

C 07 D 499

Ans.nr.: 0722/82

Indleveret: 19 feb 1982

Løbedag: 19 feb 1982

Alm. tilgængelig: 21 aug 1982

Prioritet: 20 feb 1981 US 236407

*PFIZER INC.; New York, US.

Opfinder: Wayne Ernest *Barth; US.

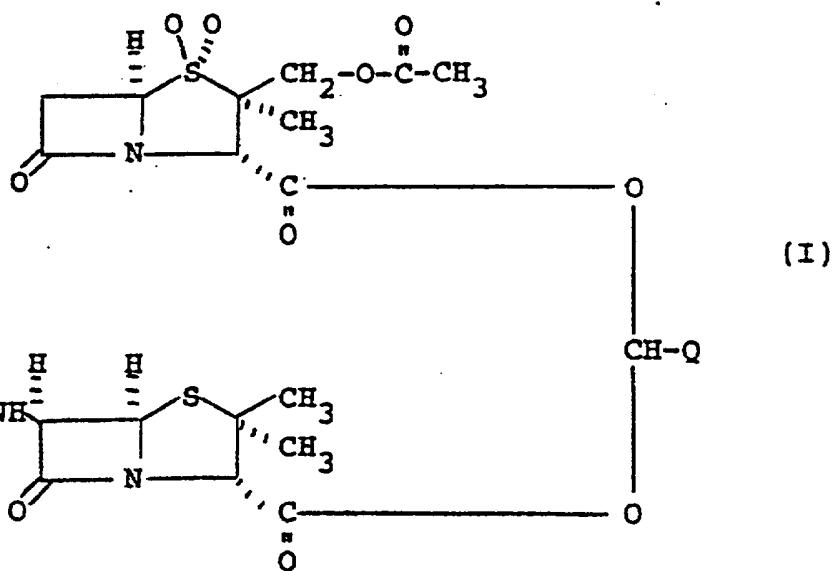
Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang & Boutard

Fremgangsmåde til fremstilling af bis-estere af 1,1-alkandioler med 2beta-acetoxy-methyl-2alpha-methyl-(5R)penam-3alpha-carboxylsyre-1,1-dioxid og en 6-acylaminopenicillansyre eller farmaceutisk acceptable salte deraf

SAMMENDRAG:

722-82

Bis-estere af 1,1-alkandioler med 2 β -acetoxy-methyl-2 α -methyl-(5R)penam-3 α -carboxylsyre-1,1-dioxid og en 6-acylaminopenicillansyre med formlen I



hvor i R¹ er acylgruppen af en organisk carboxylsyre, og

Q er hydrogen eller methyl, eller salte deraf fremstilles ved forskellige fremgangsmåder.

Disse bis-estere er nyttige som antibakterielle midler, der i pattedyrs krop frigør den antibakterielle 6-acylaminopenicillansyre og 2β -acetoxyethyl- 2α -methyl-(5R)-penam- 3α -carboxylsyre-1,1-dioxid, der er en kendt β -lactamase-inhibitor.

6-Aminopenicillanoyloxyethyl-esteren 1-(6-aminopenicillanoyloxy)ethyl-esteren og de chlor-, brom-, iod-, alkylsulfonyloxy-, phenylsulfonyloxy eller tolylsulfonyloxy-substituerede methyl- og ethylestere af 2β -acetoxyethyl- 2α -methyl-(5R)penam- 3α -carboxylsyre-1,1-dioxid er nyttige mellemprodukter.