

C 07 H 15

Ans.nr.: 4497/83

Indleveret: 29 sep 1983

Løbedag: 29 sep 1983

Alm. tilgængelig: 31 mar 1984

Prioritet: 30 sep 1982 CH 5763/82

21 dec 1982 CH 7454/82

31 dec 1982 CH 7649/82

*SANDOZ A.G.; Basel, CH.

Opfinder: Hans *Loibner; AT, Wolfgang *Streicher; AT, Peter *Stuetz; AT.

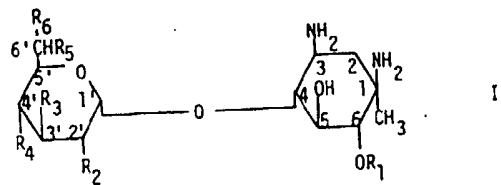
Fuldmægtig: Plougmann & Vingtoft Patentbureau

Fremgangsmåde til fremstilling af antibakterielle forbindelser

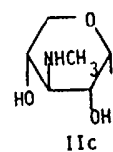
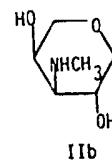
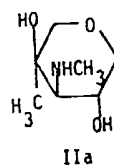
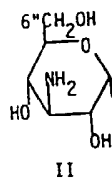
SAMMENDRAG

4497-83

Forbindelser med den almene formel I



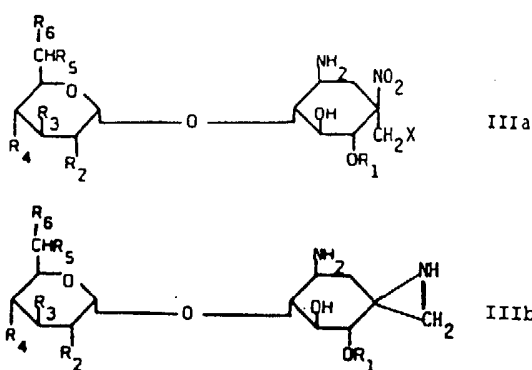
hvor R_1 betegner hydrogen eller en gruppe med formelen



hvor R_2 betegner hydroxy eller amino, R_3 betegner hydrogen eller

hydroxy, R_4 betegner hydrogen eller hydroxy, R_5 betegner amino, methylamino, dimethylamino eller, når R_2 betegner amino, også hydroxy, og R_6 betegner hydrogen eller methyl, i form af den frie base eller et syreadditionssalt fremstilles ved, at

a) en forbindelse med den almene formel IIIa eller IIIb



hvor X betegner en fraspaltelig enhed, og R_1 - R_6 har den ovenfor anførte betydning, og hvor eventuelle amino- og hydroxygrupper kan være beskyttede, og eventuelle beskyttede grupper, der stadig findes i den således vundne forbindelse, om nødvendigt afbeskyttes, reduceres, eller

b) en tilsvarende forbindelse med den almene formel I, hvor R_5 betegner amino, mono- eller dimetyleres til dannelsen af en forbindelse, hvor R_5 betegner methylamino eller dimethylamino, eller en tilsvarende forbindelse, hvor R_5 betegner methylamino, monometyleres, hvorhos andre eventuelt tilstedeværende aminogrupeer kan være beskyttede, hvorefter beskyttelsesgrupperne om nødvendigt fjernes fra eventuelle beskyttede aminogrupeer i den således vundne forbindelse, og den således vundne forbindelse med den almene formel I efter ønske udvindes i fri form eller i form af et syreadditionssalt.

Disse forbindelser kan anvendes som kemoterapeutika, især som antibakterielt virksomme antibiotika.