



SUOMI-FINLAND  
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan	952049
(51) Kv.1k.6 - Int.cl.6	
C 07D 401/04, C 07D 215/56	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	28.04.95
(24) Alkuperäpäivä - Löpdag	22.10.93
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	28.04.95
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan	PCT/US93/10091
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
	30.10.92 US 968960 P

(71) Hakija - Sökande

1. The Procter & Gamble Company, One Procter & Gamble Plaza, Cincinnati, OH 45202, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Demuth Jr., Thomas Prosser, 10800 Stockbridge Road, Montgomery, OH 45249, USA, (US)  
2. White, Ronald Eugene, 200 Bent Tree Drive, Apartment 1-C, Fairfield, OH 45014, USA, (US)

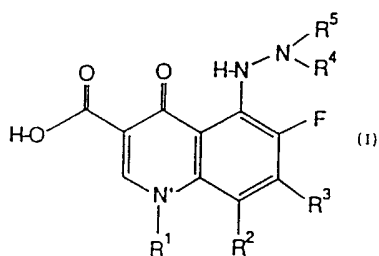
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Antimikrobiset 5-hydratsino-kinolonijohdannaiset  
Antimikrobiella 5-hydrazino-kinolonderivat

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Antimikrobisia 5-(N-heterosubstituoitu amino)kinoloniyhdisteitä, joilla on yleinen kaava (I),



jossa (1) R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> ja R<sup>3</sup> muodostavat erilaisia kinoloneja ja läheisiä heterosyklisiä rakenteita, jotka ovat samantapaisia kuin ne, joilla alalla tiedetään olevan antimikrobista aktiivisuutta; ja (2) (a) R<sup>4</sup> ja R<sup>5</sup> ovat toisistaan riippumatta vety, alempi alkyylili, sykloalkyyli, heteroalkyyli tai -C(=O)-X-R<sup>8</sup>, jossa X on kovalenttinen sidos, N, O tai S, ja R<sup>8</sup> on alempi alkyylili, alempi alkenyyli, aryylialkyyli, karbosyklinen rengas tai heterosyklinen rengas; tai (b) R<sup>4</sup> ja R<sup>5</sup> yhdessä muodostavat heterosyklisen renkaan, joka sisältää typen, johon ne ovat liittyneet; ja niiden farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat ja biohydrolysoituvat esterit ja solvaatit.

Uppfinningen avser antimikroba 5-(N-heterosubstituerade amino)kinolonföreningar med den allmänna formeln (I), vari (1) R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> och R<sup>3</sup> bildar tillsammans olika kinoloner och besläktade heterocykliska byggnader, vilka är likadana som de som man vet att har antimikrobisk aktivitet; och (2) (a) R<sup>4</sup> och R<sup>5</sup> är oberoende av varandra väte, lägre alkyl, cykloalkyl, heteroalkyl eller -C(=O)-X-R<sup>8</sup>, vari X är en kovalent bindning, N, O eller S, och R<sup>8</sup> är lägre alkyl, lägre alkenyl, arylalkyl, karbocyklisk ring eller heterocyklisk ring; eller (b) R<sup>4</sup> och R<sup>5</sup> bildar tillsammans en heterocyklisk ring, som innehåller kväve, till vilken de är bundna; och deras farmaceutiskt godtagbara salter och biologiskt hydrolyserbara estrar och solvat.

