



SUOMI—FINLAND  
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

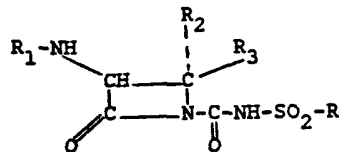
PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN  
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan	863890
(51) Kv. & Int. Cl. C 07 D 401/12	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	26.09.86
(23) Alkuperä - Löpdeg	
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	27.03.87
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan	26.09.85 US 780479
(30) Etuoikeus - Prioritet	

- (71) Hakija/Sökande: E.R. Squibb & Sons, Inc., Lawrenceville-Princeton Road, Princeton, New Jersey, USA
- (72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Breuer, Hermann 2. Treuner, Uwe D. 3. Koster, William H. 4. Zahler, Robert
- (74) Asiamies/Ombud: Kolster
- (54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: 2-okso-1-//substituoitu sulfonyyli)amino/-karbonyyli/atsetidiinejä. 2-oxo-1-//(substituerad sulfonyl) amino/-karbonyl/azetidiner.

(57) Tiivistelmä

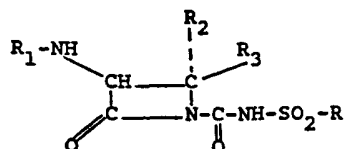
Keksinnön kohteena on menetelmä antibakteerisen vaikutuksen omaavien 2-atsetidinonien valmistamiseksi, joilla on kaava



jossa R on substituoitu [(1,4-dihydro-5-hydroksi-4-okso-2-pyridiinyli)karbonyyli] aminoryhmä, R<sub>1</sub> on asyyliiryhmä, ja R<sub>2</sub> ja R<sub>3</sub> ovat kumpikin vety, alkyyli, alkenyyli, alkynyyli, sykloalkyyli, fenyyli, tai 4-, 5-, 6- tai 7-jäseninen heterosyklinen yhdiste tai toinen ryhmistä R<sub>2</sub> ja R<sub>3</sub> on vety ja toinen on atsidio, mono-, di- tai trihalogeenimetyyli, alkoksikarbonyyli, 2-fenyylietenyyli tai -etyynyli, karboksyyli, X<sub>1</sub> on atsidio, amino, hydroksi, karboksyyli, alkoksikarbonyyli, alkanoyyliamino, fenyylikarbonyyliamino, alkyylisulfonyylioksi, fenyyli-sulfonyylioksi, fenyyli, syaani, X<sub>2</sub> on alkyyli, fenyyli, fenyylialkyyli, alkanoyyli, fenyylialkanoyyli, fenyylikarbonyyli, tai heteroaryylikarbonyyli; toinen ryhmistä X<sub>3</sub> ja X<sub>4</sub> on vety ja toinen on vety tai alkyyli, tai X<sub>3</sub> ja X<sub>4</sub> muodostavat hiiliatomin kanssa sykloalkyyli-ryhmän; X<sub>5</sub> on formyyl, alkanoyyli, fenyyli-karbonyyli, fenyylialkyylikarbonyyli, karboksyyli, alkoksikarbonyyli, aminokarbonyyli, tai syaani; X<sub>6</sub> ja X<sub>7</sub> ovat kumpikin vety, alkyyli tai fenyyli, tai X<sub>6</sub> on vety ja X<sub>7</sub> on amino, alkanoyyli-amino tai alkoksi, tai X<sub>6</sub> ja X<sub>7</sub> muodostavat typpi-atomin kanssa 4-, 5-, 6- tai 7-jäsenisen heterosyklisen yhdisteen; ja A on -CH=CH-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-NH- tai -CH<sub>2</sub>-; jolloin m on 0, 1 tai 2.

(57) Sammandrag

Uppfinningen avser ett förfarande för framställning av antibakteriellt aktiva 2-azetidioner med formeln:



vari R är en substituerad  $\left[ \begin{array}{l} 1,4\text{-dihydro-5-hydroxi-4-oxo-2-pyridi-} \\ \text{nyl} \end{array} \right]$ karbonylaminogrupp,  $R_1$  är en acylgrupp, och  $R_2$  och  $R_3$  be-  
tecknar vardera väte, alkyl, alkenyl, alkynyl, cykloalkyl, fenyl,  
eller en 4-, 5-, 6- eller 7-komponentig, heterocyklisk förening  
eller den ena av grupperna  $R_2$  och  $R_3$  är väte och den andra är  
azido, mono-, di- eller trihalogenmetyl, alkoxikarbonyl, 2-fenyl-  
etenyl eller -etynyl, karboxyl,  $X_1$  är azido, amino, hydroxi, kar-  
boxyl, alkoxikarbonyl, alkanoylamino, fenylkarbonylamino, alkyl-  
sulfonyloxi, fenylsulfonyloxi, fenyl, cyan,  $X_2$  är alkyl, fenyl,  
fenylalkyl, alkanoyl, fenylalkanoyl, fenylkarbonyl eller hetero-  
arylkarbonyl; någondera av grupperna  $X_3$  och  $X_4$  är väte och den  
andra är väte eller alkyl, eller  $X_3$  och  $X_4$  bildar tillsammans med  
kolatomen en cykloalkylgrupp;  $X_5$  är formyl, alkanoyl, fenylkarbo-  
nyl, fenylalkylkarbonyl, karboxyl, alkoxikarbonyl, aminokarbonyl  
eller cyan;  $X_6$  och  $X_7$  är vardera väte, alkyl eller fenyl, eller  
 $X_6$  är väte och  $X_7$  är amino, alkanoylamino eller alkoxi, eller  $X_6$   
och  $X_7$  bildar tillsammans med kväveatomen en 4-, 5-, 6- eller  
7-komponentig, heterocyklisk förening; och A är  $-\text{CH}=\text{CH}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_m-$ ,  
 $-(\text{CH}_2)_m-\text{O}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_m-\text{NH}-$  eller  $-\text{CH}_2-$ ; varvid m är 0, 1 eller 2.