



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

258291

(11) (B1)

(51) Int. Cl.⁴

C 07 D 277/52

(22) Přihlášeno 26 02 87

(21) PV 1296-87.J

(40) Zveřejněno 12 11 87

(45) Vydáno 14 04 89

(75)

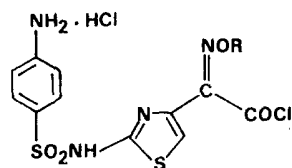
Autor vynálezu

MANDEL MARTIN ing., NOVÁK LUDVÍK RNDr. PhDr. CSc.,

RAJŠNER MIROSLAV ing. CSc., PRAHA

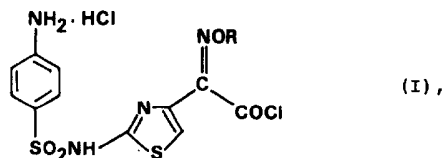
(54) **Hydrochloridy**
/Z/-2-alkoxyimino-2-[2-/4-aminobenzensulfonamido/-4-thiazolyl]acetyl-
chloridů

Řešení se týká hydrochloridů (Z)-2-alkoxyimino-2-[2-(4-aminobenzensulfonamido)-4-thiazolyl]acetylchloridů obecného vzorce I, nových látek, použitelných jako meziprodukty při syntéze nové skupiny antibiotik beta-laktamového typu. Tyto nové látky jsou přístupné reakcí (Z)-2-alkoxyimino-2-[2-(4-aminobenzensulfonamido)-4-thiazolyl]octových kyselin s chlo-ridem fosforečným.



(1)

Vynález se týká hydrochloridů (Z)-2-alkoxyimino-2-[2-(4-aminobenzensulfonamido)-4-thiazolyl]acetylchloridů obecného vzorce I



kde R značí alkylskupinu s 1 až 2 atomy uhlíku. Tyto nové, dosud nepopsané látky jsou základními meziprodukty syntézy nové skupiny polosyntetických antibiotik beta-laktamového typu, jejichž struktura obsahuje (Z)-2-alkoxyimino-2-[2-(4-aminobenzensulfonamido)-4-thiazolyl]-acetylskupinu.

Látky obecného vzorce I podle vynálezu lze připravovat postupy známými z literatury, například reakcí kyselin (Z)-2-alkoxyimino-2-[2-(4-aminobenzensulfonamido)-4-thiazolyl]octových s chloridem fosforečným, případně za přítomnosti katalytického množství dimethylformamidu. Jako prostředí se používá s výhodou acetonitril, reakce probíhá při teplotě -40 až 60 °C, s výhodou při teplotě -40 až 0 °C.

Bližší podrobnosti způsobu přípravy látek podle vynálezu vyplývají z následujících příkladů provedení. Je samozřejmé, že kromě uvedeného způsobu jsou možné k další alternativy vedoucí k žádaným látkám obecného vzorce I, jež jsou odborníkovi běžné a nemusí být proto výslovně jmenovány.

P ř í k l a d 1

Hydrochlorid 2-[2-(4-aminobenzensulfonamido)-4-thiazolyl]-(Z)-2-methoxyiminoacetylchloridu

K suspenzi 2 g (0,006 mol) kyseliny 2-[2-(4-aminobenzensulfonamido)-4-thiazolyl]-(Z)-2-methoxyiminooctové v 10 ml bezvodého acetonitrilu se za míchání a chlazení na -25 °C přidá kapka dimethylformamidu a 2,2 g (0,01 mol) chloridu fosforečného. Roztok vzniklý po 15 min míchání bez chlazení se ochladí na -40 °C a vyloučený produkt se po 10 min odsaje a promyje bezvodým benzenem a hexanem. Po vysušení za vakua při 60 °C se získá 1,2 g (52 %) zažloutlého produktu, který se při zahřívání nad 190 °C rozkládá. Obsah chloru (argentometricky) 104,2 % vypočteného množství.

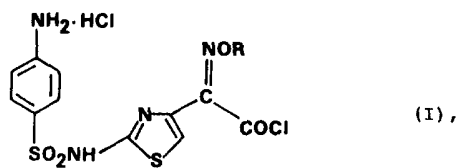
P ř í k l a d 2

Hydrochlorid 2-[2-(4-aminobenzensulfonamido)-4-thiazolyl]-(Z)-2-ethoxyiminoacetylchloridu

Postupem popsaným v příkladu 1 se s použitím ekvivalentního množství ethoxyderivátu s výtěžkem 34,9 % získá titulin sloučenina ve formě nažloutlého produktu, který se při zahřívání nad 180 °C rozkládá. Obsah chloru (argentometricky) 97,6 % vypočteného množství.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

Hydrochloridy (Z)-2-alkoxyimino-2-[2-(4-aminobenzensulfonamido)-4-thiazolyl]acetylchloridů obecného vzorce I



kde R značí alkylskupinu s 1 až 2 atomy uhlíku.