

Thèse No 5869

CONVERSION DE LA PENICILLINE
EN
CEPHALOSPORINE LACTONE

Thèse
présentée à l'école polytechnique fédérale de Zurich
pour l'obtention du titre de Docteur ès sciences naturelles
par

GERARD SCHMID
né le 9 juin 1949
originaire de Buch-Affeltrangen (Ct. de Thurgovie)

acceptée sur proposition du
Prof. Dr. D. Arigoni, rapporteur
Prof. Dr. W. Keller-Schierlein, corapporteur

1977

Résumé

On a converti la pénicilline G en phénylacétamido-7 céphalosporine lactone en remplaçant une partie du cycle thiazolidine de la pénicilline par l'hydroxy-3 mercaptométhyl-4 (5H) furanone-2 53a. La fonction énol des deux isomères 67 et 68 ainsi obtenus a été transformée en α -bromocétone. On a isolé un mélange de bromo-4 déamido-7 hydroxy-4 céphames lactones 69. Après débromhydrination réductive on a obtenu un mélange 1:1 de céphalorame et épi-6 céphalorame lactone 71 et 72. Cette conversion a été auparavant étudiée à l'aide d'un modèle ne comportant aucune fonction amide en position (7) de la céphalosporine. La stéréochimie des bromhydrines 58a cis et trans a été déterminée avec ce modèle.