



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11) (21) Patentinhakemus-Patentansökan 841435

(51) Kv.Ik.³/Int.Cl.³ C 07 D 501/34

(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag 11.4.84

(23) Alkuperäpäivä-Löpdag

(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig 13.10.84

(86) Kv. hakemus-Int. ansökan

(30) Etuoikeus-Prioritet 12.4.83 US 484,125

(71) Hakija/Sökande: Eli Lilly and Company, 307 East McCarty Street, Indianapolis, Indiana, USA

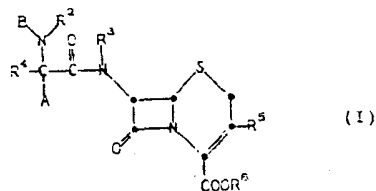
(72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Graves, Jr., Bernard James 2. Kukolja, St-japan

(74) Asiamies/Ombud: Kolster

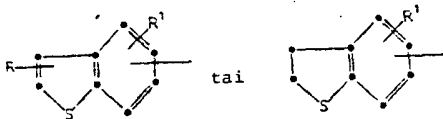
(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Bentsotienyylikefalosporiiniantibiootteja ja niiden valmistusmenetelmä. Benzotienylkefalosporinantibiotika och förfarande för deras framställning.

(57) Tiivistelmä

Menetelmä yhdisteen valmistamiseksi, jolla on kaava (I):

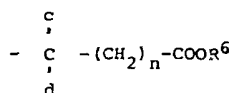


jossa R⁴ on



R on vety, C₁-C₃ alkyyli, halogeeni, nitro, amino, C₁-C₄ alkoksi, C₁-C₄ alkanoyyliamino tai C₁-C₃ alkyylisulfonyyliamino;
R¹ on vety, C₁-C₃ alkyyli, halogeeni, hydroksi tai C₁-C₄ alkoksi;

A ja B ovat molemmat vetyjä tai yhdessä täydentävät kaksoissidoksen;
R² on vety, aminoa suojaava ryhmä, hydroksi, C₁-C₄ alkoksi tai karboksi-substituoitu alkoksiryhmä tai karboksi-substituoitu sykloalkoksiryhmä, jolla on kaava



jossa c ja d ovat itsenäisesti vetyjä tai C₁-C₃ alkyylejä, tai c ja d otettuna yhdessä

sen hiilen kanssa, johon ne ovat sitoutuneet, muodostavat C₃-C₆ sykloalkyylirenkään; ja n on välillä 0 - 3; R³ on vety, tai R² ja R³ muodostavat yhdessä rakenteen



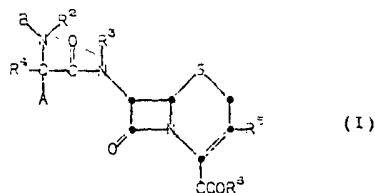
jossa M ja L ovat itsenäisesti C₁-C₄ alkyylejä; edellyttäen, että R² on hydroksi, C₁-C₄ alkoksi, karboksi-substituoitu alkoksi tai karboksi-substituoitu sykloalkoksi vain siinä tapauksessa, että A ja B täydentävät kaksoissidoksen, ja että A ja B ovat molemmat vetyjä, kun R³ on joku muu kuin vety;
R⁵ on vety, metyyli, halogeeni, metoksi, vinyyli tai substituoitu metyyli-ryhmä, jolla on kaava -CH₂-R⁵.

jossa R⁵ on metoksi, asetoksi tai karbamoyylioksi; R⁶ on vety tai karboksia suojaava ryhmä. Kaavan I mukaiset yhdisteet ovat oraalisesti tehokkaita antibiootteja.

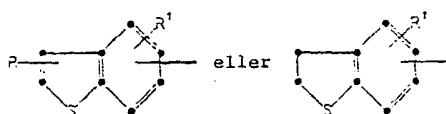
Jatkuu seuraavalla sivulla
Forts. nästa sida

(57) Sammandrag

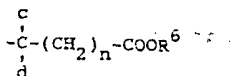
Uppfinningen hänför sig till framställningen av nya bensotienylkefalosporin-antibiotika med formeln



vari R⁴ är



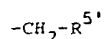
R är väte, C₁-C₃-alkyl, halogen, nitro, amino, C₁-C₄-alkoxi, C₁-C₄-alkanoylamino eller C₁-C₃-alkylsulfonylamino; R¹ är väte, C₁-C₃-alkyl, halogen, hydroxi eller C₁-C₄-alkoxi; A och B är vardera väte eller bildar tillsammans en dubbelbindning; R² är väte, en aminoskyddsgrupp, hydroxi, C₁-C₄-alkoxi eller en karboxisubstituerad alkoxigrupp eller en karboxisubstituerad cykloalkoxigrupp med formeln



vari c och d oberoende av varandra är väte eller C₁-C₃-alkyl, eller c och d tillsammans med kolatomen, vid vilken de är bundna, bildar en C₃-C₆-cykloalkylring; och n är 0-3; R³ väte, eller R² och R³ tagna tillsammans är



vari M och L oberoende av varandra är C₁-C₄-alkyl; med villkor att R² är hydroxi, C₁-C₄-alkoxi, karboxisubstituerad alkoxi eller karboxisubstituerad cykloalkoxi endast då A och B bildar en dubbelbindning, och att A och B vardera är väte då R³ är annat än väte; R⁵ är väte, metyl, halogen, metoxi, vinyl eller en substituerad metylgrupp med formeln



vari R^{5'} är metoxi, acetoxi eller karbamoyloxi; R⁶ är väte eller en karboxiskyddsgrupp. Föreningarna med formeln I är oralt effektiva antibiotika.