

C 07 D 403

Ans.nr.: 1761/83

Indleveret: 21 apr 1983

Løbedag: 21 apr 1983

Alm. tilgængelig: 23 okt 1983

Prioritet: 22 apr 1982 DE 3215085

*BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; Leverkusen, DE.

Opfinder: Karl Georg *Metzger; DE, Wilfried

*Schroeck; DE, Dieter *Haebich; DE, Paul

*Naab; DE, Hans-Joachim *Zeiler; DE.

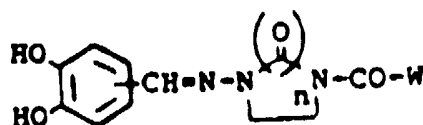
Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & Co

Beta-lactam-antibiotika, fremgangsmåde til fremstilling deraf samt deres anvendelse som lægemiddel

SAMMENDRAG:

1761-83

3-β-(vic-dihydroxyphenylmethylenamino-2-oxo-imidazolidin)- eller 3-β-(vic-dihydroxyphenylmethylenamino-2,3-dioxo-piperazin)-1-carbonylamino-acetamido-azetidin-2-oner med en sur gruppering ved 1N kan fremstilles ved, at 3-(amino-acetamido)-azetidin-2-oner med en sur gruppering ved 1N omsættes med forbindelser med den almene formel



II

hvor W betyder halogen, azid eller en anden nucleofug afgangsgruppe, n er 1 eller 2, og hvori de to hydroxygrupper kan være beskyttet med silyl- eller cyclosilylgrupper, i nærværelse af et opløsningsmiddel og eventuelt et syrebindende middel med temperaturer fra ca. -20°C til ca. +50°C, og de fremkomne β-lactam-

-antibiotika eventuelt befries for de tilstedeværende beskyttelsesgrupper og omdannes til de farmaceutisk anvendelige salte eller estere deraf, eller de frie syrer, om ønsket, fremstilles ud fra de fremkomne salte.

De her omhandlede forbindelser er anvendelige til bekæmpelse af bakterielle infektioner.