*, 8767 - 8774.
- 3 - Voir par exemple : a) Bringmann, G. ; Geuder, T., *Synthesis* **1991**, 829 - 831.  
b) Asao, N. ; Ueyhara, T. ; Yamamoto, Y., *Tetrahedron* **1988**, *44*, 4173 - 4180.  
c) Gennari, C. ; Venturini, I. ; Gislou, G. ; Schimperna, G., *Tetrahedron Lett.* **1987**, *28*, 227 - 230.  
d) Kametani, T. ; Huang, S. ; Yokohama, S. ; Suzuki, Y. ; Ihara, M., *J. Am. Chem. Soc.* **1980**, *102*, 2060 - 2065.
- 4 - Villiéras, J. ; Rambaud, M., *Synthesis* **1982**, 924-926 ; *Organic Syntheses* **1988**, *66*, 220 - 224.  
Hoffmann, H.M.R. ; Rabe, J., *Angew. Chem., Int. Engl.* **1983**, *22*, 795 - 796.
- 5 - Jungheim, L.N., *Tetrahedron Lett.* **1989**, *30*, 1889 - 1892.
- 6 - D'Angelo, J. ; Maddaluno, J., *J. Am. Chem. Soc.* **1986**, *108*, 8112 - 8114.
- 7 - Johnson, M.R., *J. Org. Chem.* **1986**, *51*, 833 - 837.

#### 8 - Mode opératoire type :

A une solution d' $\alpha$ -hydroxyméthylacrylate d'éthyle 2 (2,6g, 20mmol.) dans 3ml de méthanol absolu, sont ajoutés goutte à goutte 4,72g (80 mmol.) d'isopropylamine. Le mélange est agité pendant 30mn à la température ambiante puis porté à reflux pendant une nuit. Après refroidissement, l'excès d'amine et le solvant sont évaporés sous vide. Le résidu solide qui en résulte est lavé à l'hexane puis recristallisé dans l'éthanol absolu. On obtient le  $\beta$ -lactame 4b cristallisé (2,56g, 80%). Les différents  $\beta$ -lactames 4(a-h) sont isolés sous forme de monohydrates

*N*-isopropyl-3-hydroxyméthyl-azetidin-2-one 4b.

I.R (film): 1730 (C=O), 3310 (O-H) cm<sup>-1</sup>.

RMN<sup>1</sup>H (D<sub>2</sub>O/TMS): 1,36 (d, J = 6Hz), 2CH<sub>3</sub> ; 2,76 (sextuplet, J = 6Hz), -CH ; 3,1-3,6 (m), 3H ; 3,86 (d, J = 6Hz), -CH<sub>2</sub>-OH.

RMN<sup>13</sup>C (D<sub>2</sub>O/TMS): 21,01 (q), 2 CH<sub>3</sub> ; 47,17 (t), CH<sub>2</sub>-N ; 49,02 (d), CH-CO ; 53,77 (d), CH-N ; 64,34 (t), -CH<sub>2</sub>-OH ; 180,73 (s), -CO-

SM (m/e): 30 (100) ; 44 (72) ; 72 (46) ; 84 (16) ; 128 (7) ; 146 (11) ; 162 (M<sup>+</sup>+1, 2)

9 - Buynak, J.D. ; Mathew, J. ; Rao, M.N. ; Haley, E. ; George, C. ; Siriwardane, U., *J. Chem. Soc., Chem. Commun.* **1987**, 735 - 737

10 - Commerçon, A. ; Ponsinet, G., *Tetrahedron Lett.* **1983**, *24*, 3725 - 3728.

(Received in France 17 June 1992)