

C 07 H 17

Ans.nr.: 1731/82

Indleveret: 19 apr 1982

Løbedag: 19 apr 1982

Alm. tilgængelig: 21 okt 1982

Prioritet: 20 apr 1981 US 255620

*PFIZER INC.; New York, US.

Opfinder: Arthur Adam *Nagel; US.

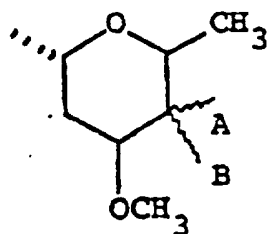
Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang & Boutard

Fremgangsmåde til fremstilling af 4"-deoxy-4"-methylen-oleandomycin-forbindelser eller syreadditionssalte deraf

SAMMENDRAG

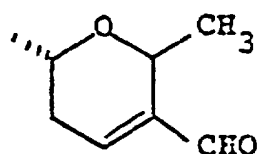
1731-82

Ved fremstillingen af 4"-deoxy-4"-methylen-oleandomycin-forbindelser, hvori L-oleandrosyl-andelen har formlen



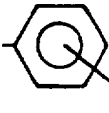
(a)

eller

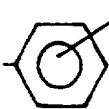


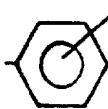
(b)

hvori A og B, når de tages sammen, er $=\text{CHX}$, hvori X er H,

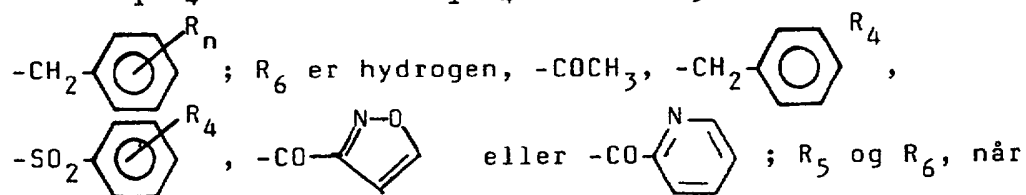
$-\text{CH}$, $-\text{COOR}_3$, $-\text{SR}_3'$, $-\text{S(O)}_2\text{R}_3'$ eller $-\text{N=CH}-$  ;

A taget for sig selv er hydrogen, B taget for sig selv er $-\text{CHO}$ eller $-\text{CH}_2\text{Z}$, hvori Z er hydrogen, OR_3 , $-\text{COOR}_3$, $-\text{SR}_3'$, $-\text{S(O)R}_3'$, $-\text{S(O)}_2\text{R}_3'$, $-\text{CN}$ eller $(\text{CH}_2)_n-\text{NR}_5\text{R}_6$;

R_3 er hydrogen, C_1-C_4 alkyl eller  ;

R_3' er C_1-C_4 alkyl eller  ; R_4 er hydrogen, chlor,

brom, C_1-C_4 alkyl eller C_1-C_4 alkoxy; R_5 er hydrogen eller



de tages sammen med tilknytningsnitrogenatomet, er phthalimido; og n er 0 eller 1, omsætter man i et inert opløsningsmiddel og i nærvær af en passende base den tilsvarende 4"-oxo-forbindelse med et dialkylphosphat med formlen $(R^0O)_2P(O)CH_2X$, hvori R^0 er C_1-C_4 alkyl, hvorefter der hydrolyseres og i påkommende tilfælde hydroxylbeskyttelsesgruppe i 11- og 2-stillingen i oleandomycinkernen fjernes, eventuelt efterfulgt af dannelse af syreadditionssalte.

Forbindelserne udviser antibakteriel virkning såvel in vitro som in vivo, især over for grampositive, men også visse gramnegative bakterier og lader sig anvende såvel teknisk som som lægemiddelbestanddel.