

C 07 D 499

Ans.nr.: 5511/82

Indleveret: 10 dec 1982

Løbedag: 10 dec 1982

Alm. tilgængelig: 12 jun 1983

Prioritet: 11 dec 1981 GB 8137513

*FARMITALIA CARLO ERBA S.P.A.; Milano, IT.

Opfinder: Marco *Alpegiani; IT, Carlo *Battistini; IT, Angelo *Bedeschi; IT, Giovanni *Franceschi; IT, Maurizio *Foglio; IT, Franco *Zarini; IT.

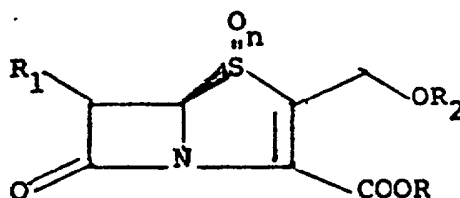
Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & Co

Fremgangsmåde til fremstilling af optisk aktive penemer

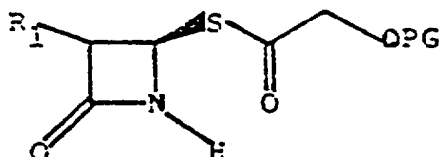
S A M M E N D R A G

5511-82

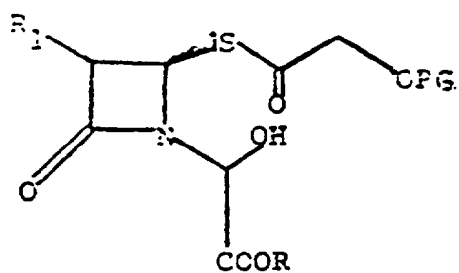
Optisk aktive penemer med formlen



hvor n er 0 eller 1, R er en carboxybeskyttelsesgruppe eller hydrogen, R₁ er hydrogen, en eventuelt substitueret carbonhydridgruppe eller en lavere alkoxy, og R₂ er hydrogen, C₁₋₅-alkyl, eventuelt med lavere alkyl N-substitueret carbamoyl eller en acylgruppe, eller disse pharmaceutisk acceptable salte fremstilles ved, at en forbindelse med formlen

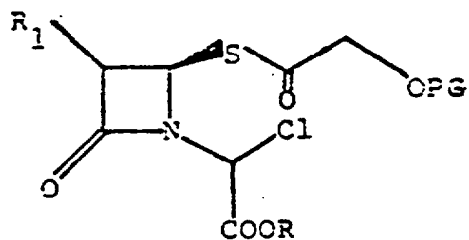


hvor PG er en beskyttelsesgruppe, kondenseres med en forbindelse med formlen CHOCOOR til en forbindelse med formlen



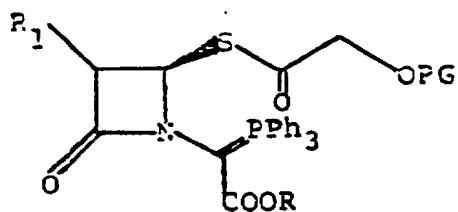
X

der chloreres til en forbindelse med formlen



XI

der omsættes med triphenylphosphin til en forbindelse med formlen

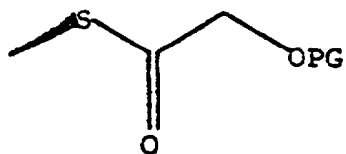


XII

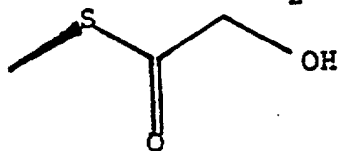
der omdannes til en forbindelse med formlen I ved følgende trin:

(a) cyclisering,

(b) fjernelse af beskyttelsesgruppen fra substituenten med formlen



(c) indføring af gruppen R_2 i substituenten med formlen



idet trin (a) foretages efter trin (b) og før trin (c), trin (a) foretages efter trinnene (b) og (c), og når R_2 er hydrogen, trin (b) udelades, og trin (a) foretages før eller efter trin (c), hvorefter den fremkomne forbindelse med formelen I, hvor n er 0, eventuelt oxideres til en forbindelse med formlen I, hvor n er 1, med en persyre, og om ønsket en fri forbindelse med formlen I omdannes til et salt.

Penemderivater med formlen I er værdifulde antibakterielle midler.

