

P 0 3 0 2 4 6 4



SZUBSZTITUÁLT 3,4-DIHIDRO-PIRIDO[1,2-a]PIRIMIDIN-SZÁRMAZÉKOK; ELJÁRÁS AZ  
ELŐNLLITÁSUKRA, ALKALMAZÁSUK ÉS EZEKET TARTALMAZÓ GYÓGYSZERKÉSZÍTMÉNYEK

GRÜNENTHAL GmbH, Zieglerstrasse 6, 52078 Aachen, Németország

A bejelentés napja: 2001. 10. 10.

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

Elsőbbsége: 2000. 10. 13. (DE; 100 50 662.3)

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/EP01/11700

A nemzetközi közzététel száma: WO 02/30933 A1

### K i v o n a t

A találmány (I) általános képletű szubsztituált 3,4-dihidro-pirido[1,2-a]pirimidin-származékokra és azok gyógyászatilag alkalmazható sóira vonatkozik - a képletben

$R^1$  és  $R^2$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,  $-OR^{10}$  csoport,  $-SH$  csoport,  $-SR^{10}$  csoport, vagy 1-12 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, aril-, heteroaril-, (1-6 szénatomos alkil)-aril- vagy (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport; mimellett  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik hidrogénatomot jelent, és a másik hidrogénatomtól eltérő jelentésű, azzal azonban, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik arilcsoportot jelent, akkor a másik hidrogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy 1-12 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, aril-, heteroaril-, (1-6 szénatomos alkil)-aril- vagy (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^3$  és  $R^4$  közül legalább az egyik hidrogénatomot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt  $W$  csoportot alkot, míg  $R^1$  és  $R^2$ , valamint  $R^3$  és  $R^4$  közül a másik hidrogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, ahol

$W$   $\alpha'-(CH_2)_n-\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 vagy 10),  $\alpha'-CH=CH-$   
 $-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH=CH-CH_2-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH_2-CH=CH-CH_2\beta'$  csoportot,  
 $\alpha'-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-O-(CH_2)_n-\beta'$  csoportot (amelyben  $n$



értéke 2, 3, 4, 5 vagy 6), (A) képletű csoportot, (B) képletű csoportot, (C) képletű csoportot (amelyben X jelentése  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{O}-$  vagy  $-\text{S}-$ ), (D) képletű csoportot vagy (E) képletű csoportot jelent, amely csoportok az  $\alpha'$ -vel jelölt végükkel az (I) általános képletben  $\alpha$ -val jelölt szénatomhoz, a  $\beta'$ -vel jelölt végükkel pedig az (I) általános képletben  $\beta$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak;

$\text{R}^5$  jelentése  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{11}$  csoport,  $-\text{COOH}$  csoport,  $-\text{COOR}^{12}$  csoport, 1-12 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, aril-, heteroaril-, (1-6 szénatomos alkil)-aril- vagy (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport; és

$\text{R}^6$ ,  $\text{R}^7$ ,  $\text{R}^8$  és  $\text{R}^9$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, amino-,  $\text{NH}(1-6 \text{ szénatomos alkil})$ ,  $\text{N}(1-6 \text{ szénatomos alkil})_2$ ,  $\text{NH}[(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}]$ ,  $\text{N}[(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}]_2$ ,  $\text{NHR}^{13}$ , nitro-, hidroxil-, merkpto-,  $\text{O}(1-8 \text{ szénatomos alkil})$ -,  $\text{S}(\text{O})_p(1-8 \text{ szénatomos alkil})$ -,  $\text{O}$ -aril-,  $\text{S}(\text{O})_q$ -aril-  $\text{O}(1-6 \text{ szénatomos alkil})$ -aril-,  $\text{S}(\text{O})_r(1-6 \text{ szénatomos alkil})$ -aril-,  $-\text{COOH}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{14}$ , 1-12 szénatomos alkil-,  $\text{CF}_3$ , 3-8 szénatomos cikloalkil-, 3-7 tagú heterociklil-, aril- vagy heteroaril-csoport; vagy

$\text{R}^8$  és  $\text{R}^9$  jelentése a fenti, és  $\text{R}^6$  és  $\text{R}^7$  együtt Q csoportot alkot, ahol Q egy  $\gamma'\text{-CR}^{15}=\text{CR}^{16}-\text{CR}^{17}=\text{CR}^{18}-\delta'$  csoportot jelent, vagy

$\text{R}^7$  és  $\text{R}^8$  jelentése a fenti, és  $\text{R}^6$  és  $\text{R}^9$  együtt T csoportot alkot, ahol T egy  $\gamma'\text{-CR}^{19}=\text{CR}^{20}-\text{CR}^{21}=\text{CR}^{22}-\varepsilon'$  vagy  $\gamma'\text{-N}=\text{CR}^{20}-\text{CR}^{21}=\text{N}-\varepsilon'$  csoportot jelent, vagy

$\text{R}^6$  és  $\text{R}^7$  jelentése a fenti, és  $\text{R}^8$  és  $\text{R}^9$  együtt U csoportot alkot, ahol

U egy  $\eta'\text{-CR}^{19}=\text{CR}^{20}-\text{CR}^{21}=\text{CR}^{22}-\varepsilon'$  csoportot jelent.

A fenti meghatározások kiterjednek a vegyületek előállítására, alkalmazására és a vegyületek tartalmazó gyűjtemény készítményekre.

P 0 3 0 2 4 6 4



Képviselő: Dr.Jalovszky Györgyné ügyvéd

Társképviselő: Dr.Miskolczi Mária ügyvéd

A2

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

316/98

SZUBSZTITUÁLT 3,4-DIHIDRO-PIRIDO[1,2-a]PIRIMIDIN-SZÁRMAZÉKOK, ELJÁRÁS  
AZ ELŐÁLLÍTÁSUKRA, ALKALMAZÁSUK ÉS EZEKET TARTALMAZÓ  
GYÓGYSZERKÉSZÍTMÉNYEK

GRÜNENTHAL GmbH, Zieglerstrasse 6, 52078 Aachen, Németország

Feltalálók:

GERLACH Matthias, Pfarrgasse 1, 63636 Brachtal, Németország

MAUL Corinna, Oppenhoffallee 83-85, 52066 Aachen, Németország

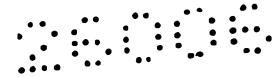
JAGUSCH Utz-Peter, Bismarckstrasse 161, 52066 Aachen, Németország

A bejelentés napja: 2001. 10. 10.

Elsőbbsége: 2000. 10. 13. (DE; 100 50 662.3)

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/EP01/11700

A nemzetközi közzététel száma: WO 02/30933 A1



A találmány szubsztituált 3,4-dihidro-pirido[1,2-a]pirimidin-származékokra, azok előállítására, az azokat tartalmazó anyagkönyvtárakra, valamint az azokat tartalmazó gyógyszerekre és gyógyászati készítményekre vonatkozik. A találmány tárgyát képezi továbbá a vegyületek felhasználása fájdalom, vizeletvisszatartási képtelenség, viszketegség, tinnitus aurium és/vagy hasmenés kezelésére alkalmas gyógyszerek gyártásához.

Az orvosi gyakorlatban nagy jelentősége van a krónikus és nemkrónikus fájdalmak kezelésének. Világszerte igény van olyan hatékony fájdalomterápiák iránt, amelyekkel a krónikus és nemkrónikus fájdalmak betege szabottan és célravezően kezelhetők, amin a betegek sikeres és kielégítő kezelése értendő.

Az erős - legerősebb fájdalmak kezelésére jól alkalmazhatók a klasszikus opioidok, köztük a morfin; felhasználhatóságukat azonban korlátozzák az opioidok közismert mellékhatásai (például légzésdepresszió, hányás, szédülés, székrekedés és hűség kialakulása). Ezen kívül ezek az anyagok neuropátiás és incidenciális fájdalmak kezelésében, amelyekben elsősorban a tumoros betegek szenvednek, kevésbé hatásosak.

A találmány célja olyan analgetikus hatású vegyületek rendelkezésre bocsátása, amelyek a fájdalom terápiajában - elsősorban a krónikus és neuropátiás fájdalmak kezelésében - hasznosíthatók. További követelmény, hogy ezek a vegyületek a  $\mu$ -receptor-affinitású opioidok adagolásakor fellépő mellékhatásokat (például émelygést, hányást, függőséget, légzésdepressziót vagy székrekedést) lehetőleg ne idézzék elő.

A találmány értelmében a fenti célokat (I) általános képletű, analgetikus hatással rendelkező vegyületekkel érjük el. A találmány szerinti vegyületek tehát (I) általános képletű szubsztituált 3,4-dihidro-pirido[1,2-a]pirimidin-származékok és azok gyógyászati alkalmazható sói - a képletben



$R^1$  és  $R^2$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,  $-OR^{10}$  csoport,  $-SH$  csoport,  $-SR^{10}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik hidrogénatomot jelent, és a másik hidrogénatomtól eltérő jelentésű, azzal azonban, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik arilcsoportot jelent, akkor a másik hidrogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztitu-



átlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^3$  és  $R^4$  közül legalább az egyik hidrogénatomot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt  $W$  csoportot alkot, míg  $R^1$  és  $R^2$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, és  $R^3$  és  $R^4$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, ahol  $W$   $\alpha'-(CH_2)_n-\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 vagy 10),  $\alpha'-CH=CH-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH=CH-CH_2-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH_2-CH=CH-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-O-(CH_2)_n-\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 2, 3, 4, 5 vagy 6), (A) képletű csoportot, (B) képletű csoportot, (C) képletű csoportot (amelyben  $X$  jelentése  $-CH_2-$ ,  $-O-$  vagy  $-S-$ ), (D) képletű csoportot vagy (E) képletű csoportot jelent, amely csoportok az  $\alpha'$ -vel jelölt végükkel az (I) általános képletben  $\alpha$ -val jelölt szénatomhoz, a  $\beta'$ -vel jelölt végükkel pedig az (I) általános képletben  $\beta$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak;

$R^5$  jelentése  $-C(=O)R^{11}$  csoport,  $-COOH$  csoport,  $-COOR^{12}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítet-



len, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport; és

$R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub>, NHR<sup>13</sup>, nitro-, hidroxil-, merkaptó-, O-(1-8 szénatomos alkil)- vagy S(O)<sub>p</sub>-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és p értéke 0, 1 vagy 2; O-aril- vagy S(O)<sub>q</sub>-aril-csoport, amelyekben az arilcsoportok szubsztituálatlanok vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak lehetnek, és q értéke 0, 1 vagy 2; O-(1-6 szénatomos alkil)-aril- vagy S(O)<sub>r</sub>-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, amelyekben az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok, míg az arilcsoportok szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és r értéke 0, 1 vagy 2; -COOH csoport; -C(=O)R<sup>14</sup> csoport; egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport; CF<sub>3</sub> csoport; telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-csoport; 3-, 4-, 5-, 6- vagy 7-tagú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heterociklil-csoport; szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport; vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport; vagy

$R^8$  és  $R^9$  jelentése a fenti, és  $R^6$  és  $R^7$  együtt **Q** csoportot alkot, ahol



**Q** egy  $\gamma'$ -CR<sup>15</sup>=CR<sup>16</sup>-CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>- $\delta'$  csoportot jelent, ami a  $\delta'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\delta$ -val jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódik; vagy

**R<sup>7</sup>** és **R<sup>8</sup>** jelentése a fenti, és **R<sup>6</sup>** és **R<sup>9</sup>** együtt **T** csoportot alkot, ahol

**T** egy  $\gamma'$ -CR<sup>19</sup>=CR<sup>20</sup>-CR<sup>21</sup>=CR<sup>22</sup>- $\varepsilon'$  vagy  $\gamma'$ -N=CR<sup>20</sup>-CR<sup>21</sup>=N- $\varepsilon'$  csoportot jelent, amelyek az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végükénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végükénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak; vagy

**R<sup>6</sup>** és **R<sup>7</sup>** jelentése a fenti, és **R<sup>8</sup>** és **R<sup>9</sup>** együtt **U** csoportot alkot, ahol

**U** egy  $\eta'$ -CR<sup>19</sup>=CR<sup>20</sup>-CR<sup>21</sup>=CR<sup>22</sup>- $\varepsilon'$  csoportot jelent, ami az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\eta'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\eta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódik;

és a fenti meghatározásokban szereplő általános szimbólumok közül

**R<sup>10</sup>** jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

**R<sup>11</sup>** jelentése amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>,

NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos



alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{12}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{13}$  -C(=O)CH<sub>3</sub> csoportot, -C(=O)fenil-csoportot, -C(=O)O-terc-butil- (t-BOC) csoportot vagy más szokásos amino-védőcsoportot jelent;

$R^{14}$  jelentése hidrogénatom, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy



egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkilcsoportot tartalmazó O-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált cikloalkilcsoportot tartalmazó O-(3-8 szénatomos cikloalkil)-csoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoportot tartalmazó O-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített O-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  és  $R^{18}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport; és

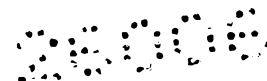
$R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$  és  $R^{22}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport.

Az (I) általános képletű vegyületek egyes képviselőit a szakirodalomban már ismertették, anélkül azonban, hogy ezek fájdalom, vizeletvisszatartási képtelenség, viszketegség, tinnitus aurium és/vagy hasmenés kezelésére alkalmas gyógyszerkészítményekben vagy ilyen gyógyszerkészítmények gyártásában való felhasználásáról



említést tettek volna. A szakirodalomban ismertetett vegyületeket - az azokat leíró irodalmi helyekkel együtt - az alábbiakban soroljuk fel: 6-klór-2-(4-nitro-fenil)-4-fenil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin, 2-(4-nitro-fenil)-4-fenil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin, 2-(2-nitro-fenil)-4-fenil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin, 2-(4-nitro-fenil)-4-(4-tolil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin és 2-(4-klór-fenil)-4-(4-tolil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin [MA. Abdel-Rahman: *Revue Roumaine de Chimie* **40**, 535-540 (1995)]; 4-etoxi-2-fenil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin és 4-etoxi-2-(2-hidroxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin [L.S. Povarov: *Chem. Heterocycl. Comp.* **15**, 1369 (1979); *Id. Chem. Abstr.* **92**, 110889 (1980)], 4-etoxi-2-propil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin, 4-propil-2,3,3a,4,5,10a-hexahidro-2H-pirido[1,2-a]furo[3,2-e]pirimidin és 4-propil-2,4,4a,5,6,11a-hexahidro-2H-pirido[1,2-a]pirano[3,2-e]pirimidin [A.R. Katritzky, G. Qin, B. Yang: *Synthesis* 704-706 (1998)].

A leírásban használt "1-6 szénatomos alkilcsoport", "1-8 szénatomos alkilcsoport" és "1-12 szénatomos alkilcsoport" megjelöléseken olyan 1-6, 1-8, illetve 1-12 szénatomos aciklusos telített vagy telítetlen szénhidrogén-maradékokat értünk, amelyek elágazó vagy egyenes láncúak lehetnek, és amelyekhez adott esetben egy vagy több szubsztituens kapcsolódhat. Ide tartoznak az 1-6 szénatomos alkanil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szénatomos alkinil-, 1-8 szénatomos alkanil-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos alkinil-, 1-12 szénatomos alkanil-, 2-12 szénatomos alkenil- és 2-12 szénatomos alkinilcsoportok. Az alkenilcsoportokban legalább egy szén-szén kettős kötés, míg az alkinilcsoportokban legalább egy szén-szén hármas kötés szerepel. Az alkilcsoportok előnyös képviselői a következők: metil-, etil-, n-propil-, 2-propil-, n-butil-, izobutil-, szek-butil-, terc-butil-, n-pentil-, izopentil-, neopentil-, n-hexil-, 2-hexil-, n-oktil-, n-decil-, n-dodecil-, etilenil- (vinil-), etinil-, propenil- [-CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>, -CH=CH-CH<sub>3</sub> és -C(=CH<sub>2</sub>)-CH<sub>3</sub>], propinil- (-CH-C≡CH), butenil-, butinil-, pentenil-, pentinil-, hexenil-, hexinil-, oktenil- és oktinilcsoportok.



A "3-8 szénatomos cikloalkilcsoport" megjelölésen olyan 3-8 szénatomos gyűrűs szénhidrogén-csoportokat értünk, amelyek telítettek vagy telítetlenek lehetnek, és amelyek adott esetben egy vagy több szubsztituenset hordozhatnak. A 3-8 szénatomos cikloalkilcsoportok előnyös képviselőiként a ciklopropil-, ciklobutil-, ciklopentil-, ciklohexil-, cikloheptil-, ciklooktil-, ciklopentenil-, ciklohexenil-, cikloheptenil- és ciklo-oktenil-csoportokat említjük meg. A találmány szempontjából különösen előnyös a ciklopropil-, ciklopropil-2-karbonsav, ciklopropil-2-karbonsav-etil-észter- és ciklohexil-csoport.

Az "arilcsoport" megjelölésen aromás szénhidrogéncsoportokat, így fenil-, naftil- és antracenil-csoportokat értünk. Az arilcsoportok további telített, (részlegesen) telítetlen és aromás gyűrűrendszerekkel kondenzált csoportok is lehetnek. Mindegyik arilcsoport szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált lehet, mimellett az arilcsoportok szubsztituensei azonosak vagy eltérőek lehetnek, és az arilcsoport tetszőleges helyzeteihez kapcsolódhatnak. Az arilcsoport előnyösen fenil-, 1-naftil- vagy 2-naftil-csoport lehet. A találmány szempontjából az arilcsoportok különösen előnyös képviselői a következők: m-tolil-, p-hidroxi-fenil- p-metoxi-fenil-, 4-hidroxi-3-metoxi-fenil-, 2,4-dimetil-fenil-, 4-fluor-fenil-, 1-naftil- és 2-naftil-csoport.

A "heteroaril-csoport" megjelölésen olyan 5-, 6- vagy 7-tagú gyűrűs aromás csoportokat értünk, amelyek legalább egy - de adott esetben 2, 3, 4 vagy 5 - heteroatomot tartalmaznak, mimellett a heteroatomok azonosak vagy eltérőek lehetnek, és a gyűrű szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált lehet. A heterociklushoz kapcsolódó szubsztituensek azonosak vagy eltérőek lehetnek, és a heteroaril-csoport bármely alkalmas helyzetéhez kapcsolódhatnak. A heterociklus bi- vagy policiklusos gyűrűrendszer része is lehet. A heteroatom előnyösen nitrogénatom, oxigénatom vagy kénatom lehet. A heteroaril-csoport előnyösen pirrolil-, indolil-, furil- (furanil-), benzofuranil-, tienil- (tiofenil-), benzotienil-, pirazolil-, imidazolil-, tiazolil-, oxazolil-, izoxazolil-, piridinil-, piridazinil-, pirimidinil-, pirazinil-, piranil-, indolil-, ind-



azolil-, purinil-, pirimidinil-, indolizinil-, kinolinil-, izokinolinil-, kinazolinil-, karbazolil-, fenazinil- vagy fenotiazinil-csoport lehet; ezek a csoportok a heteroaril-csoport bármelyik alkalmas gyűrűtag-atomjával kapcsolódhatnak az (I) [illetve (II), (III) vagy (IV)] általános képletű vegyületek fennmaradó részéhez. A találmány szempontjából a heteroaril-csoport különösen előnyösen piridin-2-il-, furan-2-il-, 5-metil-furan-2-il- vagy 5-nitro-furan-2-il-csoport lehet.

Az "(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport" és "(1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport" megjelöléseken a fenti meghatározásoknak megfelelő 1-6 szénatomos alkil-, aril- és heteroaril-csoportokból felépített csoportokat értünk, amelyek az 1-6 szénatomos alkilcsoporton keresztül kapcsolódnak az (I) [illetve (II), (III) vagy (IV)] általános képletű vegyületek fennmaradó részéhez.

A "heterociklil-csoport" megjelölésen olyan 3-, 4-, 5-, 6- vagy 7-tagú gyűrűs szerves csoportot értünk, ami legalább egy - de adott esetben akár 2, 3, 4 vagy 5 - heteroatomot tartalmaz, ahol a heteroatomok azonosak vagy eltérőek lehetnek, a gyűrűs csoport telített vagy telítetlen lehet (az aromás csoportokat kivéve), és a gyűrűhöz adott esetben egy vagy több szubsztituens kapcsolódhat. A heterociklus bi- vagy policiklusos gyűrűrendszer tagja is lehet. A heteroatomok előnyösen nitrogén-, oxigén- és kénatomok lehetnek. A heterociklil-csoport előnyösen tetrahidrofuril-, piperidinil-, piperidinil-, piperazinil- vagy morfolinil-csoport lehet. A heterociklil-csoportok bármely alkalmas gyűrűtag-atomnál kapcsolódhatnak az (I) [illetve (II), (III) vagy (IV)] általános képletű vegyületek többi részéhez.

Az alkil-, alkanil-, alkenil- és alkinilcsoportokkal kapcsolatban használt "szubsztituált" megjelölésen azt értjük, hogy az adott csoportban egy vagy több hidrogénatom helyén fluor-, klór-, bróm-, jód-, ciano-, amino-, NH-alkil, NH-aril, NH-heteroaril, NH-alkil-aril, NH-alkil-heteroaril, NH-heterociklil, NH-alkil-OH, N(alkil)<sub>2</sub>, N(alkil-aril)<sub>2</sub>, N(alkil-heteroaril)<sub>2</sub>, N(heterociklil)<sub>2</sub>, N(alkil-OH)<sub>2</sub>, NO, NO<sub>2</sub>, SH, S-alkil, S-aril, S-heteroaril, S-alkil-aril, S-alkil-heteroaril, S-heterociklil, S-alkil-OH, S-alkil-SH, OH, O-alkil,



O-aril, O-heteroaril, O-alkil-aril, O-alkil-heteroaril, O-heterociklil, O-alkil-OH, CHO, C(=O)(1-6 szénatomos alkil) C(=S)(1-6 szénatomos alkil), C(=O)aril, C(=S)aril, C(=O)(1-6 szénatomos alkil)-aril, C(=S)(1-6 szénatomos alkil)-aril, C(=O)heteroaril, C(=S)heteroaril, C(=O)heterociklil, C(=S)heterociklil, COOH, COO-alkil, C(=O)NH<sub>2</sub>, C(=O)NH-alkil, C(=O)NH-aril, C(=O)NH-heterociklil, C(=O)N(alkil)<sub>2</sub>, C(=O)N(alkil-aril)<sub>2</sub>, C(=O)N(alkil-heteroaril)<sub>2</sub>, C(=O)N(heterociklil)<sub>2</sub>, SO-alkil, SO<sub>2</sub>-alkil, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, SO<sub>3</sub>H, cikloalkil-, aril-, heteroaril- és/vagy heterociklil-szubsztituens áll. A többszörösen szubsztituált csoportokban az egynél több (például két vagy három) szubsztituens az alapváz azonos vagy eltérő atomjaihoz kapcsolódhat [az előbbire példa a -CF<sub>3</sub> és -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> csoport; az utóbbira példa a -CH(OH)-CH=CH-CHCl<sub>2</sub> csoport], és az egyedi szubsztituensek azonosak vagy eltérőek lehetnek. A találmány szempontjából különösen előnyös a metil-, etil-, n-propil-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH és CF<sub>3</sub> csoport.

Az aril-, alkil-aril-, heteroaril-, alkil-heteroaril-, heterociklil- és cikloalkil-csoportokkal kapcsolatban az "egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált" megjelölésen azt értjük, hogy az adott gyűrűrendszer egy vagy több (például 2, 3 vagy 4) hidrogénatomjának helyén fluor-, klór-, bróm-, jód-, ciano-, amino-, NH-alkil, NH-aril, NH-heteroaril, NH-alkil-aril, NH-alkil-heteroaril, NH-heterociklil, NH-alkil-OH, N(alkil)<sub>2</sub>, N(alkil-aril)<sub>2</sub>, N(alkil-heteroaril)<sub>2</sub>, N(heterociklil)<sub>2</sub>, N(alkil-OH)<sub>2</sub>, NO, NO<sub>2</sub>, SH, S-alkil, S-cikloalkil, S-aril, S-heteroaril, S-alkil-aril, S-alkil-heteroaril, S-heterociklil, S-alkil-OH, S-alkil-SH, OH, O-alkil, O-cikloalkil, O-aril, O-heteroaril, O-alkil-aril, O-alkil-heteroaril, O-heterociklil, O-alkil-OH, CHO, C(=O)(1-6 szénatomos alkil) C(=S)(1-6 szénatomos alkil), C(=O)aril, C(=S)aril, C(=O)(1-6 szénatomos alkil)-aril, C(=S)(1-6 szénatomos alkil)-aril, C(=O)heteroaril, C(=S)heteroaril, C(=O)heterociklil, C(=S)heterociklil, COOH, COO-alkil, C(=O)NH<sub>2</sub>, C(=O)NH-alkil, C(=O)NH-aril, C(=O)NH-heterociklil, C(=O)N(alkil)<sub>2</sub>, C(=O)N(alkil-aril)<sub>2</sub>, C(=O)N(alkil-heteroaril)<sub>2</sub>, C(=O)N(heterociklil)<sub>2</sub>, SO-alkil, SO-aril, SO<sub>2</sub>-alkil, SO<sub>2</sub>-aril, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, SO<sub>3</sub>H, cikloalkil-, aril-, heteroaril-, CF<sub>3</sub>, =O, =S, 1-6 szénatomos alkanil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szénatomos alkinil-, (1-



-6 szénatomos alkil)-C(O)O-(1-6 szénatomos alkil)-, fenil-, benzil-, naftil- és/vagy heterociklil-szubsztituens áll; a felsorolt szubsztituensek adott esetben önmaguk is szubsztituáltak lehetnek. A többszörösen szubsztituált csoportok esetén a szubsztituensek az alapváz azonos vagy eltérő atomjaihoz kapcsolódhatnak, és az egyedi szubsztituensek azonosak vagy eltérők lehetnek. Az arilcsoportokhoz különösen előnyösen fluor-, hidroxil-, metil- és metoxi-szubsztituensek, a heteroaril-csoportokhoz különösen előnyösen metil- és nitro-szubsztituensek, míg a cikloalkil-csoportokhoz különösen előnyösen karboxil- és etoxi-karbonil-szubsztituensek kapcsolódhatnak.

A "gyógyászatilag alkalmazható sók" megjelölésen az (I) általános képletű vegyületek olyan sóit értjük, amelyek a vegyület gyógyászati felhasználásakor - elsősorban emlősök és/vagy emberek kezelése esetén - élettanilag elfogadhatóak. Ilyen gyógyászatilag alkalmazható sók például szervetlen vagy szerves savakkal képezhetők.

Az (I) általános képletű vegyületek gyógyászatilag alkalmazható sói előnyösen sósavval, hidrogén-bromiddal, kénsavval, foszforsavval, metánszulfonsavval, p-toluolszulfonsavval, szénsavval, hangyasavval, ecetsavval, oxálsavval, borostyánkőssavval, borkőssavval, mandulasavval, fumársavval, tejsavval, citromsavval, glutaminsavval vagy aszparaginsavval képezett sók lehetnek. Az így kialakított sók közül példaként a hidrokloridokat, hidrobromidokat, foszfátokat, karbonátokat, hidrogén-karbonátokat, formiátokat, acetátokat, oxalátokat, szukcinátokat, tartarátokat, fumarátokat, citrátokat és glutaminátokat említjük meg. Előnyöseknak bizonyultak továbbá a találmány szerinti vegyületek hidrátjai, amelyek például vizes oldatokból való kristályosítás során képződhetnek.

Legalább egy aszimmetriacentrum (az R<sup>5</sup> szubsztituenst hordozó szénatom) találmány szerinti összes vegyületben jelen van. Ennek megfelelően az (I) általános képletű vegyületek és gyógyászatilag alkalmazható sóik racemátok, tiszta enantiomerek és/vagy diasztereomerek vagy enantiomerek, illetve diasztereomerek keverékei formájában képződhetnek és különíthetők el. A keverékek az egyedi sztereoizomere-



ket tetszőleges arányokban tartalmazhatják. Előnyöseknak bizonyultak az (I) általános képletű vegyületek tiszta enantiomerjei.

A találmány szerinti vegyületek előnyös képviselői azok az (I) általános képletű vegyületek és gyógyászatilag alkalmazható sóik, amelyekben

$R^1$  és  $R^2$  egyike  $-OR^{10}$ ,  $-SR^{10}$ , 1-6 szénatomos alkil- vagy arilcsoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  egyike hidrogénatomot vagy 1-6 szénatomos alkilcsoportot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt W csoportot alkot, ahol W (B) vagy (E) csoportot jelent, és  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  közül a fennmaradt két csoport hidrogénatomot vagy 1-6 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^5$  3-6 szénatomos cikloalkil-, heteroaril-,  $C(=O)R^{11}$ ,  $-COOH$  vagy  $-COOR^{12}$  csoportot jelent;

$R^6$  hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatomot vagy ciano-, nitro-,  $C(=O)R^{14}$ , 1-6 szénatomos alkil-, trifluor-metil- vagy arilcsoportot jelent;

$R^7$  hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatomot vagy ciano-, amino-, hidroxil- vagy 1-6 szénatomos alkilcsoportot jelent; vagy

$R^6$  és  $R^7$  együtt egy Q csoportot alkot, ahol Q  $\gamma'-CR^{15}=CR^{16}-CR^{17}=CR^{18}-\delta'$  csoportot jelent;

$R^8$  hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatomot vagy ciano-, nitro-, O-(1-6 szénatomos alkil)-aril-, karboxil-,  $-CONH_2$  vagy 1-6 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^9$  hidrogénatomot vagy hidroxil-, trifluor-metil- vagy 1-6 szénatomos alkilcsoportot jelent; vagy

$R^8$  és  $R^9$  együtt U csoportot alkot, ahol U  $\eta'-CH=CH-CH=CH-\varepsilon'$  csoportot jelent;

és a fenti csoportokban

$R^{10}$  1-8 szénatomos alkil- vagy arilcsoportot jelent;

$R^{11}$  arilcsoportot jelent;

$R^{14}$  O-(1-6 szénatomos alkil)-csoportot jelent; és



$R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  és  $R^{18}$  közül az egyik hidrogénatomot vagy hidroxilcsoportot jelent, míg a fennmaradt három szubsztituens hidrogénatomot képvisel.

A találmány szerinti vegyületek különösen előnyös képviselői azok az (I) általános képletű vegyületek és gyógyászatilag alkalmazható sóik, amelyekben

$R^1$  és  $R^2$  egyike  $-O-(CH_2)_2OH$ ,  $-S$ -fenil,  $-CH_3$ , fenil-, 3-metil-fenil-, 3,4-dimetil-fenil-, 4-fluor-fenil-, 4-hidroxi-fenil-, 4-metoxi-fenil-, 4-hidroxi-3-metoxi-fenil- vagy 2-naftil-csoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  egyike hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt  $W$  csoportot alkot, ahol  $W$  (B) vagy (E) csoportot jelent, és  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  közül a fennmaradt két csoport hidrogénatomot jelent;

$R^5$  ciklopropil-, 2-(etoxi-karbonil)-ciklopropil-, ciklohexil-, 2-piridinil-, 5-metil-furan-2-il-, 5-nitro-furan-2-il-,  $C(=O)$ fenil, karboxil- vagy etoxi-karbonil-csoportot jelent;

$R^6$  hidrogén-, klór- vagy brómatomot vagy ciano-, nitro-, etoxi-karbonil-, metil-, trifluor-metil- vagy fenilcsoportot jelent;

$R^7$  hidrogén- vagy klóratomot vagy ciano-, amino-, hidroxil-, metil- vagy n-propil-csoportot jelent; vagy

$R^6$  és  $R^7$  együtt egy  $Q$  csoportot alkot, ahol  $Q$   $\gamma'$ - $CH=CH-CH=CR^{18}$ - $\delta'$  csoportot jelent;

$R^8$  hidrogén-, klór- vagy brómatomot vagy ciano-, nitro-,  $O-CH_2$ -fenil-, karboxil- vagy metilcsoportot jelent;

$R^9$  hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelent; vagy

$R^8$  és  $R^9$  együtt  $U$  csoportot alkot, ahol  $U$   $\eta'$ - $CH=CH-CH=CH-\varepsilon'$  csoportot jelent;

és a fenti csoportokban

$R^{18}$  hidrogénatomot vagy hidroxilcsoportot jelent.

Kiemelkedően előnyöseknek bizonyultak a következő vegyületek és azok gyógyászatilag alkalmazható sói:

9-klór-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-



-2-karbonsav,

9-klór-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-

-2-karbonsav-etil-észter,

7,9-diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-

-észter,

7,9-dibróm-3-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-e-

til-észter,

4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-

-észter,

7,9-diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-

-észter,

4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter,

7,9-diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-kar-

bonsav,

4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7,9-diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7-bróm-4-(4-metoxi-fenil)-9-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7,9-diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-2-(5-nitro-furan-2-il) 3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimi-

din,

7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]piri-

midin,

4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-nitro-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,

7,9-diklór-4-(4-metoxi-fenil)-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,

2-[7,9-diklór-4-(2,4-dimetil-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-

-karbonsav-etil-észter,



- 2-[9-klór-4-(2,4-dimetil-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-  
-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,
- 2-[7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopro-  
pán-karbonsav-etil-észter,
- 2-[7,9-diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-  
-karbonsav-etil-észter,
- 2-[7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-  
-karbonsav-etil-észter,
- 2-[9-klór-4-(4-metoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-  
-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,
- 2-[4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-kar-  
bonsav-etil-észter,
- 4-(4-hidroxi-fenil)-3-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-e-  
til-észter,
- 7,9-diklór-4-fenilszulfanil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 7-nitro-4-fenilszulfanil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 7,9-diklór-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-  
-karbonsav,
- 7,9-dibróm-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-  
-karbonsav,
- 7,9-dibróm-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimi-  
din-2-karbonsav,
- 9-klór-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]-  
pirimidin-2-karbonsav,
- 7,9-diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbon-  
sav-etil-észter,



- 7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 9-klór-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 7-bróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-9-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 7,9-diklór-4-(4-hidroxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 7,9-dibróm-4-(4-hidroxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 7,9-diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 9-klór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 7,9-diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 9-klór-4-(4-metoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- 4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,
- [7,9-diklór-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-



-il]-fenil-metanon,

[7,9-dibróm-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-

-2-il]-fenil-metanon,

[7,9-dibróm-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimi-

din-2-il]-fenil-metanon,

[4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-

-fenil-metanon,

[4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-meta-

non,

[7,9-dibróm-4-(4-hidroxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fe-

nil-metanon,

[7,9-diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-meta-

non,

[7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-meta-

non,

[7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fe-

nil-metanon,

[9-klór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-

-fenil-metanon,

[4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon,

[4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon,

2-(7,9-diklór-2-ciklopropil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol,

2-(7,9-dibróm-2-ciklopropil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol,

2-[9-klór-2-ciklopropil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi]-e-

tanol,

2-(2-ciklopropil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol,



9-klór-2-ciklopropil-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]-  
pirimidin,  
7,9-dibróm-2-ciklopropil-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
9-klór-2-ciklopropil-4-(4-metoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]piri-  
midin,  
2-ciklopropil-4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
2-(7,9-diklór-2-ciklohexil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol,  
2-(7,9-dibróm-2-ciklohexil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol,  
2-(7,9-dibróm-2-ciklohexil-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol,  
2-[9-klór-2-ciklohexil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxil]-eta-  
nol,  
2-(2-ciklohexil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol,  
7,9-diklór-2-ciklohexil-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7,9-diklór-2-ciklohexil-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7,9-dibróm-2-ciklohexil-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
9-klór-2-ciklohexil-4-(4-metoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimi-  
din,  
7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbon-  
sav-etil-észter,  
7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbon-  
sav,  
7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]-  
pirimidin,  
2-[7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklo-  
propán-karbonsav-etil-észter,  
7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-piri-  
do[1,2-a]pirimidin,



4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
2-[7,9-dibróm-4-(2,4-dimetil-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,  
2-[7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,  
2-[9-klór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-(trifluor-metil) 3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,  
2-[7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,  
2-[4-(4-fluor-fenil)-4-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,  
9-(benzil-oxi)-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
8-metil-7-nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7,9-diklór-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
9-klór-4-fenil-2-(piridin-2-il)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
8-metil-9-nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7-nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
9-nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7-bróm-9-nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7,9-dibróm-6-metil-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7,9-dibróm-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-9-karbonsav,  
7-metil-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
9-(benzil-oxi)-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
8-metil-7-nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
6-klór-9-nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7,9-diklór-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,



9-klór-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
8-metil-9-nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7-nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7-bróm-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
9-nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7-bróm-9-metil-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-9-ol,  
7-klór-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
4-fenilszulfanil-6-propil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7,9-dibróm-6-metil-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7,9-dibróm-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
1-fenilszulfanil-3-(piridin-2-il)-2,3-dihidro-1H-pirimido[1,2-a]kinolin-10-ol,  
2-metil-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
2,4-diklór-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
4-klór-6-(piridin-2-il)-2-(trifluor-metil)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
2-nitro-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
4-nitro-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
2-klór-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
1-propil-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
2,4-dibróm-1-metil-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
6-(piridin-2-il)-2-(trifluor-metil)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
1,4-metano-5-(piridin-2-il)-1,4a,5,12c-tetrahidro-4H-6,12b-diaza-benzo[c]fenantrén-



-12-ol,

1,4-metano-5-(piridin-2-il)-1,4a,5,12c-tetrahidro-4H-6,12b-diaza-benzo[c]fenantrén,  
és

6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-izokino[2,1-a]kinazolin.

A találmány tárgya továbbá eljárás az (I) általános képletű vegyületek és gyógyászatilag alkalmazható sóik előállítására - a képletben

$R^1$  és  $R^2$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,  $-OR^{10}$  csoport,  $-SH$  csoport,  $-SR^{10}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik hidrogénatomot jelent, és a másik hidrogénatomtól eltérő jelentésű, azzal azonban, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik arilcsoportot jelent, akkor a másik hidrogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport,



szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^3$  és  $R^4$  közül legalább az egyik hidrogénatomot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt **W** csoportot alkot, míg  $R^1$  és  $R^2$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, és  $R^3$  és  $R^4$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, ahol **W**  $\alpha'-(CH_2)_n-\beta'$  csoportot (amelyben n értéke 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 vagy 10),  $\alpha'-CH=CH-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH=CH-CH_2-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH_2-CH=CH-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-O-(CH_2)_n-\beta'$  csoportot (amelyben n értéke 2, 3, 4, 5 vagy 6), (A) képletű csoportot, (B) képletű csoportot, (C) képletű csoportot (amelyben X jelentése  $-CH_2-$ ,  $-O-$  vagy  $-S-$ ), (D) képletű csoportot vagy (E) képletű csoportot jelent, amely csoportok az  $\alpha'$ -vel jelölt végükkel az (I) általános képletben  $\alpha$ -val jelölt szénatomhoz, a  $\beta'$ -vel jelölt végükkel pedig az (I) általános képletben  $\beta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódnak;

$R^5$  jelentése  $-C(=O)R^{11}$  csoport,  $-COOH$  csoport,  $-COOR^{12}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cik-



loalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport; és

$R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub>, NHR<sup>13</sup>, nitro-, hidroxil-, merkaptó-, O-(1-8 szénatomos alkil)- vagy S(O)<sub>p</sub>-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és p értéke 0, 1 vagy 2; O-aril- vagy S(O)<sub>q</sub>-aril-csoport, amelyekben az arilcsoportok szubsztituálatlanok vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak lehetnek, és q értéke 0, 1 vagy 2; O-(1-6 szénatomos alkil)-aril- vagy S(O)<sub>r</sub>-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, amelyekben az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok, míg az arilcsoportok szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és r értéke 0, 1 vagy 2; -COOH csoport; -C(=O)R<sup>14</sup> csoport; egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport; CF<sub>3</sub> csoport; telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-csoport; 3-, 4-, 5-, 6- vagy 7-tagú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen



szubsztituált heterociklil-csoport; szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport; vagy szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport; vagy

$R^8$  és  $R^9$  jelentése a fenti, és  $R^6$  és  $R^7$  együtt  $Q$  csoportot alkot, ahol  $Q$  egy  $\gamma'$ - $CR^{15}=CR^{16}-CR^{17}=CR^{18}-\delta'$  csoportot jelent, ami a  $\delta'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\delta$ -val jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódik; vagy

$R^7$  és  $R^8$  jelentése a fenti, és  $R^6$  és  $R^9$  együtt  $T$  csoportot alkot, ahol  $T$  egy  $\gamma'$ - $CR^{19}=CR^{20}-CR^{21}=CR^{22}-\varepsilon'$  vagy  $\gamma'$ - $N=CR^{20}-CR^{21}=N-\varepsilon'$  csoportot jelent, amelyek az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végükénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végükénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak; vagy

$R^6$  és  $R^7$  jelentése a fenti, és  $R^8$  és  $R^9$  együtt  $U$  csoportot alkot, ahol  $U$  egy  $\eta'$ - $CR^{19}=CR^{20}-CR^{21}=CR^{22}-\varepsilon'$  csoportot jelent, ami az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\eta'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\eta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódik;

és a fenti meghatározásokban szereplő általános szimbólumok közül

$R^{10}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen

szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{11}$  jelentése amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{12}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{13}$  -C(=O)CH<sub>3</sub> csoportot, -C(=O)fenil-csoportot, -C(=O)O-terc-butyl- (t-BOC) csoportot vagy más szokásos amino-védőcsoportot jelent;



$R^{14}$  jelentése hidrogénatom, amino-,  $NH(1-6$  szénatomos alkil),  $N(1-6$  szénatomos alkil)<sub>2</sub>,  $NH[(1-6$  szénatomos alkil)-aril],  $N[(1-6$  szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkilcsoportot tartalmazó  $O-(1-8$  szénatomos alkil)-csoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált cikloalkilcsoportot tartalmazó  $O-(3-8$  szénatomos cikloalkil)-csoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoportot tartalmazó  $O$ -aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített  $O-(1-6$  szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  és  $R^{18}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport; és

$R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$  és  $R^{22}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport -,



oly módon, hogy egy (II) általános képletű heteroaril-amint - a képletben  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése a fenti, azzal a megkötéssel, hogy ha  $R^6$  és  $R^7$  együtt Q csoportot alkot, ez a  $\gamma'$ -vel jelölt végénél a (II) általános képletű heteroaril-amin  $\gamma$ -val jelölt szénatomjához és  $\delta'$ -vel jelölt végével a (II) általános képletű heteroaril-amin  $\delta$ -val jelölt szénatomjához kapcsolódik; ha  $R^6$  és  $R^9$  együtt T csoportot alkot, ez a  $\gamma'$ -vel jelölt végénél a (II) általános képletű heteroaril-amin  $\gamma$ -val jelölt szénatomjához és  $\varepsilon'$ -vel jelölt végével a (II) általános képletű heteroaril-amin  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomjához kapcsolódik, és ha  $R^8$  és  $R^9$  együtt U csoportot alkot, ez az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végével a (II) általános képletű heteroaril-amin  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomjához és  $\eta'$ -vel jelölt végével a (II) általános képletű heteroaril-amin  $\eta$ -vel jelölt szénatomjához kapcsolódik - sav jelenlétében egy (III) általános képletű aldehiddel - a képletben  $R^5$  jelentése a fenti - és egy (IV) általános képletű olefinnel - a képletben  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  jelentése a fenti, azzal a megkötéssel, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt W csoportot alkot, ez az  $\alpha'$ -vel jelölt végével a (IV) általános képletű olefin  $\alpha$ -val jelölt szénatomjához és  $\beta'$ -vel jelölt végével a (IV) általános képletű olefin  $\beta$ -val jelölt szénatomjához kapcsolódik - reagáltatunk.

A találmány szerinti eljárást félig automatizált vagy teljesen automatizált formában is végrehajthatjuk az (I) általános képletű vegyületek egy csoportjának párhuzamos szintéziseként.

A szintézishez savként szervetlen vagy szerves protonos savakat vagy Lewis savakat használhatunk. A reakciót előnyösen szerves sav, például ecetsav, trifluor-ecetsav vagy metánszulfonsav, különösen előnyösen trifluor-ecetsav jelenlétében hajtjuk végre.

A találmány szerinti reakció közegeként minden olyan alkalmas oldószert felhasználhatunk, ami megfelelően oldja a reagenseket. Oldószerként előnyösen szerves oldószereket, például diklór-metánt vagy - különösen előnyösen - acetonitrilt használhatunk.



Az (I) általános képletű vegyületek előállításának reakcióhőmérséklete előnyösen 0°C és 100°C közötti, célszerűen 15°C és 40°C közötti érték lehet. A reakcióidő előnyösen 15 perc és 12 óra között változhat, a mindenkori körülményeknek megfelelően.

A találmány szerinti eljárásban kiindulási anyagokként felhasznált (II) általános képletű heteroaril-aminok, (III) általános képletű aldehidek és (IV) általános képletű olefinek kereskedelmi forgalomban beszerezhető anyagok [ezeket az anyagokat például az Acros (Geel), Avocado (Port of Heysham), Aldrich (Deisenhofen), Fluka (Seelze), Lancaster (Mülheim), Maybridge (Tintagel), Merck (Darmstadt), Sigma (Deisenhofen) és TCI (Japán) cég forgalmazza], vagy a szakirodalomban általánosan ismertetett eljárásokkal állíthatók elő.

A találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek szabad bázisok és sók formájában egyaránt elkülöníthetők. A fent ismertetett reakció végrehajtása és az azt követő szokásos feldolgozás után rendszerint az (I) általános képletű szabad bázisokat kapjuk. Az így kapott bázisokat ezután például szervetlen vagy szerves savakkal, célszerűen sósavval, hidrogén-bromiddal, kénsavval, foszforsavval, metánszulfonsavval, p-toluolszulfonsavval, szénsavval, hangyasavval, ecetsavval oxálsavval, borostyánkőssavval, borkósavval, mandulasavval, fumársavval, teljsavval, citromsavval, glutaminsavval vagy aszparaginsavval reagáltatva alakíthatjuk át a megfelelő sókká, például hidrokloridokká, hidrobromidokká, foszfátokká, karbonátokká, hidrogén-karbonátokká, formiátokká, acetátokká, oxalátokká, szukcinátokká, tartarátokká, fumarátokká, citrátokká és glutaminátokká. A hidroklorid-sókat - amelyek különösen előnyösek - úgy is előállíthatjuk, hogy az alkalmas szerves oldószerben oldott bázist trimetil-szilil-kloriddal (TMSCl) reagáltatjuk.

A racemátok vagy különböző enantiomerek és/vagy diasztereomerek elegyei formájában kapott (I) általános képletű vegyületekből a szakirodalomból jól ismert módszerekkel különíthetjük el az (I) általános képletű vegyületek egyedi izomerjeit.



Alkalmas eljárások például a következők: kromatográfias elválasztási módszerek, elsősorban normál nyomáson vagy megnövelt nyomáson végzett folyadékkromatográfálás, különösen előnyösen MPLC és HPLC; továbbá frakcionált kristályosítás. Az egyedi izomereket például királis fázison végzett HPLC-val választhatjuk el az azokat tartalmazó elegyekből; eljárhatunk azonban úgy is, hogy az elegyekből először királis savakkal, így (+)-borkőssavval, (-)-borkőssavval vagy (+)-10-kámforszulfonsavval dia-sztereomer sókeveréket képezünk, amelynek egyedi komponenseit frakcionált kristályosítással választjuk szét.

A találmány tárgya továbbá anyagkönyvtár, ami legalább egy (I) általános képletű vegyületet tartalmaz - a képletben

$R^1$  és  $R^2$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,  $-OR^{10}$  csoport,  $-SH$  csoport,  $-SR^{10}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik hidrogénatomot jelent, és a másik hidrogénatomtól eltérő jelentésű, azzal azonban, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik arilcsoportot jelent, akkor a másik hidrogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent;



$R^3$  és  $R^4$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^3$  és  $R^4$  közül legalább az egyik hidrogénatomot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt **W** csoportot alkot, míg  $R^1$  és  $R^2$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, és  $R^3$  és  $R^4$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, ahol **W**  $\alpha'$ -( $\text{CH}_2$ ) $_n$ - $\beta'$  csoportot (amelyben n értéke 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 vagy 10),  $\alpha'$ -CH=CH- $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ -CH=CH- $\text{CH}_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ -CH $_2$ -CH=CH- $\text{CH}_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ -CH $_2$ -CH $_2$ -CH=CH- $\text{CH}_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ -O-( $\text{CH}_2$ ) $_n$ - $\beta'$  csoportot (amelyben n értéke 2, 3, 4, 5 vagy 6), (A) képletű csoportot, (B) képletű csoportot, (C) képletű csoportot (amelyben X jelentése -CH $_2$ -, -O- vagy -S-), (D) képletű csoportot vagy (E) képletű csoportot jelent, amely csoportok az  $\alpha'$ -vel jelölt végükkel az (I) általános képlet-



ben  $\alpha$ -val jelölt szénatomhoz, a  $\beta$ '-vel jelölt végükkel pedig az (I) általános képletben  $\beta$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak;

$R^5$  jelentése  $-C(=O)R^{11}$  csoport,  $-COOH$  csoport,  $-COOR^{12}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport; és

$R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, amino-,  $NH(1-6$  szénatomos alkil),  $N(1-6$  szénatomos alkil) $_2$ ,  $NH[(1-6$  szénatomos alkil)-aril],  $N[(1-6$  szénatomos alkil)-aril] $_2$ ,  $NHR^{13}$ , nitro-, hidroxil-, merkaptó-,  $O-(1-8$  szénatomos alkil)- vagy  $S(O)_p-(1-8$  szénatomos alkil)-csoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és  $p$  értéke 0, 1 vagy 2;  $O$ -aril- vagy  $S(O)_q$ -aril-csoport, amelyekben az arilcsoportok szubsztituálatlanok vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak lehetnek, és  $q$  értéke 0, 1 vagy 2;  $O-(1-6$  szénatomos alkil)-aril- vagy  $S(O)_r-(1-6$  szénatomos alkil)-aril-csoport, amelyekben az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok, míg az arilcsoportok szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy



többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és  $r$  értéke 0, 1 vagy 2;  $-\text{COOH}$  csoport;  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{14}$  csoport; egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport;  $\text{CF}_3$  csoport; telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-csoport; 3-, 4-, 5-, 6- vagy 7-tagú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heterociklil-csoport; szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport; vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport; vagy

$\text{R}^8$  és  $\text{R}^9$  jelentése a fenti, és  $\text{R}^6$  és  $\text{R}^7$  együtt  $\text{Q}$  csoportot alkot, ahol  $\text{Q}$  egy  $\gamma'-\text{CR}^{15}=\text{CR}^{16}-\text{CR}^{17}=\text{CR}^{18}-\delta'$  csoportot jelent, ami a  $\delta'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\delta$ -val jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódik; vagy

$\text{R}^7$  és  $\text{R}^8$  jelentése a fenti, és  $\text{R}^6$  és  $\text{R}^9$  együtt  $\text{T}$  csoportot alkot, ahol  $\text{T}$  egy  $\gamma'-\text{CR}^{19}=\text{CR}^{20}-\text{CR}^{21}=\text{CR}^{22}-\varepsilon'$  vagy  $\gamma'-\text{N}=\text{CR}^{20}-\text{CR}^{21}=\text{N}-\varepsilon'$  csoportot jelent, amelyek az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végüknél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végüknél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak; vagy

$\text{R}^6$  és  $\text{R}^7$  jelentése a fenti, és  $\text{R}^8$  és  $\text{R}^9$  együtt  $\text{U}$  csoportot alkot, ahol  $\text{U}$  egy  $\eta'-\text{CR}^{19}=\text{CR}^{20}-\text{CR}^{21}=\text{CR}^{22}-\varepsilon'$  csoportot jelent, ami az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\eta'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\eta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódik;

és a fenti meghatározásokban szereplő általános szimbólumok közül

$\text{R}^{10}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen



vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{11}$  jelentése amino-,  $NH(1-6 \text{ szénatomos alkil})$ ,  $N(1-6 \text{ szénatomos alkil})_2$ ,  $NH[(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}]$ ,  $N[(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}]_2$  vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{12}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen



sen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{13}$  -C(=O)CH<sub>3</sub> csoportot, -C(=O)fenil-csoportot vagy -C(=O)O-terc-butil-(t-BOC) csoportot jelent;

$R^{14}$  jelentése hidrogénatom, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkilcsoportot tartalmazó O-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált cikloalkilcsoportot tartalmazó O-(3-8 szénatomos cikloalkil)-csoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoportot tartalmazó O-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített O-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  és  $R^{18}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elága-



zó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport; és

$R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$  és  $R^{22}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport.

A találmány szerinti anyagkönyvtár előnyösen legalább 40, célszerűen legalább 80, különösen előnyösen legalább 120 (I) általános képletű vegyületet tartalmaz.

A találmány szempontjából az "anyagkönyvtár" megjelölésen ugyanazzal az eljárással, ugyanolyan vagy közel ugyanolyan reakciókörülmények között, egy reagens vagy több reagens variálásával előállított vegyületek csoportját értjük. Egy ilyen anyagkönyvtár a könyvtár tagjait akár egyedi tiszta vegyületek, akár több ilyen vegyület keveréke formájában tartalmazhatja. Az ilyen anyagkönyvtárak például egy vagy több in vitro körülmények között végzendő gyógyszer célú szűrővizsgálat automatizált végrehajtását teszik lehetővé.

A találmány tárgyát képezik továbbá azok a gyógyszerek, amelyek hatóanyagként legalább egy, a fentiekben meghatározott (I) általános képletű vegyületet vagy annak gyógyászatilag alkalmazható sóját tartalmazzák, ahol a 6-klór-2-(4-nitro-fenil)-4-fenil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin, a 2-(4-nitro-fenil)-4-fenil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin, a 2-(2-nitro-fenil)-4-fenil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin, a 2-(4-nitro-fenil)-4-(4-tolil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin, a 2-(4-klór-fenil)-4-(4-tolil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin, a 4-etoxi-2-fenil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin, a 4-etoxi-2-(2-hidroxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin, a 4-etoxi-2-propil-3,4-dihidro-2H-pirido[12-a]pirimidin, a 4-propil-2,3,3a,4,5,10a-hexahidro-2H-pirido[1,2-a]furo[3,2-e]pirimidin és a 4-propil-2,4,4a,5,6,11a-hexahidro-2H-pirido[1,2-a]pirano[3,2-e]pirimidin is a hatóanyagok körébe tartozik. A találmány szerinti gyógyszerkészítmények a találmány szerinti vegyületeket akár izomertiszta (előnyö-



sen enantiomer- vagy diasztereomer-tiszta) formában, akár racém vagy nemracém összetételű keverékek formájában tartalmazhatják. A gyógyszerkészítmények előnyösen gyógyászatilag alkalmazható sók, célszerűen hidrokloridok formájában tartalmazhatják a találmány szerinti vegyületeket.

A találmány tárgyát képezi továbbá az (I) általános képletű vegyületek - a megfelelő tiszta diasztereomereket és enantiomereket, valamint a racemátokat és a más összetételű enantiomer-keverékeket is beleértve - és élettanilag alkalmazható savakkal képezett sóik, célszerűen hidrokloridjaik felhasználása fájdalom kezelésére alkalmas gyógyszerek gyártásához. A találmány szerinti vegyületek analgetikus hatásúaknak bizonyultak.

Meglepő módon azt tapasztaltuk, hogy a találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek más indikációs területeken - elsősorban vizeletvisszatartási képtelenség, vizketegség, tinnitus aurium és/vagy hasmenés kezelésére - is előnyösen használhatók. Ennek megfelelően a találmány tárgyát képezi továbbá az (I) általános képletű vegyületek és gyógyászatilag alkalmazható sóik felhasználása vizeletvisszatartási képtelenség, vizketegség, tinnitus aurium és/vagy hasmenés kezelésére alkalmas gyógyszerkészítmények gyártásához.

A találmány továbbá gyógyászati készítményekre vonatkozik, amelyek legalább egy (I) általános képletű vegyület vagy gyógyászatilag alkalmazható sója mellett egy vagy több gyógyszerészeti segédanyagot is tartalmaznak.

A találmány szerinti gyógyszerek és gyógyászati készítmények folyékony, félig szilárd vagy szilárd gyógyszerformák, például injekciós oldatok, cseppek, levek, szirupok, permetek, szuszpenziók, granulátumok, tabletták, pelletek, transzdermális gyógykészítmények, kapszulák, tapaszok, kúpok, kenőcsök, krémek, balzsamok, gélek, emulziók vagy aeroszolok formájában forgalmazhatók és adhatók be, amelyek a legalább egy (I) általános képletű vegyület, mint hatóanyag mellett az adott galenikus formának megfelelően egy vagy több gyógyszerészeti segédanyagot, például hordo-



zóanyagot, töltőanyagot, oldószer, hígítószer, felületaktív anyagot, színezéket, konzerválószer, szétesést elősegítő anyagot, síkosítószer, csúsztatószer, ízesítőszer és/vagy kötőanyagot is tartalmazhatnak. Segédanyagokként például a következőket használhatjuk: víz, etanol, 2-propanol, glicerin, etilén-glikol, propilén-glikol, poli(etilén-glikol), poli(propilén-glikol), glükóz, fruktóz, laktóz, szaharóz, dextróz, melasz, keményítő, módosított keményítőfajték, zselatin, szorbit, inozit, mannit, mikrokristályos cellulóz, metil-cellulóz, karboxi-metil-cellulóz, cellulóz-acetát, sellak, cetil-alkohol, poli(vinil-pirrolidon), paraffinok, viaszok, természetes és szintetikus gumik, akáciagumi, alginátok, dextrans, telített és telítetlen zsírsavak, sztearinsav, magnézium-sztearát, cink-sztearát, gliceril-sztearát, nátrium-lauril-szulfát, aroma-olajok, szezámolaj, kókuszolaj, földimogyoróolaj, szójaolaj, lecitin, nátrium-laktát, poli(oxi-etilén- és -propilén)-zsírsav-észterek, szorbitán-zsírsav-észterek, szorbinsav, benzoésav, citromsav, aszkorbinsav, tanninsav, nátrium-klorid, kálium-klorid, magnézium-klorid, kalcium-klorid, magnézium-oxid, cink-oxid, szilícium-dioxid, titán-oxid, titán-dioxid, magnézium-szulfát, cinkszulfát, kalcium-szulfát, hamizsír, kalcium-foszfát, dikalcium-foszfát, kálium-bromid, kálium-jodid, talkum, kaolin, pektin, kroszpovidon, agar és bentonit.

A segédanyagokat és azok felhasználandó mennyiségét annak megfelelően választjuk meg, hogy milyen módon (orálisan, szubkután, parenterálisan, intravénánisan, vaginálisan, pulmonálisan, intraperitoneálisan, transzdermálisan, intramuszkulárisan, nazálisan, bukkálisan, rektálisan vagy helyileg - például bőrre, nyálkahártyákra vagy szembe juttatandó -) adagolandó készítményt kívánunk kialakítani. Az orálisan adagolandó gyógyszerformák például tabletták, drázsék, kapszulák, granulátumok, cseppek, levek és szirupok, a parenterálisan, helyileg vagy inhalálással adagolandó gyógyszerformák például oldatok, szuszpenziók, könnyen rekonstituálható porok (inhaláláshoz) és permetek lehetnek. Perkután adagolásra jól használhatók a találmány szerinti (I) általános képletű vegyületeket oldott formában tartalmazó depó-készítmények vagy az azokat tartalmazó tapaszok, amelyek adott esetben a bőrbe való



behatolást elősegítő segédanyagokat is tartalmazhatnak. A rektálisan, nyálkahártyán keresztül, orálisan vagy percután adagolásra szánt készítmények a találmány szerinti (I) általános képletű vegyületeket kiegészítve leadó kompozíciók is lehetnek.

A találmány szerinti gyógyszereket és gyógyászati készítményeket a gyógyszertechnológiából jól ismert szerek, berendezések, módszerek és eljárások segítségével alakíthatjuk ki. Ilyen gyógyszertechnológiai megoldásokat ismertet például a "Remington's Pharmaceutical Sciences" c. kézikönyv [szerk.: A.R. Gennaro, 17. kiadás, Mack Publishing Company, Easton, Pa. (1985)], elsősorban a 8. rész 76-93. fejezete.

Szilárd gyógyszerformák (például tabletták) előállításánál például úgy járhatunk el, hogy a hatóanyagot - azaz egy (I) általános képletű vegyületet vagy gyógyászatiilag alkalmazható sóját - egy vagy több gyógyszerészeti hordozóanyaggal (például szokásos tablettakomponensekkel, így kukoricakeményítővel, laktózzal, szaharózzal, szorbittal, talkummal, magnézium-sztearáttal, dikalcium-foszfáttal vagy gyógyászatiilag alkalmazható gumival) és gyógyszerészeti hígítószerrel (így vízzel) összekeverve granuláljuk, és így a találmány szerinti vegyületet vagy gyógyászatiilag alkalmazható sóját homogén eloszlásban tartalmazó szilárd készítményt alakítunk ki. A "homogén eloszlás" megjelölésen azt értjük, hogy a hatóanyag a teljes készítményen belül egyenletesen oszlik el; a készítmény tehát minden további nélkül azonos hatékonyságú dózisegységekre (például tablettákra, pilulákra vagy kapszulákra) osztható szét. Ezután a fentiek szerint kapott szilárd készítményt a kívánt dózisegység-formára hozzuk. A tabletták formájában kikészített találmány szerinti gyógyszerekre vagy gyógyászati készítményekre ezután kívánt esetben nyújtott hatóanyag-felszabadulást biztosító bevonatot vihetünk fel, vagy más kompaundálási módszerrel biztosíthatjuk a hatóanyag nyújtott felszabadulását. Bevonószerekként például polimer savakat és polimer savak más anyagokkal, így sellakkal, cetil-alkohollal és/vagy cellulóz-acetáttal készített keverékeket használhatjuk.



A betegeknek beadandó hatóanyag-mennyiség több tényezőtől, például a beteg testtömegétől, korától, a kórelőzménytől, az adagolás módjától, a kezelendő betegség típusától és a betegség súlyosságától függően változik. A találmány szerinti vegyületeket rendszerint 0,1-5000 mg/testtömeg kg, előnyösen 1-500 mg/testtömeg kg, célszerűen 2-250 mg/testtömeg kg dózisokban használjuk.

A találmány további részleteit a következő példákkal szemléltetjük.

A példákban felhasznált vegyszereket és oldószereket a kereskedelmi forgalmazóktól [például Acros (Geel), Avocado (Port of Heysham), Aldrich (Deisenhofen), Fluka (Seelze), Lancaster (Mülheim), Maybridge (Tintagel), Merck (Darmstadt), Sigma (Deisenhofen) és TCI (Japán)] szereztük be, vagy azokat a technika állásából jól ismert módszerekkel állítottuk elő.

A kromatográfiás tisztítást reverz fázisú nagynyomású folyadékkromatográfálással végeztük, Macherey-Nagel gyártmányú, 100 mm hosszú, 21 mm belső átmérőjű Nucleosil 100-3 C<sub>18</sub>-HD oszlopon (VarioPrep); futtatószerként víz és metanol 50 %-osról kb. 18 perc alatt gradiens szerint 100 %-osra változó összetételű elegyeit használtuk; az áramlási sebesség 10 ml/perc volt; a detektálást UV fénnel végeztük Beckman 168 PDA készülékkel.

#### 1-131. példa

Általános eljárás az (I) általános képletű vegyületek félautomatizált szintézisére:

16 mm átmérőjű, 125 mm hosszú gömbölyű aljú, csavarmenettel ellátott kémcsőbe keverőt illesztettünk, és a kémcsövet válaszfalal ellátott csavaros fedéllel lezártuk. A kémcsövet 20°C-ra temperált keverő blokkba állítottuk, és a kémcsőbe egymás után 1-1 ml, a következőkben felsorolt oldatot pipettáztuk:

- trifluor-ecetsavat (0,1 mól) és (II) általános képletű heteroaril-amin-vegyületet (0,1 mól) tartalmazó acetonitriles oldat;
- (III) általános képletű aldehidet (0,11 mól) tartalmazó acetonitriles oldat;



- (IV) általános képletű olefint (0,3 mól) tartalmazó acetonitriles oldat.

A reakcióelegyet 10 órán át kevertük a 20°C-ra temperált keverőblokkban. Ezután az elegyet szűrtük, és a kémcsövet kétszer 1,5 ml 7,5 %-os vizes nátrium-hidrogén-karbonát oldattal utánöblítettük.

A mintákat tartalmazó állványt manuálisan helyeztük a feldolgozó készülékre. A reakcióelegyet keverés közben 2 ml etil-acetáttal elegyítettük, és összeráztuk. A fázishatár kialakítására a kémcsöveket centrifugában rövid ideig centrifugáltuk. A fázishatárt optikai úton detektáltuk, és a szerves fázist pipettával elkülönítettük. A következő lépésben a vizes fázist ismét 2 ml etilacetáttal elegyítettük, összeráztuk, centrifugáltuk, és a szerves fázist pipettázással elkülönítettük. Az egyesített szerves fázisokat 2,4 g szemcsés magnézium-szulfát fölött szárítottuk, majd az oldószert vákuum-centrifugában eltávolítottuk.

Minden mintát ESI-MS spektrum és/vagy NMR spektrum alapján azonosítottunk. Az ESI-MS spektrumokat Finnegan gyártmányú LCQ Classic típusú tömegspektrométeren vettük fel. Az <sup>1</sup>H NMR spektrumokat 300 MHz frekvencián vettük fel Bruker gyártmányú, DPX Advance típusú spektrométeren.

A fenti általános előirat szerint állítottuk elő az 1. táblázatban felsorolt 1-131. sz. vegyületet. A 80-89. példa esetén a vegyületeket reverz fázisú nagynyomású folyadékkromatografálással tisztítottuk.

### 1. táblázat

A példa száma	A vegyület neve	MS	
		számított	talált
1.	9-Klór-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	400,78	401,2/403,2
2.	9-Klór-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter	428,83	429,2/430,1
3.	7,9-Diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter	411,28	411,1/413,1



A példa száma	A vegyület neve	MS	
		számított	talált
4.	7,9-Dibrom-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter	500,19	499,1/501,0/ 503,0
5.	4-(3,4-Dimetoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter	387,39	388,2
6.	7,9-Diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter	381,25	381,1/383,0
7.	4-(4-Metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter	357,36	358,2
8.	7,9-Diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	383,23	383,2/385,0
9.	7,9-Dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	486,16	485,1/487,0/ 488,9
10.	4-(3,4-Dimetoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	359,33	360,1
11.	7,9-Diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	353,2	353,1/355,0
12.	4-(4-Metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	329,31	330,1
13.	7-Bróm-4-(4-metoxi-fenil)-9-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	408,21	408,1/410,1
14.	7,9-Diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	450,27	450,2/452,1
15.	7,9-Dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	539,18	538,1/540,1/ 542,0
16.	4-(3,4-Dimetoxi-fenil)-7-nitro-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	426,38	427,2
17.	7,9-Diklór-4-(4-metoxi-fenil)-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	420,25	420,2/422,1
18.	2-[7,9-Diklór-4-(2,4-dimetil-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter	419,35	419,3/421,1
19.	2-[9-Klór-4-(2,4-dimetil-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter	452,9	453,3



A példa száma	A vegyület neve	MS	
		számított	talált
20.	2-[7,9-Dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter	540,26	539,3/541,1/ 543,1
21.	2-[7,9-Diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter	421,32	421,1/423,1
22.	2-[7,9-Dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter	510,23	509,1/511,0/ 513,0
23.	2-[9-Klór-4-(4-metoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter	454,87	455,2/456,0/ 457,1
24.	2-[4-(4-Metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter	397,43	398,2
25.	4-(4-Hidroxi-fenil)-3-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter	357,36	358,2
26.	7,9-Diklór-4-fenilszulfanil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	355,24	355,1/357,0
27.	7-Nitro-4-fenilszulfanil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	331,34	332,1
28.	7,9-Diklór-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	383,23	383,1/385,1
29.	7,9-Dibróm-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	472,14	471,0/473,0/ 475,0
30.	7,9-Dibróm-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	486,16	485,0/487,0/ 488,9
31.	9-Klór-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	416,78	417,1/419,1
32.	7,9-Diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	367,23	367,1/369,1
33.	7,9-Dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	456,14	455,0/457,0/ 459,0
34.	7,9-Dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	470,17	469,0/471,0/ 472,9

A példa száma	A vegyület neve	MS	
		számitott	talált
35.	9-Klór-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	400,78	401,1/403,1
36.	4-(4-Metoxi-fenil)-3-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	343,33	344,2
37.	7-Bróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-9-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	422,23	422,1/424,0
38.	7,9-Diklór-4-(4-hidroxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	353,2	353,1/355,1
39.	7,9-Dibróm-4-(4-hidroxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	456,14	45,0/457,0/ 459,0
40.	7,9-Diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	383,23	383,1/385,1
41.	7,9-Dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	472,14	471,0/473,0/ 475,0
42.	7,9-Dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	486,16	485,0/487,0/ 489,0
43.	9-Klór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	416,78	417,1
44.	4-(3,4-Dimetoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	359,3	360,2
45.	4-(4-Metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirazino[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	285,3	286,2
46.	7,9-Diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	353,2	353,1/355,1
47.	7,9-Dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	442,11	441,0/443,0/ 445,0
48.	7,9-Dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	456,14	455,0/457,0/ 459,0
49.	9-Klór-4-(4-metoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	386,75	387,1
50.	4-(4-Metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	329,31	330,1
51.	[7,9-Diklór-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon	443,32	441,2/443,1/ 445,1

A példa száma	A vegyület neve	MS	
		számitott	talált
52.	[7,9-Dibróm-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon	532,24	533,0
53.	[7,9-Dibróm-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon	546,26	545,0/547,0/ 549,0
54.	[4-(4-Hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon	419,43	420,2
55.	[4-(4-Metoxi-fenil)-3-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon	403,43	404,2
56.	[7,9-Dibróm-4-(4-hidroxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon	516,24	515,0/517,0/ 519,0
57.	[7,9-Diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon	443,32	443,1/445,1
58.	[7,9-Dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon	532,24	531,1/533,1
59.	[7,9-Dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon	546,26	545,1/547,0
60.	[9-Klór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon	476,88	477,1
61.	[4-(3,4-Dimetoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon	419,43	420,2
62.	[4-(4-Metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon	389,41	390,2
63.	2-(7,9-Diklór-2-ciklopropil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol	303,18	303,1/305,1
64.	2-(7,9-Dibróm-2-ciklopropil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol	392,1	391,0/393,0/ 395,0
65.	2-[9-Klór-2-ciklopropil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol	336,74	337,1/339,1
66.	2-(2-Ciklopropil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol	279,29	280,1
67.	9-Klór-2-ciklopropil-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	412,83	413,1



A példa száma	A vegyület neve	MS	
		számított	talált
68.	7,9-Dibróm-2-ciklopropil-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	438,17	439,0
69.	9-Klór-2-ciklopropil-4-(4-metoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	382,81	383,1/385,1
70.	2-Ciklopropil-4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	325,36	326,2
71.	2-(7,9-Diklór-2-ciklohexil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol	345,26	345,1/347,1
72.	2-(7,9-Dibróm-2-ciklohexil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol	434,18	433,1/435,1/ 437,0
73.	2-(7,9-Dibróm-2-ciklohexil-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol	448,2	447,1/449,0/ 451,0
74.	2-[9-Klór-2-ciklohexil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol	378,82	379,2/381,2
75.	2-(2-Ciklohexil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol	321,37	322,2
76.	7,9-Diklór-2-ciklohexil-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	421,36	421,1/423,1
77.	7,9-Diklór-2-ciklohexil-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	391,34	391,1/393,1
78.	7,9-Dibróm-2-ciklohexil-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	480,25	479,1/481,1/ 483,0
79.	9-Klór-2-ciklohexil-4-(4-metoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	424,89	425,5/427,2
80.	7,9-Dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter	484,19	485,0/487,0
81.	7,9-Dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav	456,14	457,4/459,5
82.	7,9-Dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	523,19	522,4/524,3/ 526,2
83.	2-[7,9-Dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter	524,26	525,2

A példa száma	A vegyület neve	MS	
		számitott	talált
84.	7,9-Dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	553,21	554,2/555,2/ 556,2
85.	4-(4-Metoxi-fenil)-7-nitro-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	396,35	397,1
86.	2-[7,9-Dibróm-4-(2,4-dimetil-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter	508,26	509,1
87.	2-[7,9-Dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-	554,28	553,2/555,1/ 557,1
88.	2-[9-Klór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter	484,9	485,5
89.	2-[7,9-Dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter	524,26	525,1/527,2
90.	2-[4-(4-Fluor-fenil)-4-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter	399,42	400,2
91.	9-(Benzil-oxi)-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	393,51	291,3 (M+ H-OBenzil)
92.	8-Metil-7-nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	346,41	347,3
93.	7,9-Diklór-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	356,28	356,2/358,2
94.	9-Klór-4-fenil-2-(piridin-2-il)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]piridin	389,83	390,3/392,2
95.	8-Metil-9-nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	346,41	347,1
96.	7-Nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	332,38	333,2
97.	9-Nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	332,38	333,2
98.	7-Bróm-9-nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	411,28	413,1/416,2

A példa száma	A vegyület neve	MS	
		számított	talált
99.	7,9-Dibróm-6-metil-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	459,2	458,1/460,0/ 462,0
100.	7,9-Dibróm-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	445,18	444,2/446,1/ 448,0
101.	4-Fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-9-karbonsav	363,44	364,2
102.	7-Metil-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	333,45	334,2
103.	9-(Benzil-oxi)-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	425,55	426,2
104.	8-Metil-7-nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	378,45	379,2
105.	6-Klór-9-nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	398,87	399,1/400,0
106.	7,9-Diklór-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	388,32	388,2/390,1
107.	9-Klór-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	421,88	422,2/424,1/ 425,1
108.	8-Metil-9-nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	387,45	379,2
109.	7-Nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	364,42	365,2
110.	7-Bróm-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	398,33	398,1/400,1/ 401,1
111.	9-Nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	364,42	365,2
112.	7-Bróm-9-metil-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	412,36	414,1/415,1
113.	4-Fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-9-ol	412,36	414,1
114.	7-Klór-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	335,43	353,2/356,1 (M+H <sub>2</sub> O)
115.	4-Fenilszulfanil-6-propil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	335,43	336,2



A példa száma	A vegyület neve	MS	
		számított	talált
116.	7,9-Dibróm-6-metil-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	491,25	492,1
117.	4-Fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	387,43	388,2
118.	7,9-Dibróm-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin	477,23	476,1/478,0/ 480,0
119.	1-Fenilszulfanil-3-(piridin-2-il)-2,3-dihidro-1H-pirimido[1,2-a]kinolin-10-ol	385,49	386,2
120.	2-Metil-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin	289,39	288,4
121.	2,4-Diklór-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin	344,26	344,3/361,2/ 363,2 (M+H <sub>2</sub> O)
122.	4-Klór-6-(piridin-2-il)-2-(trifluor-metil)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin	377,81	378,3/395,2/ 397,1 (M+H <sub>2</sub> O)
123.	2-Nitro-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin	320,35	338,2 (M+H <sub>2</sub> O)
124.	4-Nitro-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin	320,35	338,2 (M+H <sub>2</sub> O)
125.	2-Klór-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin	309,81	307,4/327,2 (M+H <sub>2</sub> O)
126.	1-Propil-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin	317,45	335,3 (M+H <sub>2</sub> O)
127.	2,4-Dibróm-2-metil-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin	447,18	446,2/448,2/ 450,1
128.	6-(Piridin-2-il)-7-(trifluor-metil)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin	343,36	361,2 (M+H <sub>2</sub> O)
129.	1,4-Metano-5-(piridin-2-il)-1,4a,5,12c-tetrahidro-4H-6,12b-diaza-benzo[c]fenantrén-12-ol	341,43	324,1
130.	1,4-Metano-5-(piridin-2-il)-1,4a,5,12c-tetrahidro-4H-6,12b-diaza-benzo[c]fenantrén	325,42	324,2
131.	6-(Piridin-2-il)-7,10-metano-6,7,10,10a-tetrahidro-6H-izokino[2,1-a]kinazolin	325,42	324,2



132. példa

Gyógyászati készítmény előállítása

1 g 4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-hidrokloridot szobahőmérsékleten 1 liter injekciós célokra alkalmas vízben oldotunk, majd az oldatot nátrium-klorid hozzáadásával izotóniássá tettük.



### Szabadalmi igénypontok

1. (I) általános képletű vegyületek és gyógyászatiilag alkalmazható sóik - a képletben

$R^1$  és  $R^2$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,  $-OR^{10}$  csoport,  $-SH$  csoport,  $-SR^{10}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik hidrogénatomot jelent, és a másik hidrogénatomtól eltérő jelentésű, azzal azonban, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik arilcsoportot jelent, akkor a másik hidrogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy



egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^3$  és  $R^4$  közül legalább az egyik hidrogénatomot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt  $W$  csoportot alkot, míg  $R^1$  és  $R^2$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, és  $R^3$  és  $R^4$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, ahol  $W$   $\alpha'$ -( $CH_2$ ) $_n$ - $\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 vagy 10),  $\alpha'$ -CH=CH- $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ -CH=CH- $CH_2$ - $CH_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ - $CH_2$ -CH=CH- $CH_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ - $CH_2$ - $CH_2$ -CH=CH- $CH_2$ - $CH_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ -O-( $CH_2$ ) $_n$ - $\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 2, 3, 4, 5 vagy 6), (A) képletű csoportot, (B) képletű csoportot, (C) képletű csoportot (amelyben X jelentése - $CH_2$ -, -O- vagy -S-), (D) képletű csoportot vagy (E) képletű csoportot jelent, amely csoportok az  $\alpha'$ -vel jelölt végükkel az (I) általános képletben  $\alpha$ -val jelölt szénatomhoz, a  $\beta'$ -vel jelölt végükkel pedig az (I) általános képletben  $\beta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódnak;

$R^5$  jelentése -C(=O) $R^{11}$  csoport, -COOH csoport, -COOR<sup>12</sup> csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálat-



lan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport; és

$R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub>, NHR<sup>13</sup>, nitro-, hidroxil-, merkapto-, O-(1-8 szénatomos alkil)- vagy S(O)<sub>p</sub>-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és p értéke 0, 1 vagy 2; O-aril- vagy S(O)<sub>q</sub>-aril-csoport, amelyekben az arilcsoportok szubsztituátlanok vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak lehetnek, és q értéke 0, 1 vagy 2; O-(1-6 szénatomos alkil)-aril- vagy S(O)<sub>r</sub>-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, amelyekben az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok, míg az arilcsoportok szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és r értéke 0, 1 vagy 2; -COOH csoport; -C(=O)R<sup>14</sup> csoport; egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport; CF<sub>3</sub> csoport; telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-csoport; 3-, 4-, 5-, 6- vagy 7-tagú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heterociklil-csoport; szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport; vagy szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport; vagy



$R^8$  és  $R^9$  jelentése a fenti, és  $R^6$  és  $R^7$  együtt  $Q$  csoportot alkot, ahol  $Q$  egy  $\gamma'$ - $CR^{15}=CR^{16}-CR^{17}=CR^{18}$ - $\delta'$  csoportot jelent, ami a  $\delta'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\delta$ -val jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódik; vagy

$R^7$  és  $R^8$  jelentése a fenti, és  $R^6$  és  $R^9$  együtt  $T$  csoportot alkot, ahol  $T$  egy  $\gamma'$ - $CR^{19}=CR^{20}-CR^{21}=CR^{22}$ - $\varepsilon'$  vagy  $\gamma'$ - $N=CR^{20}-CR^{21}=N$ - $\varepsilon'$  csoportot jelent, amelyek az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végüknél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végüknél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak; vagy

$R^6$  és  $R^7$  jelentése a fenti, és  $R^8$  és  $R^9$  együtt  $U$  csoportot alkot, ahol  $U$  egy  $\eta'$ - $CR^{19}=CR^{20}-CR^{21}=CR^{22}$ - $\varepsilon'$  csoportot jelent, ami az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\eta'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\eta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódik;

és a fenti meghatározásokban szereplő általános szimbólumok közül

$R^{10}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;



$R^{11}$  jelentése amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{12}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{13}$  -C(=O)CH<sub>3</sub> csoportot, -C(=O)fenil-csoportot, -C(=O)O-terc-butil- (t-BOC) csoportot vagy más szokásos amino-védőcsoportot jelent;

$R^{14}$  jelentése hidrogénatom, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elága-



zó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkilcsoportot tartalmazó O-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált cikloalkilcsoportot tartalmazó O-(3-8 szénatomos cikloalkil)-csoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoportot tartalmazó O-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített O-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  és  $R^{18}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport; és

$R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$  és  $R^{22}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport -,

azzal a megszorítással, hogy a következő vegyületek nem tartoznak az (I) általános képletű vegyületek körébe:

6-klór-2-(4-nitro-fenil)-4-fenil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,



2-(4-nitro-fenil)-4-fenil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
2-(2-nitro-fenil)-4-fenil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
2-(4-nitro-fenil)-4-(4-tolil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
2-(4-klór-fenil)-4-(4-tolil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
4-etoxi-2-fenil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
4-etoxi-2-(2-hidroxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
4-etoxi-2-propil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
4-propil-2,3,3a,4,5,10a-hexahidro-2H-pirido[1,2-a]furo[3,2-e]pirimidin, és  
4-propil-2,4,4a,5,6,11a-hexahidro-2H-pirido[1,2-a]pirano[3,2-e]pirimidin.

2. Az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek és gyógyászatilag alkalmazható sóik racemátjaik, tiszta enantiomerjeik, valamint az enantiomereket vagy diasztereomereket tetszőleges arányban tartalmazó elegyeik formájában.

3. Az 1. vagy 2. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek és gyógyászatilag alkalmazható sóik, amelyekben

$R^1$  és  $R^2$  egyike  $-OR^{10}$ ,  $-SR^{10}$ , 1-6 szénatomos alkil- vagy arilcsoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  egyike hidrogénatomot vagy 1-6 szénatomos alkilcsoportot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt W csoportot alkot, ahol W (B) vagy (E) csoportot jelent, és  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  közül a fennmaradt két csoport hidrogénatomot vagy 1-6 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^5$  3-6 szénatomos cikloalkil-, heteroaril-,  $C(=O)R^{11}$ ,  $-COOH$  vagy  $-COOR^{12}$  csoportot jelent;

$R^6$  hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatomot vagy ciano-, nitro-,  $C(=O)R^{14}$ , 1-6 szénatomos alkil-, trifluor-metil- vagy arilcsoportot jelent;

$R^7$  hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatomot vagy ciano-, amino-, hidroxil- vagy 1-6 szénatomos alkilcsoportot jelent; vagy

$R^6$  és  $R^7$  együtt egy Q csoportot alkot, ahol Q  $\gamma'-CR^{15}=CR^{16}-CR^{17}=CR^{18}-\delta'$  csoportot jelent;



$R^8$  hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatomot vagy ciano-, nitro-, O-(1-6 szénatomos alkil)-aril-, karboxil-,  $-\text{CONH}_2$  vagy 1-6 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^9$  hidrogénatomot vagy hidroxil-, trifluor-metil- vagy 1-6 szénatomos alkilcsoportot jelent; vagy

$R^8$  és  $R^9$  együtt U csoportot alkot, ahol U  $\eta^1\text{-CH=CH-CH=CH-}\varepsilon'$  csoportot jelent;

és a fenti csoportokban

$R^{10}$  1-8 szénatomos alkil- vagy arilcsoportot jelent;

$R^{11}$  arilcsoportot jelent;

$R^{14}$  O-(1-6 szénatomos alkil)-csoportot jelent; és

$R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  és  $R^{18}$  közül az egyik hidrogénatomot vagy hidroxilcsoportot jelent, míg a fennmaradt három szubsztituens hidrogénatomot képvisel.

4. A 3. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek és gyógyászatilag alkalmazható sóik, amelyekben

$R^1$  és  $R^2$  egyike  $-\text{O}-(\text{CH}_2)_2\text{OH}$ ,  $-\text{S}$ -fenil-,  $-\text{CH}_3$ , fenil-, 3-metil-fenil-, 3,4-dimetil-fenil-, 4-fluor-fenil-, 4-hidroxi-fenil-, 4-metoxi-fenil-, 4-hidroxi-3-metoxi-fenil- vagy 2-naftil-csoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  egyike hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt W csoportot alkot, ahol W (B) vagy (E) csoportot jelent, és  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  közül a fennmaradt két csoport hidrogénatomot jelent;

$R^5$  ciklopropil-, 2-(etoxi-karbonil)-ciklopropil-, ciklohexil-, 2-piridinil-, 5-metil-furan-2-il-, 5-nitro-furan-2-il-,  $\text{C}(=\text{O})$ fenil, karboxil- vagy etoxi-karbonil-csoportot jelent;

$R^6$  hidrogén-, klór- vagy brómatomot vagy ciano-, nitro-, etoxi-karbonil-, metil-, trifluor-metil- vagy fenilcsoportot jelent;

$R^7$  hidrogén- vagy klóratomot vagy ciano-, amino-, hidroxil-, metil- vagy n-propil-csoportot jelent; vagy

$R^6$  és  $R^7$  együtt egy Q csoportot alkot, ahol Q  $\gamma^1\text{-CH=CH-CH=CR}^{18}\text{-}\delta'$  csoportot jelent;



R<sup>8</sup> hidrogén-, klór- vagy brómatomot vagy ciano-, nitro-, O-CH<sub>2</sub>-fenil-, karboxil- vagy metilcsoportot jelent;

R<sup>9</sup> hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelent; vagy

R<sup>8</sup> és R<sup>9</sup> együtt U csoportot alkot, ahol U η'-CH=CH-CH=CH-ε' csoportot jelent; és a fenti csoportokban

R<sup>18</sup> hidrogénatomot vagy hidroxilcsoportot jelent.

5. Az 1-4. igénypontok bármelyike szerinti vegyületek következő képviselői és azok gyógyászatilag alkalmazható sói:

9-klór-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

9-klór-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter,

7,9-diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter,

7,9-dibróm-3-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter,

4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter,

7,9-diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter,

4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter,

7,9-diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7,9-diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,



7-bróm-4-(4-metoxi-fenil)-9-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,  
7,9-diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-2-(5-nitro-furan-2-il) 3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimi-  
din,  
7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]piri-  
midin,  
4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-nitro-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7,9-diklór-4-(4-metoxi-fenil)-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
2-[7,9-diklór-4-(2,4-dimetil-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-  
-karbonsav-etil-észter,  
2-[9-klór-4-(2,4-dimetil-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-  
-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,  
2-[7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopro-  
pán-karbonsav-etil-észter,  
2-[7,9-diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-  
-karbonsav-etil-észter,  
2-[7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-  
-karbonsav-etil-észter,  
2-[9-klór-4-(4-metoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-  
-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,  
2-[4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-kar-  
bonsav-etil-észter,  
4-(4-hidroxi-fenil)-3-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-e-  
til-észter,  
7,9-diklór-4-fenilszulfanil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,  
7-nitro-4-fenilszulfanil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,  
7,9-diklór-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-  
-karbonsav,



7,9-dibróm-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7,9-dibróm-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

9-klór-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7,9-diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter,

7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

9-klór-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7-bróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-9-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7,9-diklór-4-(4-hidroxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7,9-dibróm-4-(4-hidroxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7,9-diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,

9-klór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,



4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,  
7,9-diklór-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,  
7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,  
7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,  
9-klór-4-(4-metoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,  
4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,  
[7,9-diklór-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon,  
[7,9-dibróm-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon,  
[7,9-dibróm-4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon,  
[4-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-3-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon,  
[4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon,  
[7,9-dibróm-4-(4-hidroxi-fenil)-3,6-dimetil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon,  
[7,9-diklór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon,  
[7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon,  
[7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon,  
[9-klór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-



-fenil-metanon,

[4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon,

[4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-fenil-metanon,

2-(7,9-diklór-2-ciklopropil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol,

2-(7,9-dibróm-2-ciklopropil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol,

2-[9-klór-2-ciklopropil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi]-etanol,

2-(2-ciklopropil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol,

9-klór-2-ciklopropil-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,

7,9-dibróm-2-ciklopropil-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,

9-klór-2-ciklopropil-4-(4-metoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,

2-ciklopropil-4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,

2-(7,9-diklór-2-ciklohexil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol,

2-(7,9-dibróm-2-ciklohexil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol,

2-(7,9-dibróm-2-ciklohexil-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol,

2-[9-klór-2-ciklohexil-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxil]-etanol,

2-(2-ciklohexil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-4-il-oxi)-etanol,

7,9-diklór-2-ciklohexil-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,

7,9-diklór-2-ciklohexil-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,

7,9-dibróm-2-ciklohexil-4-(4-metoxi-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,

9-klór-2-ciklohexil-4-(4-metoxi-fenil)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,

7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav-etil-észter,



7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-karbonsav,  
7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
2-[7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-3-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,  
7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
4-(4-metoxi-fenil)-7-nitro-2-(5-nitro-furan-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
2-[7,9-dibróm-4-(2,4-dimetil-fenil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,  
2-[7,9-dibróm-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,  
2-[9-klór-4-(3,4-dimetoxi-fenil)-7-(trifluor-metil) 3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,  
2-[7,9-dibróm-4-(4-metoxi-fenil)-6-metil-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,  
2-[4-(4-fluor-fenil)-4-metil-7-nitro-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il]-ciklopropán-karbonsav-etil-észter,  
9-(benzil-oxi)-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
8-metil-7-nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7,9-diklór-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
9-klór-4-fenil-2-(piridin-2-il)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
8-metil-9-nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7-nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
9-nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7-bróm-9-nitro-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,



7,9-dibróm-6-metil-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7,9-dibróm-4-fenil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-9-karbonsav,  
7-metil-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
9-(benzil-oxi)-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
8-metil-7-nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
6-klór-9-nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7,9-diklór-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
9-klór-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimi-  
din,  
8-metil-9-nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7-nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7-bróm-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
9-nitro-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7-bróm-9-metil-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin-9-ol,  
7-klór-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
4-fenilszulfanil-6-propil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7,9-dibróm-6-metil-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-7-(trifluor-metil)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
7,9-dibróm-4-fenilszulfanil-2-(piridin-2-il)-3,4-dihidro-2H-pirido[1,2-a]pirimidin,  
1-fenilszulfanil-3-(piridin-2-il)-2,3-dihidro-1H-pirimido[1,2-a]kinolin-10-ol,  
2-metil-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
2,4-diklór-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
4-klór-6-(piridin-2-il)-2-(trifluor-metil)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-piri-  
do[1,2-a]kinazolin,  
2-nitro-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,



4-nitro-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
2-klór-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
1-propil-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
2,4-dibróm-1-metil-6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
6-(piridin-2-il)-2-(trifluor-metil)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-pirido[1,2-a]kinazolin,  
1,4-metano-5-(piridin-2-il)-1,4a,5,12c-tetrahidro-4H-6,12b-diaza-benzo[c]fenantrén-12-ol,  
1,4-metano-5-(piridin-2-il)-1,4a,5,12c-tetrahidro-4H-6,12b-diaza-benzo[c]fenantrén,  
és  
6-(piridin-2-il)-7,10-metano-6a,7,10,10a-tetrahidro-6H-izokino[2,1-a]kinazolin.

6. Eljárás az (I) általános képletű vegyületek és gyógyászatilag alkalmazható sóik előállítására - a képletben

$R^1$  és  $R^2$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,  $-OR^{10}$  csoport,  $-SH$  csoport,  $-SR^{10}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport,



mimellett  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik hidrogénatomot jelent, és a másik hidrogénatomtól eltérő jelentésű, azzal azonban, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik arilcsoportot jelent, akkor a másik hidrogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^3$  és  $R^4$  közül legalább az egyik hidrogénatomot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt  $W$  csoportot alkot, míg  $R^1$  és  $R^2$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, és  $R^3$  és  $R^4$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, ahol  $W$   $\alpha'-(CH_2)_n-\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 vagy 10),  $\alpha'-CH=CH-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH=CH-CH_2-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH_2-CH=CH-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-O-(CH_2)_n-\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 2, 3, 4, 5 vagy 6), (A) képletű csoportot, (B) képletű csoportot, (C) képletű cso-



portot (amelyben X jelentése  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{O}-$  vagy  $-\text{S}-$ ), (D) képletű csoportot vagy (E) képletű csoportot jelent, amely csoportok az  $\alpha'$ -vel jelölt végükkel az (I) általános képletben  $\alpha$ -val jelölt szénatomhoz, a  $\beta'$ -vel jelölt végükkel pedig az (I) általános képletben  $\beta$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak;

$\text{R}^5$  jelentése  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{11}$  csoport,  $-\text{COOH}$  csoport,  $-\text{COOR}^{12}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport; és

$\text{R}^6$ ,  $\text{R}^7$ ,  $\text{R}^8$  és  $\text{R}^9$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, amino-,  $\text{NH}$ (1-6 szénatomos alkil),  $\text{N}$ (1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>,  $\text{NH}$ [(1-6 szénatomos alkil)-aril],  $\text{N}$ [(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub>,  $\text{NHR}^{13}$ , nitro-, hidroxil-, merkapto-,  $\text{O}$ -(1-8 szénatomos alkil)- vagy  $\text{S}(\text{O})_p$ -(1-8 szénatomos alkil)-csoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és p értéke 0, 1 vagy 2;  $\text{O}$ -aril- vagy  $\text{S}(\text{O})_q$ -aril-csoport, amelyekben az arilcsoportok szubsztituálatlanok vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak lehetnek, és q értéke 0, 1 vagy 2;  $\text{O}$ -(1-6 szénatomos alkil)-aril- vagy  $\text{S}(\text{O})_r$ -(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, amelyekben az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú,



telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok, míg az arilcsoportok szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és  $r$  értéke 0, 1 vagy 2;  $-\text{COOH}$  csoport;  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{14}$  csoport; egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport;  $\text{CF}_3$  csoport; telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-csoport; 3-, 4-, 5-, 6- vagy 7-tagú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heterociklil-csoport; szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport; vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport; vagy

$\text{R}^8$  és  $\text{R}^9$  jelentése a fenti, és  $\text{R}^6$  és  $\text{R}^7$  együtt  $\text{Q}$  csoportot alkot, ahol

$\text{Q}$  egy  $\gamma'-\text{CR}^{15}=\text{CR}^{16}-\text{CR}^{17}=\text{CR}^{18}-\delta'$  csoportot jelent, ami a  $\delta'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\delta$ -val jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódik; vagy

$\text{R}^7$  és  $\text{R}^8$  jelentése a fenti, és  $\text{R}^6$  és  $\text{R}^9$  együtt  $\text{T}$  csoportot alkot, ahol

$\text{T}$  egy  $\gamma'-\text{CR}^{19}=\text{CR}^{20}-\text{CR}^{21}=\text{CR}^{22}-\varepsilon'$  vagy  $\gamma'-\text{N}=\text{CR}^{20}-\text{CR}^{21}=\text{N}-\varepsilon'$  csoportot jelent, amelyek az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végükénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végükénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak; vagy

$\text{R}^6$  és  $\text{R}^7$  jelentése a fenti, és  $\text{R}^8$  és  $\text{R}^9$  együtt  $\text{U}$  csoportot alkot, ahol

$\text{U}$  egy  $\eta'-\text{CR}^{19}=\text{CR}^{20}-\text{CR}^{21}=\text{CR}^{22}-\varepsilon'$  csoportot jelent, ami az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\eta'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\eta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódik;

és a fenti meghatározásokban szereplő általános szimbólumok közül

$\text{R}^{10}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcso-



port, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{11}$  jelentése amino-,  $NH(1-6 \text{ szénatomos alkil})$ ,  $N(1-6 \text{ szénatomos alkil})_2$ ,  $NH[(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}]$ ,  $N[(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}]_2$  vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{12}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcso-



port, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{13}$  -C(=O)CH<sub>3</sub> csoportot, -C(=O)fenil-csoportot, -C(=O)O-terc-butil- (t-BOC) csoportot vagy más szokásos amino-védőcsoportot jelent;

$R^{14}$  jelentése hidrogénatom, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkilcsoportot tartalmazó O-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált cikloalkilcsoportot tartalmazó O-(3-8 szénatomos cikloalkil)-csoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoportot tartalmazó O-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített O-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;



$R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  és  $R^{18}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport; és

$R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$  és  $R^{22}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport -, azzal *jellemezve*, hogy egy (II) általános képletű heteroaril-amint - a képletben  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése a fenti, azzal a megkötéssel, hogy ha  $R^6$  és  $R^7$  együtt Q csoportot alkot, ez a  $\gamma'$ -vel jelölt végénél a (II) általános képletű heteroaril-amin  $\gamma$ -val jelölt szénatomjához és  $\delta'$ -vel jelölt végével a (II) általános képletű heteroaril-amin  $\delta$ -val jelölt szénatomjához kapcsolódik; ha  $R^6$  és  $R^9$  együtt T csoportot alkot, ez a  $\gamma'$ -vel jelölt végénél a (II) általános képletű heteroaril-amin  $\gamma$ -val jelölt szénatomjához és  $\varepsilon'$ -vel jelölt végével a (II) általános képletű heteroaril-amin  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomjához kapcsolódik, és ha  $R^8$  és  $R^9$  együtt U csoportot alkot, ez az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végével a (II) általános képletű heteroaril-amin  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomjához és  $\eta'$ -vel jelölt végével a (II) általános képletű heteroaril-amin  $\eta$ -vel jelölt szénatomjához kapcsolódik - sav jelenlétében egy (III) általános képletű aldehiddel - a képletben  $R^5$  jelentése a fenti - és egy (IV) általános képletű olefinnel - a képletben  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  jelentése a fenti, azzal a megkötéssel, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt W csoportot alkot, ez az  $\alpha'$ -vel jelölt végével a (IV) általános képletű olefin  $\alpha$ -val jelölt szénatomjához és  $\beta'$ -vel jelölt végével a (IV) általános képletű olefin  $\beta$ -val jelölt szénatomjához kapcsolódik - reagáltatunk.

7. A 6. igénypont szerinti eljárás, azzal *jellemezve*, hogy a (II) általános képletű heteroaril-amint egyedényes eljárásban reagáltatjuk a (III) általános képletű aldehiddel és a (IV) általános képletű olefinnel.



8. A 6. vagy 7. igénypont szerinti eljárás, azzal *jellemezve*, hogy savként trifluor-ecetsavat használunk.

9. A 6-8. igénypontok bármelyike szerinti eljárás, azzal *jellemezve*, hogy a reakciót szerves oldószerben, 0-100°C hőmérsékleten, 0,24-12 órás reakcióidő alatt hajtjuk végre.

10. A 6-9. igénypontok bármelyike szerinti eljárás, azzal *jellemezve*, hogy a reakciót 15-40°C hőmérsékleten végezzük.

11. A 6-10. igénypontok bármelyike szerinti eljárás, azzal *jellemezve*, hogy szerves oldószerként acetonitrilt használunk.

12. Anyagkönyvtár, amely legalább egy (I) általános képletű vegyületet tartalmaz - a képletben

$R^1$  és  $R^2$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,  $-OR^{10}$  csoport,  $-SH$  csoport,  $-SR^{10}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik hidrogénatomot jelent, és a másik hidrogénatomtól eltérő jelentésű, azzal azonban, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik arilcsoportot jelent, akkor a másik hidrogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent;



$R^3$  és  $R^4$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^3$  és  $R^4$  közül legalább az egyik hidrogénatomot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt  $W$  csoportot alkot, míg  $R^1$  és  $R^2$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, és  $R^3$  és  $R^4$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, ahol  $W$   $\alpha'$ -( $CH_2$ ) $_n$ - $\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 vagy 10),  $\alpha'$ -CH=CH- $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ -CH=CH- $CH_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ -CH=CH- $CH_2$ - $CH_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ - $CH_2$ -CH=CH- $CH_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ - $CH_2$ - $CH_2$ -CH=CH- $CH_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ -O-( $CH_2$ ) $_n$ - $\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 2, 3, 4, 5 vagy 6), (A) képletű csoportot, (B) képletű csoportot, (C) képletű csoportot (amelyben X jelentése - $CH_2$ -, -O- vagy -S-), (D) képletű csoportot vagy (E) képletű csoportot jelent, amely csoportok az  $\alpha'$ -vel jelölt végükkel az (I) általános képlet-



ben  $\alpha$ -val jelölt szénatomhoz, a  $\beta'$ -vel jelölt végükkel pedig az (I) általános képletben  $\beta$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak;

$R^5$  jelentése  $-C(=O)R^{11}$  csoport,  $-COOH$  csoport,  $-COOR^{12}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport; és

$R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, amino-,  $NH(1-6$  szénatomos alkil),  $N(1-6$  szénatomos alkil) $_2$ ,  $NH[(1-6$  szénatomos alkil)-aril],  $N[(1-6$  szénatomos alkil)-aril] $_2$ ,  $NHR^{13}$ , nitro-, hidroxil-, merkaptó-,  $O-(1-8$  szénatomos alkil)- vagy  $S(O)_p-(1-8$  szénatomos alkil)-csoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és  $p$  értéke 0, 1 vagy 2;  $O$ -aril- vagy  $S(O)_q$ -aril-csoport, amelyekben az arilcsoportok szubsztituátlanok vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak lehetnek, és  $q$  értéke 0, 1 vagy 2;  $O-(1-6$  szénatomos alkil)-aril- vagy  $S(O)_r-(1-6$  szénatomos alkil)-aril-csoport, amelyekben az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok, míg az arilcsoportok szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy



többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és  $r$  értéke 0, 1 vagy 2;  $-\text{COOH}$  csoport;  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{14}$  csoport; egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport;  $\text{CF}_3$  csoport; telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-csoport; 3-, 4-, 5-, 6- vagy 7-tagú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heterociklil-csoport; szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport; vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport; vagy

$\text{R}^8$  és  $\text{R}^9$  jelentése a fenti, és  $\text{R}^6$  és  $\text{R}^7$  együtt  $\text{Q}$  csoportot alkot, ahol  $\text{Q}$  egy  $\gamma'-\text{CR}^{15}=\text{CR}^{16}-\text{CR}^{17}=\text{CR}^{18}-\delta'$  csoportot jelent, ami a  $\delta'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\delta$ -val jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódik; vagy

$\text{R}^7$  és  $\text{R}^8$  jelentése a fenti, és  $\text{R}^6$  és  $\text{R}^9$  együtt  $\text{T}$  csoportot alkot, ahol  $\text{T}$  egy  $\gamma'-\text{CR}^{19}=\text{CR}^{20}-\text{CR}^{21}=\text{CR}^{22}-\varepsilon'$  vagy  $\gamma'-\text{N}=\text{CR}^{20}-\text{CR}^{21}=\text{N}-\varepsilon'$  csoportot jelent, amelyek az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végüknél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végüknél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak; vagy

$\text{R}^6$  és  $\text{R}^7$  jelentése a fenti, és  $\text{R}^8$  és  $\text{R}^9$  együtt  $\text{U}$  csoportot alkot, ahol  $\text{U}$  egy  $\eta'-\text{CR}^{19}=\text{CR}^{20}-\text{CR}^{21}=\text{CR}^{22}-\varepsilon'$  csoportot jelent, ami az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\eta'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\eta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódik;

és a fenti meghatározásokban szereplő általános szimbólumok közül

$\text{R}^{10}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen



vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{11}$  jelentése amino-,  $NH(1-6 \text{ szénatomos alkil})$ ,  $N(1-6 \text{ szénatomos alkil})_2$ ,  $NH[(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}]$ ,  $N[(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}]_2$  vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{12}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy szubsztituátlan vagy egyszeresen



sen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{13}$  -C(=O)CH<sub>3</sub> csoportot, -C(=O)fenil-csoportot vagy -C(=O)O-terc-butil-(t-BOC) csoportot jelent;

$R^{14}$  jelentése hidrogénatom, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkilcsoportot tartalmazó O-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált cikloalkilcsoportot tartalmazó O-(3-8 szénatomos cikloalkil)-csoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoportot tartalmazó O-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített O-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  és  $R^{18}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elága-



zó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport; és

$R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$  és  $R^{22}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport.

13. Gyógyszer, ami legalább egy (I) általános képletű vegyületet vagy gyógyászatilag alkalmazható sóját tartalmazza - a képletben

$R^1$  és  $R^2$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,  $-OR^{10}$  csoport,  $-SH$  csoport,  $-SR^{10}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik hidrogénatomot jelent, és a másik hidrogénatomtól eltérő jelentésű, azzal azonban, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik arilcsoportot jelent, akkor a másik hidrogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan



vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^3$  és  $R^4$  közül legalább az egyik hidrogénatomot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt  $W$  csoportot alkot, míg  $R^1$  és  $R^2$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, és  $R^3$  és  $R^4$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, ahol  $W$   $\alpha'$ -( $CH_2$ ) $_n$ - $\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 vagy 10),  $\alpha'$ -CH=CH- $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ -CH=CH- $CH_2$ - $CH_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ - $CH_2$ -CH=CH- $CH_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ - $CH_2$ - $CH_2$ -CH=CH- $CH_2$ - $CH_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ -O-( $CH_2$ ) $_n$ - $\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 2, 3, 4, 5 vagy 6), (A) képletű csoportot, (B) képletű csoportot, (C) képletű csoportot (amelyben X jelentése - $CH_2$ -, -O- vagy -S-), (D) képletű csoportot vagy (E) képletű csoportot jelent, amely csoportok az  $\alpha'$ -vel jelölt végükkel az (I) általános képletben  $\alpha$ -val jelölt szénatomhoz, a  $\beta'$ -vel jelölt végükkel pedig az (I) általános képletben  $\beta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódnak;

$R^5$  jelentése -C(=O) $R^{11}$  csoport, -COOH csoport, -COOR<sup>12</sup> csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy



többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport; és

$R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, amino-,  $NH(1-6 \text{ szénatomos alkil})$ ,  $N(1-6 \text{ szénatomos alkil})_2$ ,  $NH[(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}]$ ,  $N[(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}]_2$ ,  $NHR^{13}$ , nitro-, hidroxil-, merkaptó-,  $O-(1-8 \text{ szénatomos alkil})$ - vagy  $S(O)_p-(1-8 \text{ szénatomos alkil})$ -csoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és  $p$  értéke 0, 1 vagy 2;  $O$ -aril- vagy  $S(O)_q$ -aril-csoport, amelyekben az arilcsoportok szubsztituálatlanok vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak lehetnek, és  $q$  értéke 0, 1 vagy 2;  $O-(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}$ - vagy  $S(O)_r-(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}$ -csoport, amelyekben az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok, míg az arilcsoportok szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és  $r$  értéke 0, 1 vagy 2;  $-COOH$  csoport;  $-C(=O)R^{14}$  csoport; egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport;  $CF_3$  csoport; telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen



vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-csoport; 3-, 4-, 5-, 6- vagy 7-tagú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heterociklil-csoport; szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport; vagy szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport; vagy

$R^8$  és  $R^9$  jelentése a fenti, és  $R^6$  és  $R^7$  együtt  $Q$  csoportot alkot, ahol

$Q$  egy  $\gamma'$ - $CR^{15}=CR^{16}-CR^{17}=CR^{18}-\delta'$  csoportot jelent, ami a  $\delta'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\delta$ -val jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódik; vagy

$R^7$  és  $R^8$  jelentése a fenti, és  $R^6$  és  $R^9$  együtt  $T$  csoportot alkot, ahol

$T$  egy  $\gamma'$ - $CR^{19}=CR^{20}-CR^{21}=CR^{22}-\varepsilon'$  vagy  $\gamma'$ - $N=CR^{20}-CR^{21}=N-\varepsilon'$  csoportot jelent, amelyek az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végüknél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végüknél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak; vagy

$R^6$  és  $R^7$  jelentése a fenti, és  $R^8$  és  $R^9$  együtt  $U$  csoportot alkot, ahol

$U$  egy  $\eta'$ - $CR^{19}=CR^{20}-CR^{21}=CR^{22}-\varepsilon'$  csoportot jelent, ami az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\eta'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\eta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódik;

és a fenti meghatározásokban szereplő általános szimbólumok közül

$R^{10}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált



aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{11}$  jelentése amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{12}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{13}$  -C(=O)CH<sub>3</sub> csoportot, -C(=O)fenil-csoportot vagy -C(=O)O-terc-butil-

(t-BOC) csoportot jelent;

$R^{14}$  jelentése hidrogénatom, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkilcsoportot tartalmazó O-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált cikloalkilcsoportot tartalmazó O-(3-8 szénatomos cikloalkil)-csoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoportot tartalmazó O-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített O-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  és  $R^{18}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport; és

$R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$  és  $R^{22}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elága-



zó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport.

14. Az (I) általános képletű vegyületek és gyógyászatilag alkalmazható sóik - a képletben

$R^1$  és  $R^2$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,  $-OR^{10}$  csoport,  $-SH$  csoport,  $-SR^{10}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik hidrogénatomot jelent, és a másik hidrogénatomtól eltérő jelentésű, azzal azonban, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik arilcsoportot jelent, akkor a másik hidrogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egy-



heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport; és

$R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, amino-,  $NH(1-6 \text{ szénatomos alkil})$ ,  $N(1-6 \text{ szénatomos alkil})_2$ ,  $NH[(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}]$ ,  $N[(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}]_2$ ,  $NHR^{13}$ , nitro-, hidroxil-, merkaptó-,  $O-(1-8 \text{ szénatomos alkil})$ - vagy  $S(O)_p-(1-8 \text{ szénatomos alkil})$ -csoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és  $p$  értéke 0, 1 vagy 2;  $O$ -aril- vagy  $S(O)_q$ -aril-csoport, amelyekben az arilcsoportok szubsztituálatlanok vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak lehetnek, és  $q$  értéke 0, 1 vagy 2;  $O-(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}$ - vagy  $S(O)_r-(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}$ -csoport, amelyekben az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok, míg az arilcsoportok szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és  $r$  értéke 0, 1 vagy 2;  $-COOH$  csoport;  $-C(=O)R^{14}$  csoport; egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport;  $CF_3$  csoport; telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-csoport; 3-, 4-, 5-, 6- vagy 7-tagú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heterociklil-csoport; szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörö-



sen szubsztituált arilcsoport; vagy szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport; vagy

$R^8$  és  $R^9$  jelentése a fenti, és  $R^6$  és  $R^7$  együtt  $Q$  csoportot alkot, ahol

$Q$  egy  $\gamma'$ - $CR^{15}=CR^{16}-CR^{17}=CR^{18}-\delta'$  csoportot jelent, ami a  $\delta'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\delta$ -val jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódik; vagy

$R^7$  és  $R^8$  jelentése a fenti, és  $R^6$  és  $R^9$  együtt  $T$  csoportot alkot, ahol

$T$  egy  $\gamma'$ - $CR^{19}=CR^{20}-CR^{21}=CR^{22}-\varepsilon'$  vagy  $\gamma'$ - $N=CR^{20}-CR^{21}=N-\varepsilon'$  csoportot jelent, amelyek az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végükénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végükénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak; vagy

$R^6$  és  $R^7$  jelentése a fenti, és  $R^8$  és  $R^9$  együtt  $U$  csoportot alkot, ahol

$U$  egy  $\eta'$ - $CR^{19}=CR^{20}-CR^{21}=CR^{22}-\varepsilon'$  csoportot jelent, ami az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\eta'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\eta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódik;

és a fenti meghatározásokban szereplő általános szimbólumok közül

$R^{10}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen



szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{11}$  jelentése amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{12}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{13}$  -C(=O)CH<sub>3</sub> csoportot, -C(=O)fenil-csoportot vagy -C(=O)O-terc-butil-(t-BOC) csoportot jelent;



**R<sup>14</sup>** jelentése hidrogénatom, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkilcsoportot tartalmazó O-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált cikloalkilcsoportot tartalmazó O-(3-8 szénatomos cikloalkil)-csoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoportot tartalmazó O-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített O-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

**R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup> és R<sup>18</sup>** jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport; és

**R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup> és R<sup>22</sup>** jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport -



felhasználása fájdalom kezelésére alkalmas gyógyszer gyártásához.

15. Az (I) általános képletű vegyületek és gyógyászatilag alkalmazható sóik - a képletben

$R^1$  és  $R^2$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,  $-OR^{10}$  csoport,  $-SH$  csoport,  $-SR^{10}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik hidrogénatomot jelent, és a másik hidrogénatomtól eltérő jelentésű, azzal azonban, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik arilcsoportot jelent, akkor a másik hidrogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy



egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^3$  és  $R^4$  közül legalább az egyik hidrogénatomot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt  $W$  csoportot alkot, míg  $R^1$  és  $R^2$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, és  $R^3$  és  $R^4$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, ahol  $W$   $\alpha'-(CH_2)_n-\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 vagy 10),  $\alpha'-CH=CH-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH=CH-CH_2-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH_2-CH=CH-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-O-(CH_2)_n-\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 2, 3, 4, 5 vagy 6), (A) képletű csoportot, (B) képletű csoportot, (C) képletű csoportot (amelyben  $X$  jelentése  $-CH_2-$ ,  $-O-$  vagy  $-S-$ ), (D) képletű csoportot vagy (E) képletű csoportot jelent, amely csoportok az  $\alpha'$ -vel jelölt végükkel az (I) általános képletben  $\alpha$ -val jelölt szénatomhoz, a  $\beta'$ -vel jelölt végükkel pedig az (I) általános képletben  $\beta$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak;

$R^5$  jelentése  $-C(=O)R^{11}$  csoport,  $-COOH$  csoport,  $-COOR^{12}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálat-



lan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport; és

$R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub>, NHR<sup>13</sup>, nitro-, hidroxil-, merkaptó-, O-(1-8 szénatomos alkil)- vagy S(O)<sub>p</sub>-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és p értéke 0, 1 vagy 2; O-aril- vagy S(O)<sub>q</sub>-aril-csoport, amelyekben az arilcsoportok szubsztituálatlanok vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak lehetnek, és q értéke 0, 1 vagy 2; O-(1-6 szénatomos alkil)-aril- vagy S(O)<sub>r</sub>-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, amelyekben az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok, míg az arilcsoportok szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és r értéke 0, 1 vagy 2; -COOH csoport; -C(=O)R<sup>14</sup> csoport; egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport; CF<sub>3</sub> csoport; telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-csoport; 3-, 4-, 5-, 6- vagy 7-tagú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heterociklil-csoport; szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport; vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport; vagy



$R^8$  és  $R^9$  jelentése a fenti, és  $R^6$  és  $R^7$  együtt  $Q$  csoportot alkot, ahol  $Q$  egy  $\gamma'$ - $CR^{15}=CR^{16}-CR^{17}=CR^{18}-\delta'$  csoportot jelent, ami a  $\delta'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\delta$ -val jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódik; vagy

$R^7$  és  $R^8$  jelentése a fenti, és  $R^6$  és  $R^9$  együtt  $T$  csoportot alkot, ahol  $T$  egy  $\gamma'$ - $CR^{19}=CR^{20}-CR^{21}=CR^{22}-\varepsilon'$  vagy  $\gamma'$ - $N=CR^{20}-CR^{21}=N-\varepsilon'$  csoportot jelent, amelyek az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végüknél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végüknél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak; vagy

$R^6$  és  $R^7$  jelentése a fenti, és  $R^8$  és  $R^9$  együtt  $U$  csoportot alkot, ahol  $U$  egy  $\eta'$ - $CR^{19}=CR^{20}-CR^{21}=CR^{22}-\varepsilon'$  csoportot jelent, ami az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\eta'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\eta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódik;

és a fenti meghatározásokban szereplő általános szimbólumok közül

$R^{10}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;



$R^{11}$  jelentése amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{12}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{13}$  -C(=O)CH<sub>3</sub> csoportot, -C(=O)fenil-csoportot vagy -C(=O)O-terc-butil-(t-BOC) csoportot jelent;

$R^{14}$  jelentése hidrogénatom, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elága-



zó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkilcsoportot tartalmazó O-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált cikloalkilcsoportot tartalmazó O-(3-8 szénatomos cikloalkil)-csoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoportot tartalmazó O-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített O-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  és  $R^{18}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport; és

$R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$  és  $R^{22}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport -

felhasználása vizeletvisszatartási képtelenség, viszketegség, tinnitus aurium és/vagy hasmenés kezelésére alkalmas gyógyszer gyártásához.



16. Gyógyászati készítmény, amely legalább egy (I) általános képletű vegyületet vagy gyógyászatiilag alkalmazható sóját tartalmazza - a képletben

$R^1$  és  $R^2$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,  $-OR^{10}$  csoport,  $-SH$  csoport,  $-SR^{10}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik hidrogénatomot jelent, és a másik hidrogénatomtól eltérő jelentésű, azzal azonban, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik arilcsoportot jelent, akkor a másik hidrogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituátlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos



alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^3$  és  $R^4$  közül legalább az egyik hidrogénatomot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt **W** csoportot alkot, míg  $R^1$  és  $R^2$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, és  $R^3$  és  $R^4$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, ahol **W**  $\alpha'-(CH_2)_n-\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 vagy 10),  $\alpha'-CH=CH-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH=CH-CH_2-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH_2-CH=CH-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-O-(CH_2)_n-\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 2, 3, 4, 5 vagy 6), (A) képletű csoportot, (B) képletű csoportot, (C) képletű csoportot (amelyben X jelentése  $-CH_2-$ ,  $-O-$  vagy  $-S-$ ), (D) képletű csoportot vagy (E) képletű csoportot jelent, amely csoportok az  $\alpha'$ -vel jelölt végükkel az (I) általános képletben  $\alpha$ -val jelölt szénatomhoz, a  $\beta'$ -vel jelölt végükkel pedig az (I) általános képletben  $\beta$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak;

$R^5$  jelentése  $-C(=O)R^{11}$  csoport,  $-COOH$  csoport,  $-COOR^{12}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálat-



lan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport; és

$R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, amino-,  $NH(1-6 \text{ szénatomos alkil})$ ,  $N(1-6 \text{ szénatomos alkil})_2$ ,  $NH[(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}]$ ,  $N[(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}]_2$ ,  $NHR^{13}$ , nitro-, hidroxil-, merkaptó-,  $O(1-8 \text{ szénatomos alkil})$ - vagy  $S(O)_p(1-8 \text{ szénatomos alkil})$ -csoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és  $p$  értéke 0, 1 vagy 2;  $O$ -aril- vagy  $S(O)_q$ -aril-csoport, amelyekben az arilcsoportok szubsztituálatlanok vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak lehetnek, és  $q$  értéke 0, 1 vagy 2;  $O(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}$ - vagy  $S(O)_r(1-6 \text{ szénatomos alkil})\text{-aril}$ -csoport, amelyekben az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok, míg az arilcsoportok szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és  $r$  értéke 0, 1 vagy 2;  $-COOH$  csoport;  $-C(=O)R^{14}$  csoport; egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport;  $CF_3$  csoport; telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-csoport; 3-, 4-, 5-, 6- vagy 7-tagú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heterociklil-csoport; szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport; vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport; vagy

$R^8$  és  $R^9$  jelentése a fenti, és  $R^6$  és  $R^7$  együtt  $Q$  csoportot alkot, ahol



**Q** egy  $\gamma'$ -CR<sup>15</sup>=CR<sup>16</sup>-CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>- $\delta'$  csoportot jelent, ami a  $\delta'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\delta$ -val jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódik; vagy

**R<sup>7</sup>** és **R<sup>8</sup>** jelentése a fenti, és **R<sup>6</sup>** és **R<sup>9</sup>** együtt **T** csoportot alkot, ahol

**T** egy  $\gamma'$ -CR<sup>19</sup>=CR<sup>20</sup>-CR<sup>21</sup>=CR<sup>22</sup>- $\varepsilon'$  vagy  $\gamma'$ -N=CR<sup>20</sup>-CR<sup>21</sup>=N- $\varepsilon'$  csoportot jelent, amelyek az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végükénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végükénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak; vagy

**R<sup>6</sup>** és **R<sup>7</sup>** jelentése a fenti, és **R<sup>8</sup>** és **R<sup>9</sup>** együtt **U** csoportot alkot, ahol

**U** egy  $\eta'$ -CR<sup>19</sup>=CR<sup>20</sup>-CR<sup>21</sup>=CR<sup>22</sup>- $\varepsilon'$  csoportot jelent, ami az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\eta'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\eta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódik;

és a fenti meghatározásokban szereplő általános szimbólumok közül

**R<sup>10</sup>** jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

**R<sup>11</sup>** jelentése amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos



alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{12}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{13}$  -C(=O)CH<sub>3</sub> csoportot, -C(=O)fenil-csoportot vagy -C(=O)O-terc-butil-(t-BOC) csoportot jelent;

$R^{14}$  jelentése hidrogénatom, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy



egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkilcsoportot tartalmazó O-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált cikloalkilcsoportot tartalmazó O-(3-8 szénatomos cikloalkil)-csoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoportot tartalmazó O-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített O-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  és  $R^{18}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport; és

$R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$  és  $R^{22}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport -, legalább egy gyógyszerészeti segédanyaggal együtt.

17. Eljárás emlős állatok és/vagy emberek fájdalmas állapotainak kezelésére, azzal *jellemezve*, hogy a kezelendő egyednek terápiásan hatásos mennyiségben egy (I) általános képletű vegyületet vagy gyógyászatilag alkalmazható sóját adjuk be - a képletben



$R^1$  és  $R^2$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,  $-OR^{10}$  csoport,  $-SH$  csoport,  $-SR^{10}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik hidrogénatomot jelent, és a másik hidrogénatomtól eltérő jelentésű, azzal azonban, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik arilcsoportot jelent, akkor a másik hidrogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztitu-



álatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^3$  és  $R^4$  közül legalább az egyik hidrogénatomot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt  $W$  csoportot alkot, míg  $R^1$  és  $R^2$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, és  $R^3$  és  $R^4$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, ahol  $W$   $\alpha'-(CH_2)_n-\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 vagy 10),  $\alpha'-CH=CH-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH=CH-CH_2-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH_2-CH=CH-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-\beta'$  csoportot,  $\alpha'-O-(CH_2)_n-\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 2, 3, 4, 5 vagy 6), (A) képletű csoportot, (B) képletű csoportot, (C) képletű csoportot (amelyben  $X$  jelentése  $-CH_2-$ ,  $-O-$  vagy  $-S-$ ), (D) képletű csoportot vagy (E) képletű csoportot jelent, amely csoportok az  $\alpha'$ -vel jelölt végükkel az (I) általános képletben  $\alpha$ -val jelölt szénatomhoz, a  $\beta'$ -vel jelölt végükkel pedig az (I) általános képletben  $\beta$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak;

$R^5$  jelentése  $-C(=O)R^{11}$  csoport,  $-COOH$  csoport,  $-COOR^{12}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítet-



len, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport; és

$R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub>, NHR<sup>13</sup>, nitro-, hidroxil-, merkaptó-, O-(1-8 szénatomos alkil)- vagy S(O)<sub>p</sub>-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és p értéke 0, 1 vagy 2; O-aril- vagy S(O)<sub>q</sub>-aril-csoport, amelyekben az arilcsoportok szubsztituálatlanok vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak lehetnek, és q értéke 0, 1 vagy 2; O-(1-6 szénatomos alkil)-aril- vagy S(O)<sub>r</sub>-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, amelyekben az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok, míg az arilcsoportok szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és r értéke 0, 1 vagy 2; -COOH csoport; -C(=O)R<sup>14</sup> csoport; egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport; CF<sub>3</sub> csoport; telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-csoport; 3-, 4-, 5-, 6- vagy 7-tagú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heterociklil-csoport; szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport; vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport; vagy

$R^8$  és  $R^9$  jelentése a fenti, és  $R^6$  és  $R^7$  együtt Q csoportot alkot, ahol



**Q** egy  $\gamma'-CR<sup>15</sup>=CR<sup>16</sup>-CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>- $\delta'$  csoportot jelent, ami a  $\delta'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\delta$ -val jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódik; vagy$

**R<sup>7</sup>** és **R<sup>8</sup>** jelentése a fenti, és **R<sup>6</sup>** és **R<sup>9</sup>** együtt **T** csoportot alkot, ahol

**T** egy  $\gamma'$ -CR<sup>19</sup>=CR<sup>20</sup>-CR<sup>21</sup>=CR<sup>22</sup>- $\varepsilon'$  vagy  $\gamma'$ -N=CR<sup>20</sup>-CR<sup>21</sup>=N- $\varepsilon'$  csoportot jelent, amelyek az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végükénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végükénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak; vagy

**R<sup>6</sup>** és **R<sup>7</sup>** jelentése a fenti, és **R<sup>8</sup>** és **R<sup>9</sup>** együtt **U** csoportot alkot, ahol

**U** egy  $\eta'$ -CR<sup>19</sup>=CR<sup>20</sup>-CR<sup>21</sup>=CR<sup>22</sup>- $\varepsilon'$  csoportot jelent, ami az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\eta'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\eta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódik;

és a fenti meghatározásokban szereplő általános szimbólumok közül

**R<sup>10</sup>** jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

**R<sup>11</sup>** jelentése amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>,

NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos



alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{12}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{13}$   $-C(=O)CH_3$  csoportot,  $-C(=O)$ fenil-csoportot vagy  $-C(=O)O$ -terc-butil-(t-BOC) csoportot jelent;

$R^{14}$  jelentése hidrogénatom, amino-,  $NH$ (1-6 szénatomos alkil),  $N$ (1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>,  $NH$ [(1-6 szénatomos alkil)-aril],  $N$ [(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy



egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkilcsoportot tartalmazó O-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált cikloalkilcsoportot tartalmazó O-(3-8 szénatomos cikloalkil)-csoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoportot tartalmazó O-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített O-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  és  $R^{18}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport; és

$R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$  és  $R^{22}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport.

18 Eljárás emlős állatok és/vagy emberek vizeletvisszatartási képtelenségének, vizketegségének, tinnitus aurium-ának és/vagy hasmenésének kezelésére, azal *jellemezve*, hogy a kezelendő egyednek terápiásan hatásos mennyiségben egy (I) általános képletű vegyületet vagy gyógyászatilag alkalmazható sóját adjuk be - a képletben



$R^1$  és  $R^2$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,  $-OR^{10}$  csoport,  $-SH$  csoport,  $-SR^{10}$  csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik hidrogénatomot jelent, és a másik hidrogénatomtól eltérő jelentésű, azzal azonban, hogy ha  $R^1$  és  $R^2$  közül az egyik arilcsoportot jelent, akkor a másik hidrogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R^3$  és  $R^4$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztitu-

álatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport, mimellett  $R^3$  és  $R^4$  közül legalább az egyik hidrogénatomot jelent; vagy

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik és  $R^3$  és  $R^4$  közül az egyik együtt  $W$  csoportot alkot, míg  $R^1$  és  $R^2$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, és  $R^3$  és  $R^4$  közül a másik hidrogénatomot vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoportot jelent, ahol  $W$   $\alpha'$ -( $CH_2$ ) $_n$ - $\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 vagy 10),  $\alpha'$ -CH=CH- $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ -CH=CH- $CH_2$ - $CH_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ - $CH_2$ -CH=CH- $CH_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ - $CH_2$ - $CH_2$ -CH=CH- $CH_2$ - $CH_2$ - $\beta'$  csoportot,  $\alpha'$ -O-( $CH_2$ ) $_n$ - $\beta'$  csoportot (amelyben  $n$  értéke 2, 3, 4, 5 vagy 6), (A) képletű csoportot, (B) képletű csoportot, (C) képletű csoportot (amelyben X jelentése - $CH_2$ -, -O- vagy -S-), (D) képletű csoportot vagy (E) képletű csoportot jelent, amely csoportok az  $\alpha'$ -vel jelölt végükkel az (I) általános képletben  $\alpha$ -val jelölt szénatomhoz, a  $\beta'$ -vel jelölt végükkel pedig az (I) általános képletben  $\beta$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak;

$R^5$  jelentése -C(=O) $R^{11}$  csoport, -COOH csoport, -COOR<sup>12</sup> csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítet-



len, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport; és

$R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub>, NHR<sup>13</sup>, nitro-, hidroxil-, merkaptó-, O-(1-8 szénatomos alkil)- vagy S(O)<sub>p</sub>-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és p értéke 0, 1 vagy 2; O-aril- vagy S(O)<sub>q</sub>-aril-csoport, amelyekben az arilcsoportok szubsztituálatlanok vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak lehetnek, és q értéke 0, 1 vagy 2; O-(1-6 szénatomos alkil)-aril- vagy S(O)<sub>r</sub>-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, amelyekben az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok, míg az arilcsoportok szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, és r értéke 0, 1 vagy 2; -COOH csoport; -C(=O)R<sup>14</sup> csoport; egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-12 szénatomos alkilcsoport; CF<sub>3</sub> csoport; telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-csoport; 3-, 4-, 5-, 6- vagy 7-tagú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heterociklil-csoport; szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport; vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport; vagy

$R^8$  és  $R^9$  jelentése a fenti, és  $R^6$  és  $R^7$  együtt **Q** csoportot alkot, ahol



**Q** egy  $\gamma'$ -CR<sup>15</sup>=CR<sup>16</sup>-CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>- $\delta'$  csoportot jelent, ami a  $\delta'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\delta$ -val jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódik; vagy

**R<sup>7</sup>** és **R<sup>8</sup>** jelentése a fenti, és **R<sup>6</sup>** és **R<sup>9</sup>** együtt **T** csoportot alkot, ahol **T** egy  $\gamma'$ -CR<sup>19</sup>=CR<sup>20</sup>-CR<sup>21</sup>=CR<sup>22</sup>- $\varepsilon'$  vagy  $\gamma'$ -N=CR<sup>20</sup>-CR<sup>21</sup>=N- $\varepsilon'$  csoportot jelent, amelyek az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végüknél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\gamma'$ -vel jelölt végüknél pedig az (I) általános képletben  $\gamma$ -val jelölt szénatomhoz kapcsolódnak; vagy

**R<sup>6</sup>** és **R<sup>7</sup>** jelentése a fenti, és **R<sup>8</sup>** és **R<sup>9</sup>** együtt **U** csoportot alkot, ahol **U** egy  $\eta'$ -CR<sup>19</sup>=CR<sup>20</sup>-CR<sup>21</sup>=CR<sup>22</sup>- $\varepsilon'$  csoportot jelent, ami az  $\varepsilon'$ -vel jelölt végénél az (I) általános képletben  $\varepsilon$ -nal jelölt szénatomhoz,  $\eta'$ -vel jelölt végénél pedig az (I) általános képletben  $\eta$ -vel jelölt szénatomhoz kapcsolódik;

és a fenti meghatározásokban szereplő általános szimbólumok közül

**R<sup>10</sup>** jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

**R<sup>11</sup>** jelentése amino-, NH(1-6 szénatomos alkil), N(1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>, NH[(1-6 szénatomos alkil)-aril], N[(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos



alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált heteroaril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-heteroaril-csoport;

$R^{12}$  jelentése egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{13}$   $-C(=O)CH_3$  csoportot,  $-C(=O)$ fenil-csoportot vagy  $-C(=O)O$ -terc-butil-(t-BOC) csoportot jelent;

$R^{14}$  jelentése hidrogénatom, amino-,  $NH$ (1-6 szénatomos alkil),  $N$ (1-6 szénatomos alkil)<sub>2</sub>,  $NH$ [(1-6 szénatomos alkil)-aril],  $N$ [(1-6 szénatomos alkil)-aril]<sub>2</sub> vagy 1-8 szénatomos alkilcsoport, ahol a felsoroltakban az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált csoportok lehetnek, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy



egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített (1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport, egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkilcsoportot tartalmazó O-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált cikloalkilcsoportot tartalmazó O-(3-8 szénatomos cikloalkil)-csoport, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált arilcsoportot tartalmazó O-aril-csoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált alkil-részből és szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált aril-részből felépített O-(1-6 szénatomos alkil)-aril-csoport;

$R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  és  $R^{18}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport; és

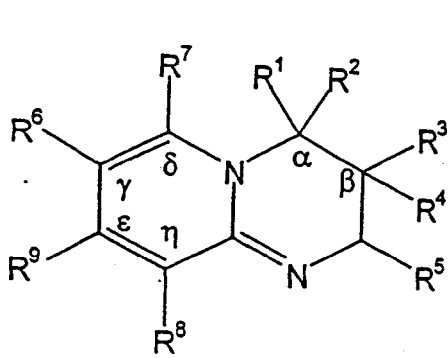
$R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$  és  $R^{22}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, ciano-, hidroxil- vagy karboxilcsoport, vagy egyenes vagy elágazó láncú, telített vagy telítetlen, szubsztituálatlan vagy egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport.

A bejelentő helyett

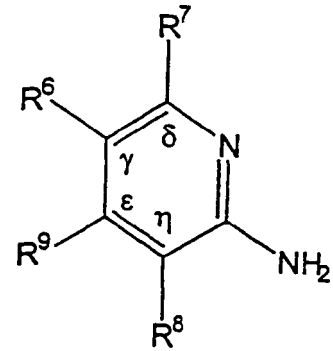
a meghatalmazott:

Aktuál nap 2020.01.01  
2005. 09. 08. TK

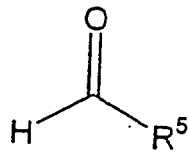
KÖZZÉTÉTELI PÉLDANY



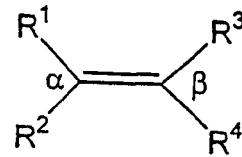
(I)



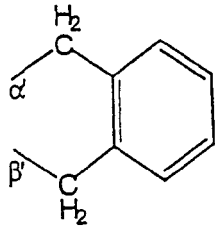
(II)



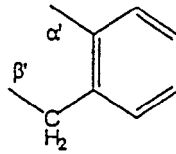
(III)



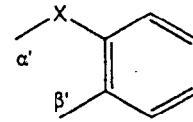
(IV)



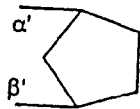
(A)



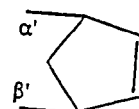
(B)



(C)



(D)



(E)