

C 07 D 501

Ans.nr.: 1365/84

Indleveret: 29 feb 1984

Løbedag: 21 jul 1978

Stamansøgning nr.: 3267/78

Alm. tilgængelig: 29 feb 1984

Prioritet: 23 jul 1977 JP 88733/77

02 feb 1978 JP 9869/78

13 jun 1978 JP 70417/78

*TOYAMA CHEMICAL CO. LTD.; Tokyo, JP.

Opfinder: Isamu *Saikawa; JP, Shuntaro *Taka-
no; JP, Hiroyuki *Imaizumi; JP, Isamu *Taka-
kura; JP, Hirokazu *Ochiai; JP, Takashi *Yasu-
da; JP, Hideo *Taki; JP, Masaru *Tai; JP, Yuta-
ka *Kodama; JP.

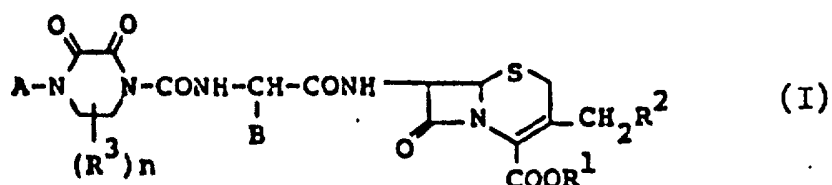
Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang &
Boutard

Analogifremgangsmåde til fremstilling af
cephalosporiner eller salte deraf

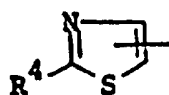
P a t e n t k r a v :

1365-84

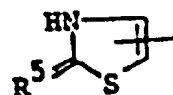
1. Analogifremgangsmåde til fremstilling af cephalosporiner
med den almene formel



hvor R^1 betyder hydrogen eller en carboxylbeskyttende gruppe,
 R^2 betyder acetoxy, carbamoyloxy eller en eventuelt substitue-
ret heterocyclisk-thio-gruppe, R^3 betyder alkyl med 1-5 carbon-
atomer, n er 0, 1 eller 2, A betyder hydrogen eller eventuelt
substitueret alkyl med 1-14 carbonatomer, og B betyder

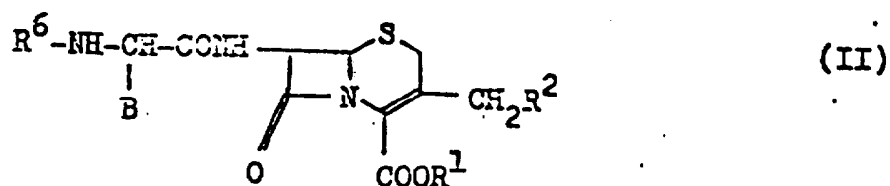


eller dens tautomer



hvor R^4 betyder eventuelt beskyttet amino, og R^5 betyder eventuelt beskyttet imino, eller farmaceutisk acceptable salte deraf, k e n d e t e g n e t ved, at

(a) en forbindelse med den almene formel

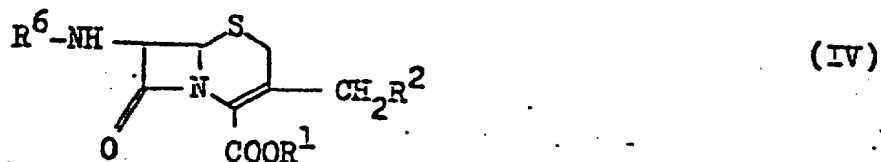


hvor R^6 betyder hydrogen eller en organisk silylgruppe eller phosphorholdig gruppe, og R^1 , R^2 og B har den ovenstående betydning, omsættes med et reaktivt derivat i carboxylgruppen af en forbindelse med formelen



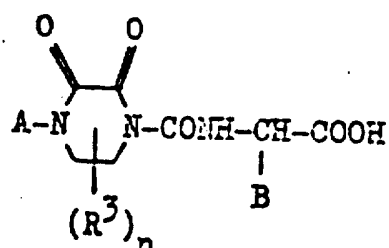
hvor R^3 , n og A har den ovenstående betydning, eller

(b) en forbindelse med den almene formel



hvor R^1 , R^2 og R^6 har den ovenstående betydning, omsættes med en forbindelse med den almene formel

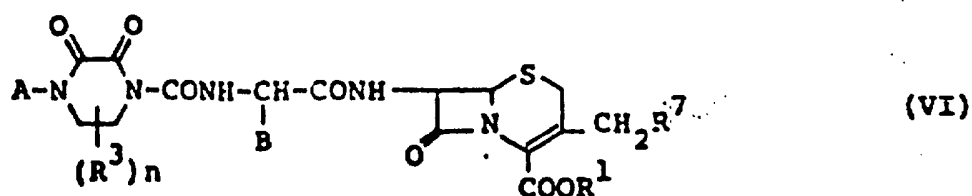
1365-84



(V)

hvor R^3 , n , A og B har den ovenstående betydning, eller med et reaktivt derivat i carboxylgruppen deraf, eller

(c) en forbindelse med den almene formel



(VI)

hvor R^7 betyder en gruppe, der let erstattes med et nucleofilt reagens, og R^1 , R^3 , n , A og B har den ovenstående betydning, omsættes med en forbindelse med den almene formel



(VII)

hvor M betyder hydrogen, et alkalimetall eller et jordalkalimetall, og R^2 har den ovenstående betydning,

hvorpå, om ønsket, en dannet forbindelse med formlen (I), hvor R^1 er hydrogen, omdannes til et salt deraf med en base, eller den dannede forbindelse, om ønsket, omdannes til et syreadditionssalt deraf.

