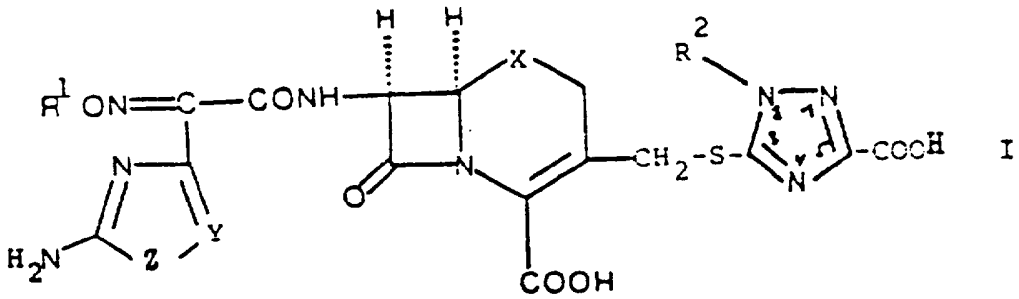
C 07 D 501 Ans.nr.: 3963/82
Indleveret: 03 sep 1982
Løbedag: 03 sep 1982
Alm. tilgængelig: 24 mar 1983
Prioritet: 23 sep 1981 CH 6137/81
F. *HOFFMANN–LA ROCHE & CO. AKTIENGESELLSCHAFT; Basel, CH.
Opfinder: Marc *Montavon; CH, Roland *Reiner; CH.
Fuldmægtig: Plougmann & Vingtoft Patentbureau

Fremgangsmåde til fremstilling af cephalosporinderivater

SAMMENDRAG

3963-82

Let hydrolyserbare estere af cephalosporinderivater med den almene formel I



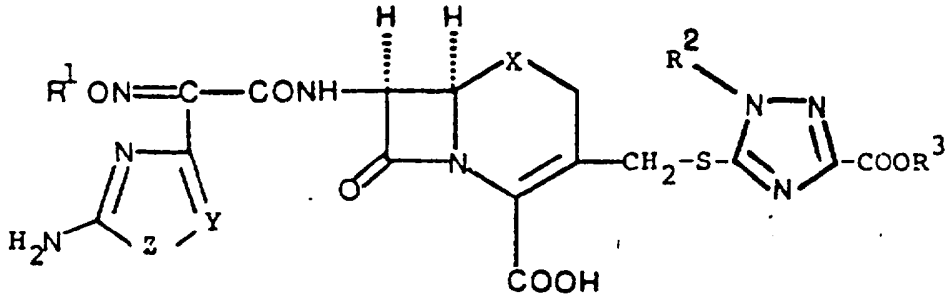
I

hvor R^1 betegner hydrogen, methyl eller carboxy-lavere alkyl, X betegner svovl, oxygen, -SO- eller $-SO_2-$, Y betegner -CH= eller nitrogen, Z betegner svovl eller selen, og R^2 betegner eventuelt med carboxy, hydroxy, let hydrolyserbart acyloxy eller dimethylamino substitueret lavere alkyl, bortset fra (6R,7R)-7-[2-(2-amino-4-thiazolyl)-2-(methoxyimino)acetamido]-3-[[(5-carboxy-2-methyl-2H-1,2,4-

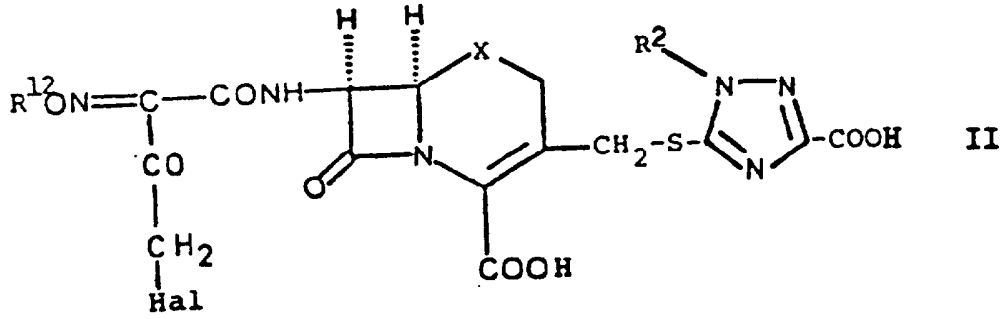
triazol-3-yl)thio]methyl]-8-oxo-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0]oct-2-en-2-carboxylsyre, eller syreadditionssalte af disse estere eller hydrater af disse estere eller syreadditionssalte fremstilles ved esterificering af syrerne I eller salte deraf, hvorefter et vundet produkt eventuelt S-oxideres, og det vundne produkt eventuelt omdannes til et syreadditionssalt eller hydrat eller et hydrat af et syreadditionssalt.

Produkterne er antibiotisk, især bactericidt, virksomme.

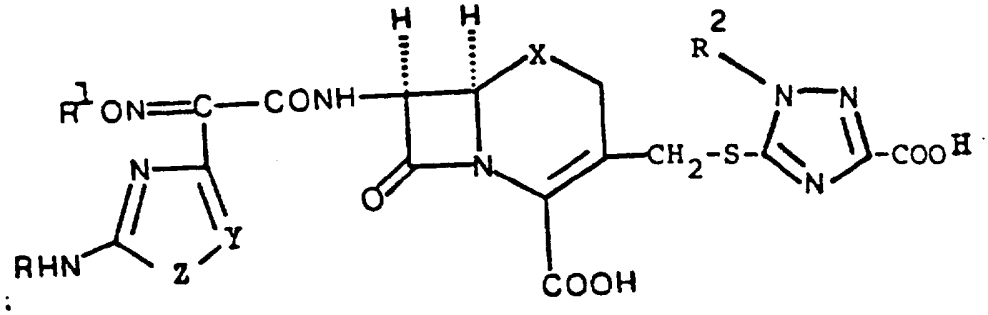
Foruden carboxylsyrerne I er halvestere X, halogenforbindelser II, dicarboxylsyrer III, triazolforbindelser V og Va, dicarboxylsyrer VI og dicarboxylsyrer XVI



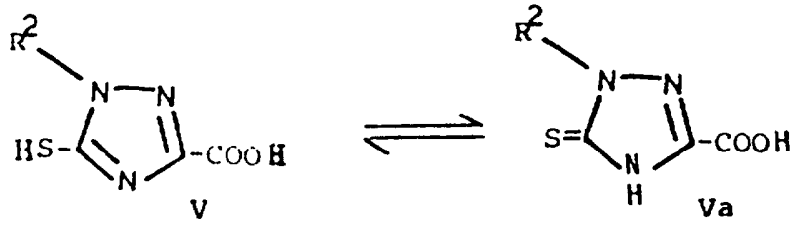
X



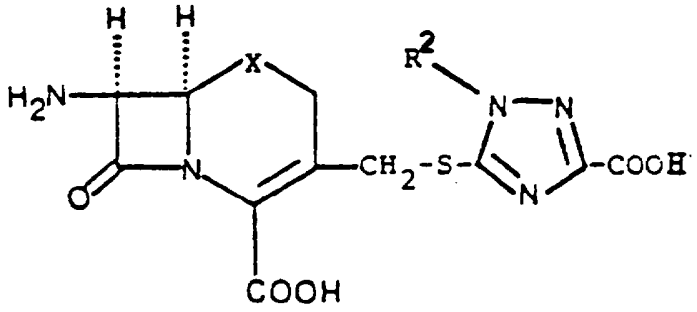
II



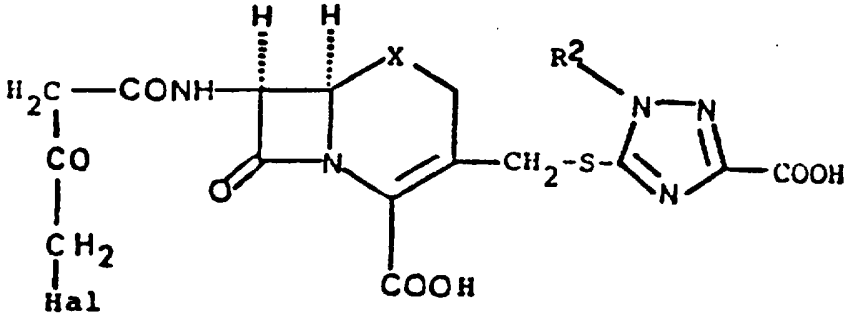
III



V Va



VI



XVI

i hvilken formel X $COOR^3$ betegner en let hydrolyserbar estergruppe, i formel II R^{12} betegner hydrogen eller methyl, Hal betegner et halogenatom, og carboxygruppen kan foreligge i beskyttet form, i formel III R betegner en fraspaltelig beskyttelsesgrupe, og carboxygruppen kan foreligge i beskyttet form, i formel V og Va R^2 ikke kan betegne methyl, og carboxygruppen og/eller aminogruppen i forbindelser med formlen VI kan foreligge i beskyttet form,
mellemprodukter ved syntesen.