



PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11)(21) Patenttihakemus-Patentansökan 873290
 (51) Kv.lk.⁴/Int.cl.⁴ C 07 D 499/00, 513/04
 (22) Hakemispäivä-Ansökningsdag 28.07.87
 (23) Alkuperäivä-Löpdag
 (41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig 30.01.88
 (86) Kv. hakeamus-Int.ansökan
 (30) Etuoikeus-Prioritet 29.07.86 US 891493

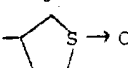
(71) Hakija/Sökande: *Pfizer Inc*, 235 East 42nd Street, New York, N.Y., USA

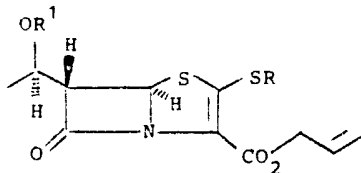
(72) Keksijä/Uppfinnare: Brighty, Katherine Elizabeth

(74) Asiamies/Ombud: Kolster

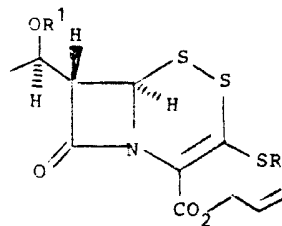
(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Menetelmä peneemien syntetisoimiseksi. Förfarande för syntetisering av penem.

(57) Tiivistelmä

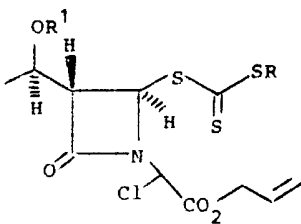
Keksinnön kohteena on menetelmä peneemien valmistamiseksi atsetidinoneista, jolloin kaavan (III) mukainen 3R,4R-4-asetoksi-3-[1R-1-(t-butyyliidimetyylisilyloksi)etyyli]-2-atsetidinoni muutetaan kaavan (II) mukaiseksi 1-atsa-4,5-ditiabisyklo[4.2.0]okt-2-en-8-oni-2-karboksylaattiesteriksi, josta rikkiä poistamalla saadaan kaavan (I) mukaista peneemiallyyliesteriä. Keksintö kohdistuu myös kaavan (II) mukaiseen välituotteeseen, jolloin R on (C₁-C₅)-alkyyli tai 1-okso-3-tiolasyyli tai ryhmä  ja R¹ on hydroksisuojarahmä.



(I)



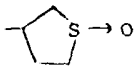
(II)

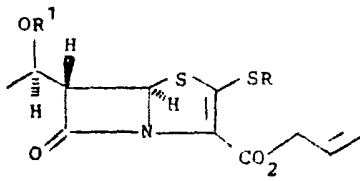


(III)

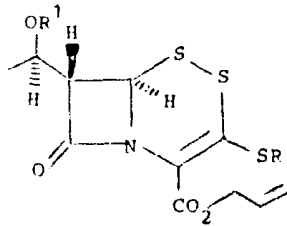
Jatkuu seur. sivulla
 Forts. nästa sida

(57) Sammandrag

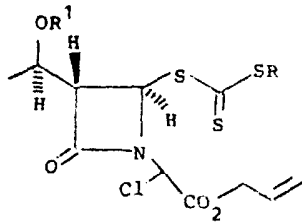
Uppfinningen avser ett förfarande för framställning av penemer av azetidiner, enligt vilket ett 3R,4R-4-acetoxi-3-[1R-1-(t-butyl-dimetylsilyloxi)etyl]-2-azetidinon med formeln (III) omvandlas till en 1-aza-4,5-ditiatocyklo[4.2.0]okt-2-en-8-on-2-karboxilatester med formeln (II), ur vilken genom avlägsning av svavlet erhålls penemallylester med formeln (I). Uppfinningen avser även en mellanprodukt med formeln (II), varvid R är (C₁-C₅)-alkyl eller 1-oxo-3-tiolacyl eller gruppen  och R¹ är en hydroxiskyddsgrupp.



(I)



(II)



(III)