

[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG



(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan 973207

(51) Kv.lk.6 - Int.kl.6

C 07D 401/04, 471/04

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 01.08.1997

(24) Alkupäivä - Löpdag 01.02.1996

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 01.10.1997

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/JP96/00208

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet

02.02.1995 JP 7-15614 P 07.02.1995 JP 7-19478 P  
07.02.1995 JP 7-19481 P

SUOMI-FINLAND  
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

(71) Hakija - Sökande

1. Daiichi Pharmaceutical Co., Ltd, 14-10, Nihonbashi 3-chome, Chuo-ku, Tokyo 103, Japan, (JP)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Takemura, Makoto, c/o Daiichi Pharmaceuticals Co., Ltd, Tokyo R&D Center, 16-13, Kitakasai, 1-chome, Edogawa-ku, Tokyo 134, Japan, (JP)
2. Kimura, Youichi, c/o Daiichi Pharmaceuticals Co., Ltd, Tokyo R&D Center, 16-13, Kitakasai, 1-chome, Edogawa-ku, Tokyo 134, Japan, (JP)
3. Kawakami, Katsuhiro, c/o Daiichi Pharmaceuticals Co., Ltd, Tokyo R&D Center, 16-13, Kitakasai, 1-chome, Edogawa-ku, Tokyo 134, Japan, (JP)
4. Kimura, Kenichi, c/o Daiichi Pharmaceuticals Co., Ltd, Tokyo R&D Center, 16-13, Kitakasai, 1-chome, Edogawa-ku, Tokyo 134, Japan, (JP)
5. Ohki, Hitoshi, c/o Daiichi Pharmaceuticals Co., Ltd, Tokyo R&D Center, 16-13, Kitakasai, 1-chome, Edogawa-ku, Tokyo 134, Japan, (JP)
6. Matsuhashi, Norikazu, c/o Daiichi Pharmaceuticals Co., Ltd, Tokyo R&D Center, 16-13, Kitakasai, 1-chome, Edogawa-ku, Tokyo 134, Japan, (JP)
7. Kawato, Haruko, c/o Daiichi Pharmaceuticals Co., Ltd, Tokyo R&D Center, 16-13, Kitakasai, 1-chome, Edogawa-ku, Tokyo 134, Japan, (JP)

(74) Asiamies - Ombud: Kolster Oy Ab, Iso Roobertinkatu 23, 00120 Helsinki

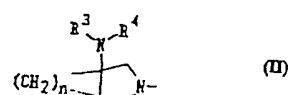
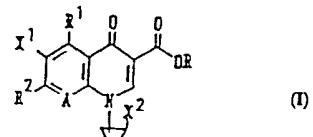
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Heterosyklisiä yhdisteitä  
Heterocycliska föreningar

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

$N_1$ - (halogeenisyklopropyyli)-substituoituja pyridonikarboksylihappojohdannaisia, jotka esitetään yleisellä kaavalla (I), heterosyklisiä yhdisteitä, jotka ovat käyttökelpoisia bakteerien vastaisina aineina, joissa  $X^1$  merkitsee halogenia tai vetyä;  $X^2$  merkitsee halogenia;  $R^1$  merkitsee vetyä, hydroksia, tiolia, halogeenimetyyliä, aminoaa, alkyyliä tai alkoksia;  $R^2$  merkitsee ryhmää, jolla on yleinen kaava (II) (jossa  $R^3$  ja  $R^4$  merkitsevät kumpikin vetyä tai alkyyliä; ja n merkitsee kokonaislukua 1 tai 2); A merkitsee typpeää tai ryhmää, jolla on yleinen kaava (III), (jossa  $X^3$  merkitsee halogenia, syanoa, aminoaa, alkyyliä, halogeenimetyyliä, alkoksia tai halogeenimetoksia); ja R merkitsee vetyä, fenyylia, asetoksimetyyliä, pivaloyylioksimetyyliä, etoksikarbonyyliä, koliinia,

dimetyyliaminoetyyliä, 5-indanyyliä, ftalidinyyliä, 5-alkyyli-2-okso-1,3-dioksolyyylimetyyliä, 3-asetoksi-2-oksobutyylia, alkyyliä, alkoximetyyliä tai fenyylialkyyliä.



$N_1$ - (halogencyklopropyl)-substituerade pyridonkarboxylsyraderivat med den allmänna formeln (I), som är heterocycliska föreningar användbara som antibakteriella läkemedel, vari  $X^1$  är halogen eller väte;  $X^2$  är halogen;  $R^1$  är väte, hydroxi, tiol, halogenmetyl, amino, alkyl eller alkoxi;  $R^2$  är en grupp med den allmänna formeln (II) (vari  $R^3$  och  $R^4$  är vardera väte eller alkyl; och n är ett heltalet 1 eller 2); A är kväve eller en grupp med den allmänna formeln (III) (vari  $X^3$  är halogen, cyano, amino, alkyl, halogenmetyl, alkoxi eller halogenmetoxi); och R är väte, fenyl, acetoximetyl, pivaloyloximetyl, etoxikarbonyl, kolin, dimethylaminoethyl, 5-indanyl, ftalidinyl, 5-alkyl-2-oxo-1,3-dioxol-4-ylmetyl, 3-acetoxy-2oxobutyl, alkyl, alkoximetyl eller fenylalkyl.