

C 07 D 205

Ans.nr.: 3730/82

Indleveret: 19 aug 1982

Løbedag: 19 aug 1982

Alm. tilgængelig: 28 feb 1983

Prioritet: 27 aug 1981 CH 5524/81

25 jun 1982 CH 3925/82

F. *HOFFMANN-LA ROCHE & CO. AKTIEN-
GESELLSCHAFT; Basel, CH.

Opfinder: Christian Nicolas *Hubschwerlen;
FR, Gerard *Schmid; CH.

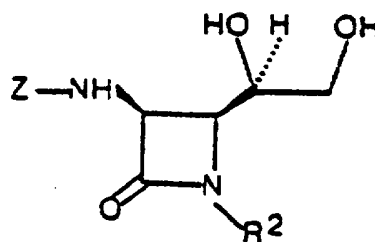
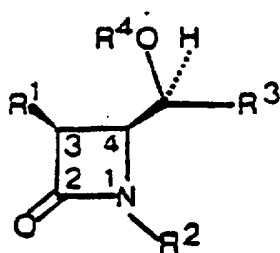
Fuldmægtig: Plougmann & Vingtoft Patentbu-
reau

Beta-lactamer

SAMMENDRAG

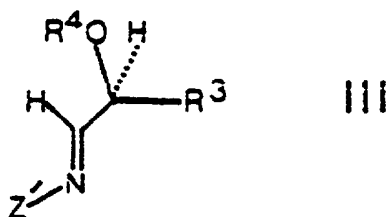
3730-82

Optisk rene β -lactamer med de almene formler



hvor Z betegner en let fraspaltelig acylgruppe, R^1 betegner amino eller en til amino omdannelig gruppe, R^2 betegner hydrogen eller en let fraspaltelig beskyttelsesgruppe, og R^3 og R^4 hver betegner en lavere, eventuelt oxygenholdig, via carbon tilknyttet carbonhydrid-gruppe, idet disse grupper også kan være bundet sammen med hinanden til en ring, og idet R^1 betegner let spaltelig acylamino, når R^2 betegner hydrogen, og de tilsvarende optiske antipoder deraf fremstilles ved omsætning af et reaktivt derivat af en carboxylsyre

$R^{11}-CH_2-COOH$, hvor R^{11} er azido, phthalimido eller $ROCO-CH=C(CH_3)-NH-$, hvor R er lavere alkyl, i nærværelse af en base med hidtil ukendte, optisk rene forbindelser III



hvor Z' betegner en let fraspaltelig beskyttelsesgruppe, eller med den optiske antipode deraf, efterfulgt af en fakultativ omdannelse af gruppen R^{11} til en aminogruppe, en fakultativ omsætning med et middel, som afgiver gruppen Z , og en fakultativ fraspaltning af gruppen Z' .

De omhandlede forbindelser anvendes til fremstilling af antimikrobielt virksomme β -lactamer.