



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan	961817
(51) Kv.1k.6 - Int.cl.6	
C 07D 477/14, A 61K 31/41	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	29.04.96
(24) Alkuperäisyys - Löpdag	25.10.94
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	28.06.96
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan	PCT/GB94/02347
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
29.10.93 GB 9322284 P	01.06.94 GB 9410929 P

(71) Hakija - Sökande

1. SmithKline Beecham Plc., New Horizons Court, Brentford, Middlesex TW8 9EP,
United Kingdom, (GB)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Coulton, Steven, c/o SmithKline Beecham Pharmaceuticals, Brockham Park, Betchworth,
Surrey RH3 7AJ, United Kingdom, (GB)
2. Hinks, Jeremy David, c/o SmithKline Beecham Pharmaceuticals, Brockham Park, Betchworth,
Surrey RH3 7AJ, United Kingdom, (GB)
3. Hunt, Eric, c/o SmithKline Beecham Pharmaceuticals, Brockham Park, Betchworth,
Surrey RH3 7AJ, United Kingdom, (GB)

(74) Asiamies - Ombud: Berggren Oy Ab

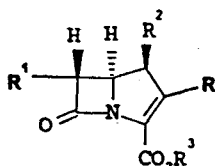
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

2-(pyratso1-3-yyli)karbapeneemijohdannaiset
2-(pyrazol-3-yl)karbapenemderivat

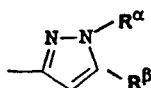
(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Yhdiste, jolla on kaava (I), jossa R on (a), jossa R^α on vety, valinnaisesti substituoitu (C₁₋₆)alkyyli tai valinnaisesti substituoitu aryyli; R^β on vety, valinnaisesti substituoitu (C₁₋₆)alkyyli tai valinnaisesti substituoitu aryyli; tai R^α ja R^β yhdessä muodostavat valinnaisesti substituoitun 5- tai 6-jäsenisen heterosyklisen renkaan, jossa on tai ei ole lisäheteroatomeja; R¹ on (C₁₋₆)alkyyli, joka on substituoitumaton tai substituoitu fluorilla, hydroksiryhmällä, joka voi olla suojattu jollakin helposti poistettavalla hydroksin suojarahmällä, tai aminoryhmällä, joka voi olla suojattu jollakin helposti poistettavalla aminon suojarahmällä; R² on vety tai metyyli, ja -CO₂R³ on karboksi tai karboksylaattianioni tai ryhmä R³ on jokin helposti poistettava karbaksin suojarahma. Kaavan (I) mukaisilla yhdisteillä, jotka kattavat niiden farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat tai farmaseuttisesti hyväksyttävät *in vivo* hydrolysoituvat esterit, on laaja bakteerienvastainen aktiivisuusspektri ja niiden stabiilius DHP-1:n suhteen on hyvä.

En förening med formeln (I), i vilken R är (a), vari R^α är väte, en valbart substituerad (C₁₋₆)alkyl eller en valbart substituerad aryl; R^β är väte, en valbart substituerad (C₁₋₆)alkyl eller en valbart substituerad aryl; eller R^α och R^β bildar tillsammans en valbart substituerad 5- eller 6-ledad heterocyklisk ring med eller utan andra heteroatomer; R¹ är en (C₁₋₆)alkyl, som är osubstituerad eller substituerad med fluor, en hydroxigrupp, som kan vara skyddad med en lätt eliminerbar skyddsgrupp för hydroxi, eller med en aminogrupp, som kan vara skyddad med en lätt eliminerbar skyddsgrupp för amino; R² är väte eller metyl, och -CO₂R³ är karboxi eller en karboxylatanjon eller gruppen R³ är en lätt eliminerbar skyddsgrupp för karboxi. Föreningarna med formeln (I) innefattande farmaceutiskt godtagbara salter eller farmaceutiskt godtagbara *in vivo* hydrolyserbara estrar därav har ett omfattande antibakteriskt aktivitets spektrum och en god stabilitet mot DHP-1.



(I)



(a)