

(19) DANMARK



(12) PATENTANSØGNING⁽¹⁰⁾ DK 0160/96 L

Patentdirektoratet

- (21) Patentansøgning nr.: 0160/96 (51) Int. Cl. 6: C 07 D 463/16
(22) Indleveringsdag:.... 15 feb 1996
(24) Løbedag:..... 15 jul 1986
(41) Alm. tilgængelig:.... 15 feb 1996
(62) Stamansøgningsnummer:..... 3356/86
(86) International ansøgning nr.:... -
(86) International indleveringsdag:
(85) Videreførselsdag:
(30) Prioritet: 17 jul 1985 US 755982
(71) Ansøger: *President and Fellows of Harvard College, Cambridge;
Massachusetts, US
(72) Opfinder: David Albert *Evans, 39 Pine Hill Lane; Concord; Massachusetts
01742, US
Eric Brian *Sjogren, 230 Massachusetts Avenue 7; Arlington;
Massachusetts 02174, US
(74) Fuldmægtig: Hofman-Bang & Boutard, Lehmann & Ree A/S, Adelgade 15, 1304,
København K

- (54) Fremgangsmåde til fremstilling af cisaenantiomere af 1-carba-3-cephem-4-carboxylsyre og derivater deraf samt N-alkylerede 3beta-beskyttet amino-azetidin-2-on-4beta-propansyre-thioestere, der er mellem produkter ved fremgangsmåden

(57) Sammendrag 160-96

1-Benzyl (eller substitueret benzyl)-3β-[4(S)-aryloxazolidin-2-on-3-yl]-4β-(2-arylviny)l)azetidin-2-oner fremstilles via cycloaddition af et 4(S)-aryloxazolidin-2-on-3-ylacetylhalogenid og en imin dannet med en eventuelt substitueret benzylamin og en 3-arylacrolein, f.eks. kanelaldehyd.

Disse azetidinoner er nyttige chirale mellemprodukter til brug ved asymmetrisk syntese af 1-carba(1-dethia)-3-cephem-4-carboxylsyre og estere deraf samt til brug ved fremstilling af monocycliske β-lactam-antibiotika.