



Patentdirektoratet

- (21) Patentansøgning nr.: 1930/86 (51) Int. Cl. 4: C 07 D 487
 (22) Indleveringsdag:.... 28 apr 1986 C 07 D 231
 (24) Løbedag:..... 28 apr 1986 C 07 F 9/65
 (41) Alm. tilgængelig:.... 20 jan 1987
 (62) Stamansøgningsnummer:.....
 (86) International ansøgning nr.:... -
 (86) International indleveringsdag:
 (85) Videreførselsdag:
 (30) Prioritet: 30 apr 1985 US 729021
 (71) Ansøger: ELI *LILLY AND COMPANY, Indianapolis, US
 (72) Opfinder: Louis Nickolaus *Jungheim,, US
 Sandra Kay *Sigmund,, US
 Richard Elmer *Holmes,, US
 Charles Jackson *Barnett,, US
 Robert John *Ternansky,, US
 (74) Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang & Boutard A/S, Adelgade 15, 1304, København K

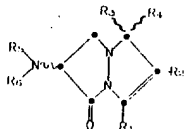
(54) 7-Substituerede bicycliske pyrazolidinoner, fremgangsmåde til fremstilling heraf og mellemprodukter til brug ved fremgangsmåden

(57) Sammendrag

Sammendrag

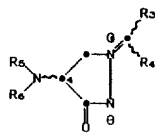
1930-86

7-substituerede bicycliske pyrazolidinoner med den almene formel:



hvor 1 af R₁ og R₂ er H, halogen eller en række substituentter og den anden af R₁ og R₂ er -COOR₁₄, hvori R₁₄ er H, en organisk eller uorganisk kation, en carboxy-beskyttelsesgruppe eller en ikke-toksisk, metabolisk labil esterdannende gruppe, og R₃ og R₄ - ens eller forskellige - er H, evt. substitueret alkyl, evt. substitueret arylalkyl, evt. substitueret phenyl eller -COOR₁₅, hvori R₁₅ er H eller en række grupper, og R₅ og R₆ er : 1) H, en amino-beskyttelsesgruppe eller en acylgruppe afledt

fra en C₁-C₃₀ carboxylsyre, idet mindst 1 af R₅ og R₆ er H, eller 2) taget sammen udgør en phthalimido-gruppe, samt farmaceutisk acceptable salte deraf, fremstilles ved en række i sig selv kendte metoder, idet man kan gå ud fra et ylid med formel:

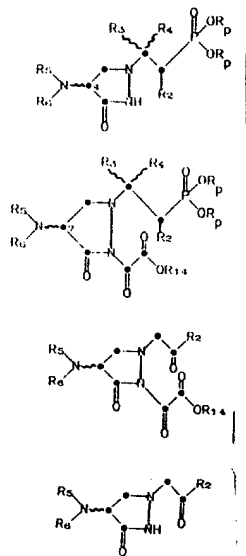


der omsættes med et acetylen-derivat

R₁
|
R₂

fortsættes

eller man kan anvende et af flere mellemprodukter:



idet man om ønsket omdanner slutprodukterne til farmaceutisk acceptable salte deraf. Forbindelserne har kraftig anti-mikrobiel virkning over gram-positive, gram-negative og visse syre-faste mikroorganismer og anvendes i farmaceutiske præparater til human- eller veterinærmedicin.