

[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG



SUOMI-FINLAND  
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan 894326

(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5

C 07D 463/00

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 13.09.89

(24) Alkupäivä - Löpdag 13.09.89

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 17.03.90

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet

16.09.88 US 245185 P

(71) Hakija - Sökande

1. Eli Lilly and Company, Lilly Corporate Center, Indianapolis, Ind. 46285, USA, (US)

(72) Keksi - Uppfinnare

1. Blaszczak, Larry Chris, 5825 North Broadway, Indianapolis, Ind. 46220, USA, (US)

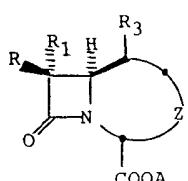
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

**Menetelmä 1-karba(detia)kefalosporiinien valmistamiseksi**  
**Förvarande för framställning av 1-karba(detia)kefalosporiner**

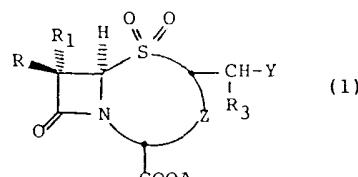
(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee menetelmää 1-karba-(1-de-tia)kefeemiyhdisteiden valmistamiseksi, joilla on kaava 2



(2)

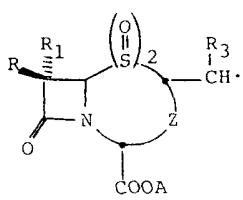
jossa R on amino, asyyliamino, suojattu amino tai alkyylisulfonyliamino, R<sup>1</sup> on vety tai alkoholi, Z on kaksiarvoisen ryhmän



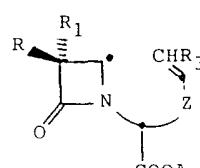
jossa ryhmillä R, R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub> ja A on edellä esitetyt merkitykset ja Y on vapaaradikaalipreursoriryhmä, annetaan reagoida inertissä liuottimessa vapaaradikaali-initiatorin kanssa. Keksintö koskee myös kaa-vojen (A) ja (B) mukaisia vapaaradikaali-yhdisteitä,



jossa R<sup>2</sup> on vety, alkyylili, alkenyylili, halo-geeni, alkoholi, alkyylitio, trialkyyli-si-lyylioksi, alkanoyylioksi, alkyylisulfo-nyylioksi, trifluorimetylisulfonyylioksi tai kaavan -CH<sub>2</sub>R<sub>2</sub> mukainen substituoitu metyyliiryhmä, jolloin R<sub>2</sub> on hydroksi, alkoholi, alkanoyylioksi, bentsoyylioksi, alkyylitio, bentsyylitio, bentsyylioksi tai heterosyklinen tioryhmä, R, on vety tai alkyylili ja A on karboksisiuojaryhmä. Keksinnön mukaisessa vapaaradikaalimenetel-mässä 2-substituoituja metyylikefalospo-riini-1,1-dioksidien, joilla on kaava 1,



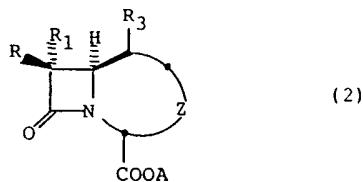
(A)



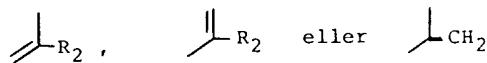
(B)

joissa ryhmillä R, R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub> ja A on edellä esitetyt merkitykset. Yhdisteet muodostuvat menetelmän väliotteina.

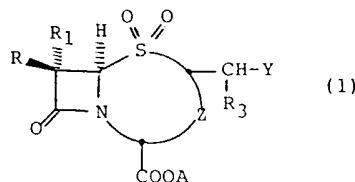
Uppfinningen avser ett förfarande för framställning av 1-karba-(1-detia)kefem-föreninger med formeln 2



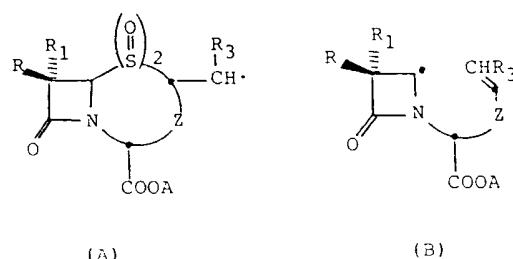
vari R är amino, acylamino, skyddad amino eller alkylsulfonylamino, R<sub>1</sub> är väte eller alkoxi, Z är en tvåvärd grupp



vari R<sub>2</sub> är väte, alkyl, alkenyl, halogen, alkoxi, alkyltio, trialkylsilyloxi, alkanoyloxi, alkylsulfonyloxi, trifluormethylsulfonyloxi eller en substituerad methylgrupp med formeln -CH<sub>2</sub>R<sub>2</sub>, varvid R<sub>2</sub> är hydroksi, alkoxi, alkanoyloxi, bensyloksi, alkyltio, bensyltio eller en heterocyklisk tiogrupp, R<sub>3</sub> är väte eller alkyl och A är en karboxiskyddsgrupp. Vid friradikalförfarandet enligt uppfinningen bringas 2-substituerade metylkefalosporin-1,1-dioxider med formeln 1



vari grupperna R, R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub> och A har ovan angivna betydelser och Y är en friradikal-prekursorgroup, att reagera i ett inert lösningsmedel med en friradikalinitiator. Uppfinningen avser även friradikalförningar med formeln A eller B



i vilka grupperna R, R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub> och A har ovan angivna betydelser. Föreningarna bildas som mellanprodukter vid förfarandet.