

Ans.nr.: 0390/85

Indleveret: 29 jan 1985

Løbedag: 29 jan 1985

Alm. tilgængelig: 13 sep 1985

Prioritet: 30 jan 1984 US 575354

11 dec 1984 US 679192

***PFIZER INC.; New York, US.**

Opfinder: Yuhpyng Liang *Chen; US.

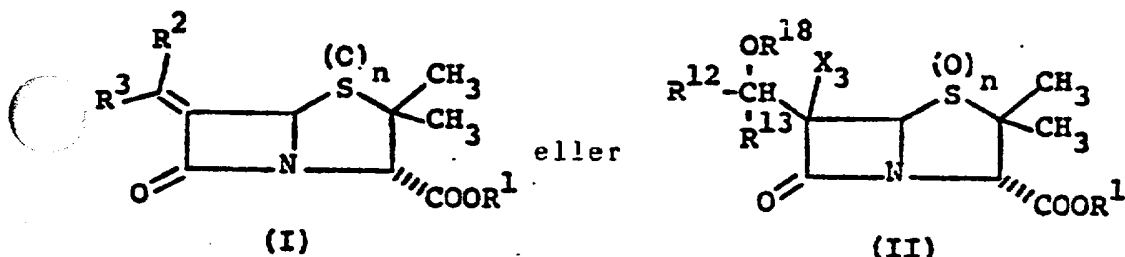
Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang & Boutard

6-Methylen- og 6-hydroxymethyl-penicillansyrederivater og farmaceutiske præparater til behandling af bakterieinfektioner

SAMMENDRAG

390-85

6-Methylen- og 6-hydroxymethyl-penicillansyrederivater
med formlen



hvori $n = 0, 1$ eller 2 , $X_3 = H$ eller Br , R^1 er H , en rest af visse carboxylbeskyttelsesgrupper eller en rest af en in vivo let hydrolyserbar estergruppe; en af R^{12} og R^{13} er H og den anden vinyl, visse aryl-, arylthio-, alkylthio- eller alkylsulfonylgrupper eller visse heterocyclyl-, aminomethyl-, thiocarboxamido- eller amidinogrupper, en af R^2 og R^3 er H og den anden som angivet alternativt for R^{12}/R^{13} , eller Cl eller CH_2OH , og R^{18} er H eller visse acylgrupper, samt farmaceutisk acceptable syreadditionssalte eller carboxylatsalte deraf, fremstilles ved en række kendte reaktioner.

De forbindelser, hvori R^1 er H eller resten af en ester-gruppe, som er let hydrolyserbar in vivo, er kraftige inhibitorer for mikrobielle β -lactamaser, og i kombination med β -lactamantibiotica forstærker de den antibiotiske effektivitet af disse. Disse forbindelser, hvori R^1 er resten af en carboxylbeskyttende gruppe, er mellemprodukter ved fremstillingen af de β -lactamase-inhiberende forbindelser.