

C 07 D 501

Ans.nr.: 5833/83

Indleveret: 16 dec 1983

Løbedag: 16 dec 1983

Alm. tilgængelig: 18 jun 1984

Prioritet: 17 dec 1982 EP 82402328

*ICI-PHARMA; Enghien-les-Bains, FR, *IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES PLC; London, GB.

Opfinder: Frederic Henri *Jung; FR, Annie Antoinette *Olivier; FR, Frank *Loftus; GB.

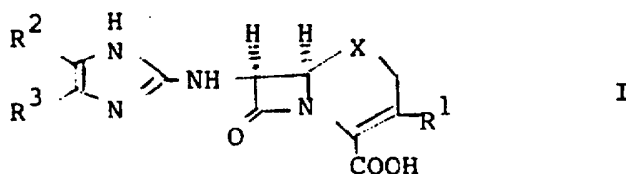
Fuldmægtig: Firmaet Chas. Hude

Fremgangsmåde til fremstilling af cephalosporinderivater

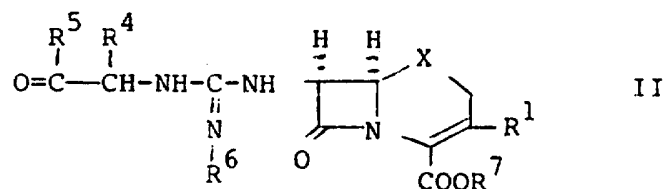
SAMMENDRAG.

5833-83

Fremgangsmåde til fremstilling af et cephalosporinderivat med formlen I:



hvor X er svovl, oxygen eller sulfinyl, R^1 er en hvilken som helst af C-3 substituenterne fra antibakterielt virksomme cephalosporiner, der kendes i teknikken, R^2 er hydrogen eller 1-6C-alkyl, R^3 er hydrogen eller 1-6C-alkyl, og de farmaceutisk acceptable syreadditionssalte og baseadditionssalte deraf, kendetegnet ved en ringslutning af en forbindelse med formlen II:



eller et derivat deraf, hvori carbonylgruppen er maskeret,
 eller et syreadditionssalt deraf, hvori R^4 og R^5 individuelt
 har en af de for R^2 og R^3 anførte værdier, R^6 er en nitrogen-
 beskyttende gruppe, og R^7 er hydrogen eller en hvilken som
 helst af de i teknikken kendte cephalosporin-3-carboxylsyre-
 beskyttende grupper, hvorefter - når produktet fra ringslut-
 ningen bevarer den beskyttende gruppe R^7 (når R^7 er forskellig
 fra hydrogen) - den beskyttende gruppe R^7 erstattes med hydro-
 gen på sædvanlig måde, og hvorefter - når forbindelsen med
 formlen I opnås i form af den fri base eller et salt, og der
 ønskes henholdsvis et farmaceutisk acceptabelt salt eller
 en fri base - en hvilken som helst nødvendig omdannelse mellem
 fri base og salt gennemføres på sædvanlig måde. Reaktionen
 resulterer i højere udbytter end de kendte fremgangsmåder,
 og det resulterende produkt er meget rent.