

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2016113755, 10.10.2014

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
11.10.2013 IN 3216/MUM/2013

(43) Дата публикации заявки: 16.11.2017 Бюл. № 32

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 11.05.2016(86) Заявка РСТ:
IB 2014/065195 (10.10.2014)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2015/052682 (16.04.2015)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,
ООО "Юридическая фирма Городиский и
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

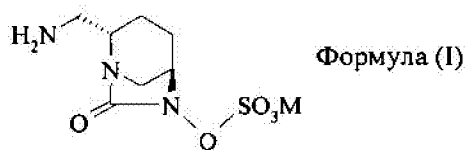
ВОКХАРДТ ЛИМИТЕД (IN)

(72) Автор(ы):

**ДЕШПАНДЕ Прасад Кешав (IN),
ПАВАР Шиваджи Сампатрао (IN),
БХАВСАР Сатиш (IN),
ЙЕОЛЕ Равиндра Даттатрая (IN),
БХАГВАТ Сахин (IN),
ПАТЕЛЬ Махеш Витхалбхай (IN)**(54) **АЗОТСОДЕРЖАЩИЕ СОЕДИНЕНИЯ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ**

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы (I):



или стереоизомер или фармацевтически приемлемое производное указанного соединения; где М представляет собой катион.

2. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что М представляет собой водород, натрий или калий.

3. Соединение по п. 1, представляющее собой (2S, 5R)-6-сульфоокси-2-(аминометил)-7-оксо-1,6-диаза-бицикло[3.2.1]октан или стереоизомер или фармацевтически приемлемое производное указанного соединения.

4. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по любому из пп. 1-3.

5. Фармацевтическая композиция по п. 4, дополнительно содержащая по меньшей мере один ингибитор бета-лактамазы или его фармацевтически приемлемое производное.

6. Фармацевтическая композиция по п. 4, дополнительно содержащая по меньшей мере один антибактериальный агент или его фармацевтически приемлемое производное.

7. Фармацевтическая композиция по п. 6, отличающаяся тем, что антибактериальный

агент выбран из группы, состоящей из аминогликозидов, ансамицинов, карбацефемов, цефалоспоринов, цефамицинов, линкозамидов, липопептидов, макролидов, монобактамов, нитрофуранов, пенициллинов, пенемов, карбапенамов, полипептидов, хинолонов, сульфонамидов, тетрациклинов или оксазолидиноновых антибактериальных агентов.

8. Фармацевтическая композиция по п. 6, отличающаяся тем, что указанный антибактериальный агент представляет собой бета-лактамный антибактериальный агент.

9. Фармацевтическая композиция по п. 6, отличающаяся тем, что антибактериальный агент выбран из группы, состоящей из цефалотина, цефалоридина, цефаклора, цефадроксила, цефамандола, цефазолина, цефалексина, цефрадина, цефтизоксима, цефокситина, цефактрила, цефотиама, цефотаксима, цефсулодина, цефоперазона, цефменоксима, цефметазола, цефалоглицина, цефоницида, цефодизима, цефпирома, цефтазидима, цефтриаксона, цефпирамида, цефбуперазона, цефозопрана, цефепима, цефоселиса, цефлупренама, цефузолама, цефпимизола, цефклидина, цефиксима, цефтибутена, цефдинира, ауксетила цефподоксима, проксетила цефподоксима, пивоксила цефтерама, пивоксила цефетамета, пивоксила цефкапена, пивоксела цефдиторена, цефуроксима, ауксетила цефуроксима, лоракарбацефа, цефтаролина, цефтолозана, латамоксефа, пиперациллина, эртапенема, дорипенема, меропенема и имипенема.

10. Фармацевтическая композиция по п. 5, отличающаяся тем, что указанный ингибитор бета-лактамазы выбран из группы, состоящей из сульбактама, тазобактама, клавулановой кислоты или фармацевтически приемлемого производного указанных соединений.

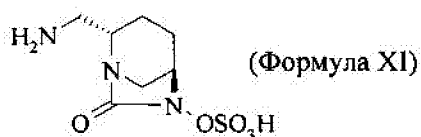
11. Фармацевтическая композиция по п. 5, содержащая (а) (2S,5R)-6-сульфоокси-2-(аминометил)-7-оксо-1,6-диаза-бицикло[3.2.1]октан или стереоизомер или фармацевтически приемлемое производное указанного соединения и (b) сульбактам или его фармацевтически приемлемое производное.

12. Применение соединения по любому из пп. 1-3 для получения лекарственного средства для лечения бактериальной инфекции у субъекта.

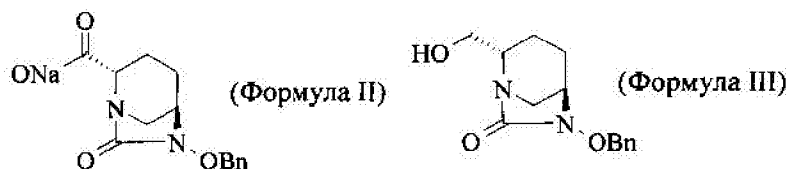
13. Применение фармацевтической композиции по п. 4 для лечения бактериальной инфекции у субъекта.

14. Применение фармацевтической композиции по любому из пп. 5 или 6 для лечения бактериальной инфекции у субъекта.

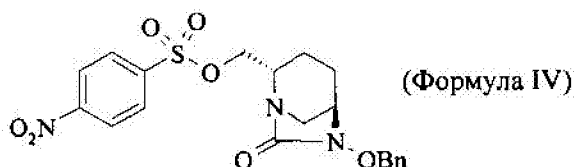
15. Способ получения (2S,5R)-6-сульфоокси-2-(аминометил)-7-оксо-1,6-диаза-бицикло[3.2.1]октана формулы (XI), включающий:



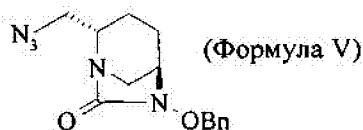
(а) обеспечение превращения соединения формулы (II) в соединение формулы (III);



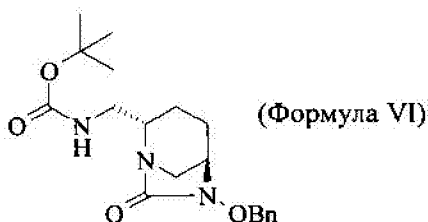
(b) обеспечение взаимодействия соединения формулы (III) с п-нитрофенилсульфонил хлоридом в присутствии основания с получением соединения формулы (IV);



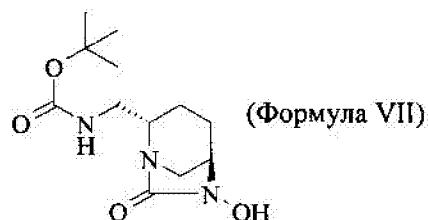
(с) обеспечение взаимодействия соединения формулы (IV) с азидом натрия с получением соединения формулы (V);



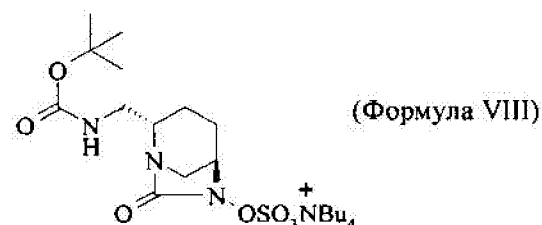
(d) обеспечение превращения соединения формулы (V) в соединение формулы (VI);



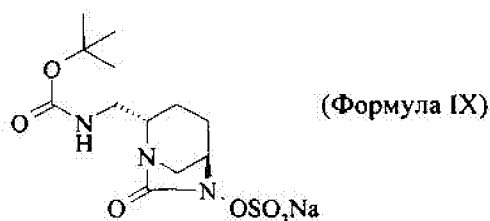
(е) обеспечение гидрогенолиза соединения формулы (VI) с получением соединения формулы (VII);



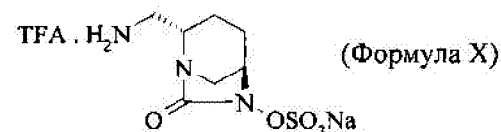
(f) обеспечение взаимодействия соединения формулы (VII) с сульфонирующим агентом с последующим взаимодействием с гидросульфатом тетрабутиламмония с получением соединения формулы (VIII);



(g) обеспечение превращения соединения формулы (VIII) в соединение формулы (IX);



(h) обеспечение взаимодействия соединения формулы (IX) с трифторуксусной кислотой в подходящем растворителе с получением соединения формулы (X); и



(i) обеспечение превращения соединения формулы (X) в соединение формулы (XI).