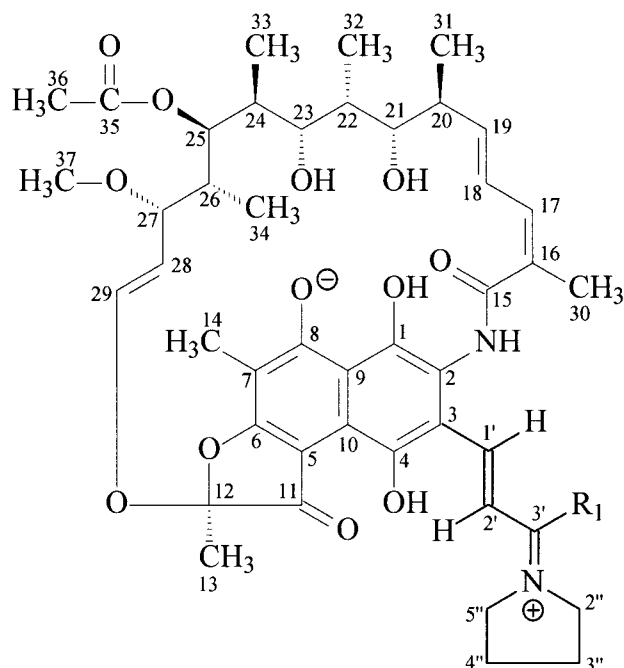


Zastrzeżenia patentowe

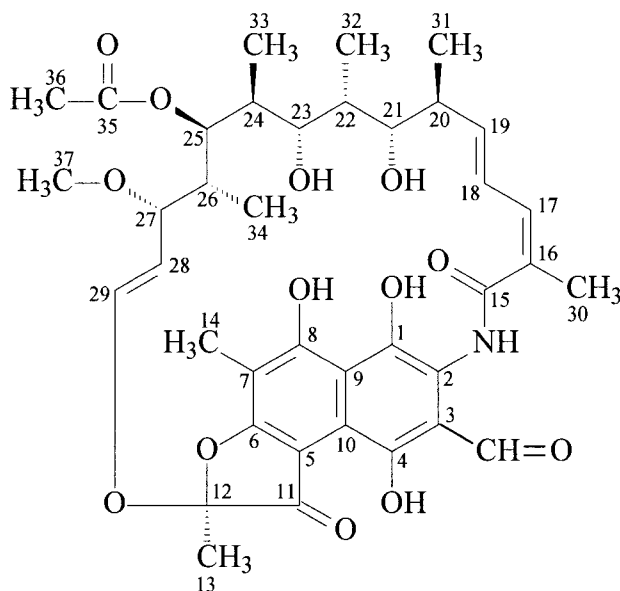
1. Pochodne ryfamycyny SV o wzorze 1,



Wzór 1

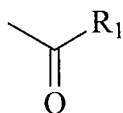
w którym R_1 oznacza aryl, ewentualnie mono- lub dipodstawiony alkilem C1÷C8 bądź mono- lub dihalogenoaryl albo R_1 oznacza CH_2-R_2 , gdzie R_2 stanowi alkil prosty lub rozgałęziony lub cykloalkil C5÷C6, alkenyl, aryl, ewentualnie podstawiony alkilem C1÷C8.

2. Sposób wytwarzania nowych pochodnych ryfamycyny SV o wzorze 1, znamienny tym, że 3-formyloryfamycynę SV o wzorze 2,



Wzór 2

poddaje się reakcji z ketonem o wzorze 3,



Wzór 3

w którym R₁ oznacza aryl, ewentualnie mono- lub dipodstawiony alkilem C₁-C₈ bądź mono- lub dihalogenoaryl albo R₁ oznacza CH₂-R₂, gdzie R₂ stanowi alkil prosty lub rozgałęziony lub cykloalkil C₅-C₆, alkenyl, aryl, ewentualnie podstawiony alkilem C₁-C₈, i z piroolidyną, w obecności kwasu jako katalizatora, przy czym reakcję prowadzi się w polarnym rozpuszczalniku organicznym.

3. Sposób według zastrz. 2, znamienny tym, że stosuje się nadmiar stechiometryczny zarówno ketonu o wzorze 3, jak i piroolidyny względem wyjściowego wsadu 3-formyloryfamycyny SV.
4. Sposób według zastrz. 2 albo 3 znamienny tym, że stosuje się około 10 moli ketonu o wzorze 3 i około 5 moli piroolidyny na 1 mol 3-formyloryfamycyny SV.
5. Sposób według zastrz. 2, znamienny tym, że jako katalizator stosuje się organiczne kwasy karboksylowe lub sulfonowe.
6. Sposób według zastrz. 2 albo 5, znamienny tym, że jako katalizator stosuje się kwas octowy.
7. Sposób według zastrz. 2, znamienny tym, że jako rozpuszczalnik stosuje się alkohole alifatyczne C₁-C₅.
8. Sposób według zastrz. 7, znamienny tym, że jako rozpuszczalnik stosuje się metanol.
9. Sposób według zastrz. 2, znamienny tym, że reakcję prowadzi się w temperaturze od 15°C do temperatury wrzenia rozpuszczalnika.
10. Sposób według zastrz. 9, znamienny tym, że reakcję prowadzi się w temperaturze 35-50°C.
11. Pochodne ryfamycyny SV określone w zastrzeżeniu 1 do zastosowania jako leki.
12. Zastosowanie pochodnych ryfamycyn SV określonych w zastrzeżeniu 1, do wytwarzania leków.
13. Zastosowanie według zastrz. 12 do wytwarzania leków o działaniu antybakteryjnym, antywirusowym i obniżających poziom cholesterolu.
14. Zastosowanie według zastrz. 12, znamiennie tym, że pochodne ryfamycyn SV stosuje się jako półprodukty do wytwarzania pochodnych ryfamycyn.

RZECZNIK PATENTOWY

dr inż. Grażyna Padée