

(19)



SUOMI - FINLAND

(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS

PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN

FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10) FI 802049 A7

**(12) JULKISEKSI TULLUT PATENTTIHAKEMUS
PATENTANSÖKAN SOM BLIVIT OFFENTLIG
PATENT APPLICATION MADE AVAILABLE TO THE
PUBLIC**

(21) Patentihakemus - Patentansökan - Patent application **802049**

(51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassifikation -
International patent classification
C07C

(22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **27.06.1980**

(23) Saapumispäivä - Ankomstdag - Reception date **27.06.1980**

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig - Available to the public **01.01.1981**

(43) Julkaisupäivä - Publiceringsdag - Publication date **12.06.2019**

(32) (33) (31) Etuokeus - Prioritet - Priority

30.06.1979 DE P_29_26_472.0

(71) Hakija - Sökande - Applicant

1 • Dr. Karl Thomae Gesellschaft mit, 7950 Biberach 1, BRD, SAKSA, (DE)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1 • Keck, Johannes, BRD, SAKSA, (DE)

2 • Kryger, Gerd, TOWN UNKNOWN, SAKSA, (DE)

3 • Pieper, Helmut, 7950 Biberach 1, SAKSA, (DE)

4 • Zimmermann, Rainer, TOWN UNKNOWN, SAKSA, (DE)

5 • Noll, Klaus-Reinhold, BRD, SAKSA, (DE)

6 • Engelhardt, Günther, BRD, SAKSA, (DE)

7 • Promberger, Norbert, TOWN UNKNOWN, SAKSA, (DE)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

Leitzinger Oy, High Tech Center, Tammasaarenkatu 1, 00180 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

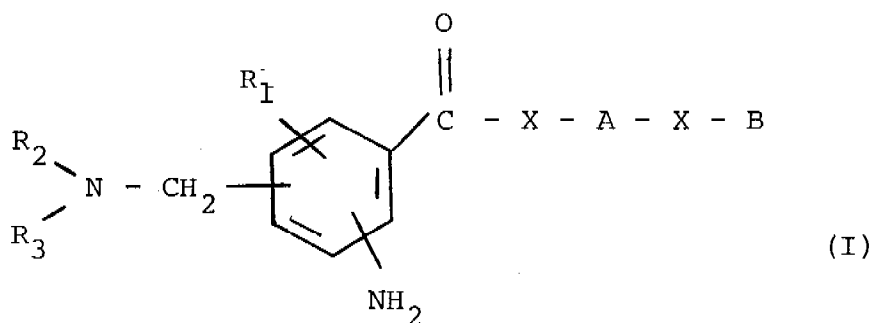
Uusia bentsoyyljohdoksia, niiden valmistaminen ja niiden käyttö lääkeaineina.

Nya benzoylderivater, deras framställning och deras användning såsom läkemedel.

Dr. Karl Thomae Gesellschaft mit
beschränkter Haftung
Biberach an der Riss
Saksa-BRD

Uusia bentsoyylijohdoksia, niiden valmistaminen ja niiden käyttö
lääkeaineina. - Nya benzoylderivater, deras framställning och
deras användning såsom läkemedel.

Oheisen keksinnön kohteena ovat uudet yleiskaavan (I) mukaiset
bentsoyylijohdokset

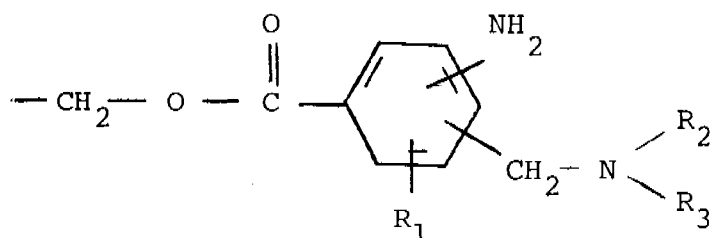


niiden fysiologisesti sopivat happoadditiosuolat epäorgaanisten tai
orgaanisten happojen kanssa ja näiden yhdisteiden valmistusmenetelmät
sekä uusien bentsoyylijohdosten ja niiden suolojen käyttö lääkeai-
neina. Uusilla yhdisteillä on arvokkaita farmakologisia ominaisuuksia.
Erityisesti niillä on tulehduksia estävä vaikutus yllättävän pienin
sivuvaikutuksin.

Edellä olevassa yleiskaavassa I

X on happiatomi tai iminoryhmä, jolloin molemmat ryhmät X voivat
olla samanlaisia tai erilaisia,

R_1 on happi-, fluori-, kloori- tai bromiatomi,
 R_2 ja R_3 , jotka voivat olla samanlaisia tai erilaisia, ovat vetyato-
 meja, 1-6-hiiliatomisia suoraketjuisia tai haarautuneita alkyyliryh-
 miä, jotka voivat olla substituoidut fenyyli- tai dialkyyl-
 aminoryhmällä, jossa on 1 - 3 hiiliatomia kummassakin alkyylisosassa,
 pyridyyli- tai sykloalkyyli-ryhmiä, joissa on 5 - 7 hiiliatomia,
 tai R_2 ja R_3 yhdessä niiden välissä sijaitsevan typpi-
 atomin kanssa merkitsevät pyrrolidino-, piperidino-, heksametyleni-imino-, morfo-
 lino-, N-aryylipiperatsino- tai N-alkyyli-
 piperatsinoryhmää, jolloin alkyyliryhmä voi sisältää 1 - 3 hiiliatomia,
 A on 5-7-hiiliatominen sykloalkyleeniryhmä tai 2-10-hiiliatominen
 alkyleeniryhmä, joka voi olla substituoitu yhdellä tai kahdella
 alkyyliryhmällä, jossa kulloinkin on 1 - 3 hiiliatomia, yhdellä tai
 kahdella karbalkoksiryhmällä, joissa on yhteensä 2 - 4 hiiliatomia,
 yhdellä tai kahdella fenyyli- tai fenyyli-alkyyli-ryhmällä,
 1 - 4 hydroksyyli-ryhmällä, halogeenimetyyli-, hydroksimetyyli-,
 alkanoyylioksi- tai alkanoyyli-
 oksimetyyli-ryhmällä, joissa kulloinkin on 1 - 18 hiiliatomia alkanoyy-
 liosassa, tai ryhmällä, jonka kaava on



jolloin R_1 , R_2 ja R_3 tarkoittavat samaa kuin edellä, tai jonka voi
 katkaista happi- tai rikkiatomi, sulfoksidi-, sulfonyyli-, bentseeni-,
 sykloheksaani-, pyridiini-, piperatsino- tai iminoryhmä, jolloin
 iminoryhmä voi olla substituoitu 1-6-hiiliatomisella alkyyliryhmällä,
 fenyyli- tai fenyyli-alkyyli-ryhmällä, jossa on 1 - 3 hiiliatomia
 alkyylisosassa, ja

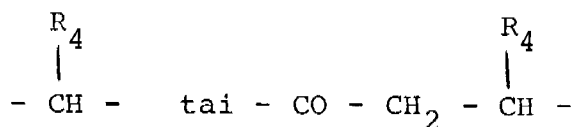
B on antiflogistikan, joka sisältää karboksyyli-ryhmän ja joka sen
 kautta on sidottu ryhmään X, asyyli-ryhmä.

Tällöin ryhmänä B tulee kysymykseen asyyli-ryhmä, jonka yleiskaava on



jossa

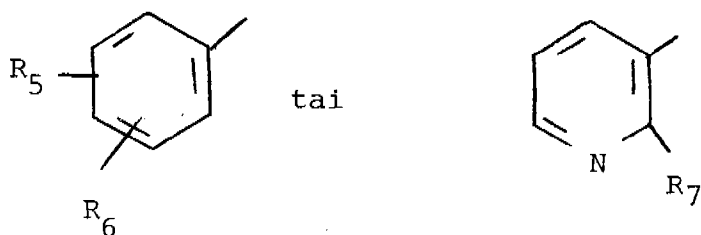
D on yksinkertainen sidos ryhmän E ja karbonyyli-ryhmän hiiliatomin
 välillä, tai ryhmä, jonka kaava on



jolloin

R_4 on vetyatomi, metyyli- tai etyyli-ryhmä, ja

E on ryhmä, jonka kaava on



jolloin

R_5 on vety-, fluori-, kloori- tai bromiatomi tai hydroksiryhmä,
 R_6 on mahdollisesti metyyli-ryhmällä, trifluorimetyyli-ryhmällä,
 fluori-, kloori- ja/tai bromiatomeilla mono-, di- tai trisubstituoitu
 fenyyli-, fenoksi- tai fenyyliaminoryhmä, 2-metyylipropyyli-, syklo-
 heksyyli-, asetoksi-, bentsoyyli-, 2-tienyylikarbonyyli-, 2,5-di-
 hydro-1H-pyrrol-yyli- tai 1,3-dihydro-1-okso-2H-isoindol-2-yyli-ryhmä
 ja

R_7 on metyyli-, trifluorimetyyli-ryhmällä, fluori-, kloori- ja/tai
 bromiatomeilla mono- tai disubstituoitu fenyyliaminoryhmä,
 tai E-D-CO- on

1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indol-3-asetyyli-,
 (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetyyli-,
 5-bentsoyyli- α -metyyli-2-tiofeeniasetyyli-,
 1-metyyli-5-(4-metyylibentsoyyli)-1H-pyrroli-2-asetyyli-,
 5-fluori-2-metyyli-1-//4-(metyylisulfinyyli)-fenyyli/-metyleeni/-
 1H-indeeni-3-asetyyli-,
 6,11-dihydro-11-okso-dibents/b,e/oksepiini-3-asetyyli-,
 6,11-dihydro-11-okso-dibents/b,e/oksepiini-2-asetyyli-,
 α -metyyli-5-okso-5H-dibentso/2,d/sykloheptaani-2-asetyyli-,
 2-(4-kloorifenyyli)- α -metyyli-5-bentsoksatsoliasetyyli-,
 6-kloori- α -metyyli-9H-karbatsoli-2-asetyyli-,
 1,3,4,9-tetrahydro-1-propyyli-pyrano/3,4-b/indoli-1-asetyyli-,
 1,8-dietyyli-1,3,4,9-tetrahydro-pyrano/3,4-b/indoli-2-asetyyli-,
 2-//4,5-bis(4-kloorifenyyli)-2-oksatsolyyli/tio/propanooyli-,

1-(4-kloorifenyyli)-2,5-dimetyyli-1H-pyrroli-3-asetyyli-,
 4-(4-kloorifenyyli)-2-fenyyli-5-tiatsoliasetyyli-,
 10-metyyli-10H-fenotiatsiini-2-asetyyli-,
 7-metoksi- α ,10-dimetyyli-10H-fenotiatsiini-2-asetyyli- tai
 5-kloori-3-metyyli-bentso/b/tiofeeni-2-asetyyliryhmä.

Ryhmiin R_6 ja R_7 määritelmän yhteydessä mainittuina substituotuna
 fenyyli-, fenoksi- tai fenyyliaminoryhminä tulevat kysymykseen:

R_6 on erityisesti 2-fluorifenyyli-, 4-fluorifenyyli-, 2,4-difluori-
 fenyyli-, 2,4-dikloorifenoksi-, 3-trifluorimetyylifenyyliamino-,
 2,6-dikloorifenyyliamino-, 3-kloori-2-metyylifenyyliamino-, 2,6-
 dikloori-3-metyylifenyyliamino- ja 2,3-dimetyylifenyyliaminoryhmä
 ja

R_7 on 3-trifluorimetyylifenyyliamino-, 2-metyyli-3-trifluorimetyyli-
 fenyyliamino- ja 3-kloori-2-metyylifenyyliaminoryhmä.

Antiflogistikoina, jotka sisältävät karboksyyli-ryhmän, tulevat siten
 kysymykseen esimerkiksi seuraavat:

1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo,
 (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo,
 2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyylietikkahappo,
 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo,
 α -metyyli-4-(2-metyylipropyyli)-fenyylietikkahappo,
 2-fluori- α -metyyli-1,1'-bifenyyli/-4-etikkahappo,
 4-(1,3-dihydro-1-okso-2H-isoindol-2-yyli)- α -metyyli-fenyylietikka-
 happo,
 asetyyli-salisyylihappo,
 2-/(2,6-dikloori-3-metyylifenyyli) amino/-bentsoehappo,
 2-/(3-kloori-2-metyylifenyyli) amino/-bentsoehappo,
 5-bentsoyyli- α -metyyli-2-tiofeenietikkahappo,
 1-metyyli-5-(4-metyylibentsoyyli)-1H-pyrroli-2-etikkahappo,
 5-fluori-2-metyyli-1-//4-(metyylisulfinyyli) fenyyli/metyleeni/-1H-
 indeeni-3-etikkahappo,
 6,11-dihydro-11-okso-dibents/b,e/oksepiini-3-etikkahappo,
 6,11-dihydro-11-okso-dibents/b,e/oksepiini-2-etikkahappo,
 α -metyyli-5-okso-5H-dibents/a,d/syklohepteeni-2-etikkahappo,

2-(4-kloorifenyyli)- α -metyyli-5-bentsoksatsolietikkahappo,
 6-kloori- α -metyyli-9H-karbatsoli-2-etikkahappo,
 α -etyyli-4-(2-metyylipropyli)-fenyylietikkahappo,
 α -metyyli-3-fenoksi-fenyylietikkahappo,
 2-(2,4-dikloorifenoksi)-fenyylietikkahappo,
 γ -okso/1,1'-bifenyyli/-4-butaanihappo,
 2',4'-difluori-4-hydroksi-/1,1'-bifenyyli/-3-karboksyyliahappo,
 1,3,4,9-tetrahydro-1-propyyli-pyrano/3,4-b/indoli-1-etikkahappo,
 1,8-dietyyli-1,3,4,9-tetrahydro-pyrano/3,4-b/indoli-1-etikkahappo,
 2-//4,5-bis(4-kloorifenyyli)-2-oksatsolyyli/tio/-propaanihappo,
 2-//3-(trifluorimetyyli)fenyyli/amino/-bentsoehappo,
 1-(4-kloorifenyyli)-2,5-dimetyyli-1H-pyrroli-3-etikkahappo,
 3-kloori- α -metyyli-4-(2-tienyylikarbonyyli)-fenyylietikkahappo,
 2-/(3-kloori-2-metyylifenyyli)-amino/-3-pyridiinikarboksyyliahappo,
 2-//2-metyyli-3-(trifluorimetyyli)fenyyli/amino/-3-pyridiinikarboksyyliahappo,
 4-(4-kloorifenyyli)-2-fenyyli-5-tiatsolietikkahappo,
 3-kloori-4-(2,5-dihydro-1H-pyrrol-1-yyli)- α -metyyli-fenyylietikkahappo,
 10-metyyli-10H-fenotaitsiini-2-etikkahappo,
 7-metoksi- α ,10-dimetyyli-10H-fenotiatsiini-2-etikkahappo,
 5-kloori-3-metyyli-bentso/b/tiofeeni-2-etikkahappo,
 α -metyyli-4-(2-tienyylikarbonyyli)-fenyylietikkahappo,
 3-kloori-4-sykloheksyyli- γ -okso-fenyyliivutaanihappo,
 2-/(2,3-dimetyylifenyyli)amino/-bentsoehappo ja
 2-//3-(trifluorimetyyli)fenyyli/amino/-3-pyrimidiinikarboksyyliahappo.

Oheisen keksinnön kohteena ovat siten erityisesti uudet yleiskaavan I bentsoyylijohdokset, joissa B on ryhmä -CO-D-E, jolloin D ja E tarkoittavat samaa kuin edellä, niiden fysiologisesti sopivat happo-additiosuolat epäorgaanisten tai orgaanisten happojen kanssa ja niiden valmistamismenetelmät sekä uusien bentsoyylijohdosten ja niiden suolojen käyttö lääkeaineina.

Ryhmien R_1 , R_2 , R_3 , A, D ja E määritelmien yhteydessä mainittuina merkityksinä tulevat siten kysymykseen seuraavat:

R_1 on vety-, fluori-, kloori- tai bromiatomi,

ryhmä $\begin{matrix} R_2 \\ \diagdown \\ N \\ \diagup \\ R_3 \end{matrix}$ - on amino-, metyyliamino-, etyyliamino-, n-propyyliami-

no-, isopropyyliamino-, n-butyyliaamino-, tert.butyyliaamino-, n-pentyyliaamino-, n-heksyyliamino-, dimetyyliamino-, dietyyliamino-, di-n-propyyliamino-, di-isopropyyli-, amino-, di-n-butyyliaamino-, di-n-pentyyliaamino-, di-n-heksyyliamino-, etyyli-metyyliamino-, metyyli-propyyliamino-, etyyli-propyyliamino-, etyyli-butyyliaamino-, propyyli-isopropyyliaamino-, propyylibutyyliaamino-, metyyli-syklo-pentyyliaamino-, metyyli-sykloheksyyliamino-, metyyli-sykloheptyyli-amino-, etyyli-syklopentyyliaamino-, etyyli-sykloheksyyliamino-, etyyli-sykloheptyyliamino-, propyyli-syklopentyyliaamino-, propyyli-sykloheksyyliamino-, propyyli-sykloheptyyliamino-, syklopentyyli-amino-, sykloheksyyliamino-, sykloheptyyliamino-, disykloheksyyli-amino-, bentsyyliamino-, metyyli-bentsyyliamino-, etyyli-bentsyyli-amino-, sykloheksyyli-bentsyyliamino-, dibentsyyliamino-, fenyyli-etyyliamino-, metyyli-fenyylietyyliamino-, propyyli-fenyylietyyli-amino-, fenyylipropyyliamino-, fenyyliamino-, metyyli-fenyyliamino-, etyylifenyyliamino-, 2-(dimetyyliamino)-etyyliamino-, 2-(dietyyli-amino)-etyyliamino-, 2-(dipropyyliamino)-etyyliamino-, 3-(dimetyyli-amino)-propyyliamino-, 3-(dipropyyliamino)-propyyliamino-, N-metyy-li-2-(dimetyyliamino)-etyyliamino-, N-etyyli-2-(dietyyliamino)-etyyliamino-, pyridyyliamino-, pyrrolidino-, piperidino-, heksa-metyleeni-imino-, morfolino-, N-metyyli-piperatsino-, N-etyyli-piperatsino-, N-propyyli-piperatsino-, N-isopropyyli-piperatsino-tai N-fenyyli-piperatsinoryhmä,

A on 1,2-syklopentyleeni-, 1,3-syklopentyleeni-, 1,2-sykloheksylee-ni-, 1,3-sykloheksyleeni-, 1,4-sykloheksyleeni-, 1,2-sykloheptylee-ni-, 1,3-sykloheptyleeni-, 1,4-sykloheptyleeni-, etyleeni-, n-pro-pyleeni-, n-butyleeni-, n-pentyleeni-, n-heksyleeni-, n-heptyleeni-, n-oktyleeni-, n-nonyleeni-, n-dekyleeni-, 1-metyyli-etyleeni-, 2-metyylietyleeni-, 1,2-dimetyyli-etyleeni-, 1-metyyli-propyleeni-, 2-metyyli-propyleeni-, 3-metyyli-propyleeni-, 1,2-dimetyyli-propy-leeni-, 1,3-dimetyyli-propyleeni-, 2-metyyli-2-n-propyyli-propylee-ni-, 1-metyyli-butyleeni-, 1-metyyli-pentyleeni-, 1-fenyyli-etyleeni, 2-fenyylietyleeni-, 1,2-difenyyli-etyleeni-, 1-fenyyli-n-propyleeni-, 1-metoksikarbonyyli-etyleeni-, 1-etoksikarbonyyli-etyleeni-, 2-etoksikarbonyyli-etyleeni-, 1,2-dietoksikarbonyyli-etyleeni-, 1-etoksikarbonyyli-propyleeni-, 2-etoksikarbonyyli-propyleeni-, 3-etoksikarbonyyli-propyleeni-, 1-propoksikarbonyyli-etyleeni-, 2-propoksikarbonyyli-etyleeni-, 2-hydroksipropyleeni-, 2-hydroksi-butyleeni-, 3-hydroksi-butyleeni-, 2,3-dihydroksibutyleeni-, 2-hydroksi-pentyleeni-, 2,3,4-trihydroksi-pentyleeni-, 2,3,4,5-

tetrahydroksi-n-heksyleeni-, 1-kloorimetyyli-etyleen-, 2-kloorimetyyli-etyleen-, 1-hydroksimetyyli-etyleen-, 2-hydroksi-metyyli-etyleen-, 2-asetoksimetyyli-etyleen-, 2-pentanoyylioksimetyyli-etyleen-, 2-dekanoyylioksimetyyli-etyleen-, 2-tetradekanoyylioksimetyyli-etyleen-, 2-oktadekanoyylioksimetyyli-etyleen-, 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-etyyliamino-metyyli)-bentsoyylioksimetyyli/-etyleen-, 2-asetoksi-propyleeni-, 2-pentanoyylioksi-propyleeni-, 2-dekanoyylioksi-propyleeni-, 2-tetradekanoyylioksi-propyleeni-, 2-oktadekanoyylioksi-propyleeni-, dietyleenidioksidi-, dietyleenisulfidi-, dietyleenisulfoksidi-, dietyleni-sulfonyyli-, N,N-dietyleeniamino-, N,N-dietyleenimetyyliamino-, N,N-dietyleenietyyliamino-, N,N-dietyleenipropyliamino-, N,N-dietyleenisopropyliamino-, N,N-dietyleenibutyliamino-, N,N-dietyleenitert. butyyliamino-, N,N-dietyleenihexyyliamino-, N,N-dietyleenifenyliamino-, N,N-dietyleenibentsyyliamino-, N,N-dietyleenifenyylipropyli-amino-, etyleeni-propyleenioksidi-, N-etyleen-N-propyleenimetyyliamino-, N-etyleen-N-butyleeni-etyyliamino-, sykloheksaanidimetyleen-, ksyyli-, pyridiini-dimetyleen-, N,N'-dietyleenipiperatsino- tai N-etyleen-N'-propyleenipiperatsinoryhmä,

D on yksinkertainen sidos ryhmän E ja karbonyyliryhmän hiiliatomien välillä, metyleeni-, etylideeni-, propylideeni-, propylen-1-oni-, 3-metyyli-propylen-1-oni- tai 3-etyyli-propylen-1-oni-ryhmä,

E on 1-(4-kloori-bentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indol-3-yyli-, (+)-6-metoksi-naftalin-2-yyli-, 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyli-, 2-asetoksi-fenyli-, 3-bentsoyyli-fenyli-, 4-(2-metyyli-propyyli)-fenyyli-, 2-fluori-/1,1'-bifenyyli/-4-yyli-, 4-(1,3-dihydro-1-okso-2H-isoindol-2-yyli)-fenyyli-, 2-/(2,6-dikloori-3-metyyli-fenyli)amino/fenyli-, 2-/(3-kloori-2-metyylifenyyli)amino/fenyli-, 5-bentsoyyli-2-tienyyli-, 1-metyyli-5-(4-metyylibentsoyyli)-1H-pyrrol-2-yyli-, 5-fluori-2-metyyli-1-/4-(metyylisulfinyyli)fenyyli/-metyleeni/-1H-inden-3-yyli-, 6,11-dihydro-11-okso-dibents/b,e/-oksepin-3-yyli-, 6,11-dihydro-11-okso-dibents/b,e/oksepin-2-yyli-, 5-okso-5H-dibentso/a,d/sykloheptan-2-yyli-, 2-(4-kloorifenyyli)-bentsoksatsol-5-yyli-, 6-kloori-9H-karbatso-2-yyli-, 3-fenoksifenyyli-, 2-(2,4-dikloorifenoksi)-fenyyli-, /1,1'-bifenyyli/-4-yyli-, 2',4'-difluori-4-hydroksi-/1,1'-bifenyyli/-3-yyli-, 1,3,4,9-tetrahydro-1-propyyli-pyrano/3,4-b/indol-1-yyli-, 1,8-dietyyli-1,3,4,9-tetrahydro-pyrano/3,4-b/indol-1-yyli-, /4,5-bis(4-kloorifenyyli)-2-

oksatsolyyli/-tio-, 2-//3-(trifluorimetyyli)fenyyli/amino/fenyyli-, 1-(4-kloorifenyyli)-2,5-dimetyyli-1H-pyrrol-3-yyli-, 3-kloori-4-(2-tienyylikarbonyyli)-fenyyli-, 2-/(3-kloori-2-metyylifenyyli)amino/-pyrid-3-yyli-, 2-//2-metyyli-3-(trifluorimetyyli)fenyyli/amino/-pyrid-3-yyli-, 4-(4-kloorifenyyli)-2-fenyyli-tiatsol-5-yyli-, 3-kloori-4-(2,5-dihydro-1H-pyrrol-1-yyli)-fenyyli-, 10-metyyli-10H-fenotiatsin-2-yyli-, 7-metoksi-10-metyyli-10H-fenotiatsin-2-yyli-, 5-kloori-3-metyyli-bentso/b/tiofen-2-yyli-, 4-(2-tienyylikarbonyyli)-fenyyli-, 3-kloori-4-sykloheksyyli-fenyyli-, 2-//3-(trifluorimetyyli)fenyyli/amino/-pyrid-3-yyli- tai 2-/(2,3-dimetyylifenyyli)amino/-fenyyli-ryhmä.

Parhaina pidettyjä yleiskaavan I mukaisia yhdisteitä ovat kuitenkin yhdisteet, joissa

X on happiatomi tai iminoryhmä, jolloin molemmat ryhmät X voivat olla samanlaisia tai erilaisia,

R_1 on vety-, kloori- tai bromiatomi,

R_2 ja R_3 , jotka voivat olla samanlaisia tai erilaisia, ovat vetyatomeja, 1-4-hiiliatomisia alkyyliryhmiä, 5-7-hiiliatomisia sykloalkyyli-ryhmiä, bentsyyli- tai 2-dietyyliamino-etyyliryhmiä tai R_2 ja R_3 yhdessä niiden välissä sijaitsevan typpi-atomin kanssa merkitsee pyrrolidino-, piperidino-, heksametyleenimino-, morfolino-, N-metyyli-piperatsino- tai N-fenyyli-piperatsinoryhmää,

A on 2-10-hiiliatominen suoraketjuinen alkyleeniryhmä, etyleeniryhmä, joka on substituoitu yhdellä tai kahdella metyyli-ryhmällä, yhdellä tai kahdella alkoksikarbonyyliryhmällä, joissa on yhteensä kummassakin 2 tai 3 hiiliatomia, yhdellä tai kahdella fenyyli-ryhmällä, hydroksi-, kloorimetyyli-, hydroksimetyyli-, 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsyylioksimetyyli- tai alkanoyylioksimetyyli-ryhmällä, jossa on 1 - 18 hiiliatomia, propyleeniryhmä, joka 2-asemassa on substituoitu hydroksiryhmällä tai alkanoyylioksi-ryhmällä, jossa on 1 - 18 hiiliatomia, tai kahdella alkyyliryhmällä, joissa kulloinkin on 1 - 3 hiiliatomia, neljällä hydroksiryhmällä substituoitu n-heksyleeniryhmä, sykloheksyleeniryhmä tai suoraketjuinen alkyleeniryhmä, jossa on 4 - 6 hiiliatomia ja jonka C-atomien 2 ja 3 tai 3 ja 4 välissä katkaisee happi- tai rikkiatomi, sulfoksi-di-, sulfonyyli-, amino-, fenyyliamino-, bentsyyliamino-, piperatsino- tai alkyyliaiminoryhmä, jossa on 1 - 4 hiiliatomia, 1,4-sykloheksaani-dimetyleenin-, p-ksylyleenin- tai 2,6-pyridiini-dimetyleenin-ryhmä ja

B on 2-asetoksibentseeni-, 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetyyli-, 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indol-3-asetyyli-, 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetyyli-, α -metyyli-4-(2-metyyli-propyyli)-fenyyliasetyyli-, 2-fluori- α -metyyli-/1,1'-bifenyyli/-4-asetyyli- ja (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasettyliryhmä, ja niiden fysiologisesti sopivat happoadditiosuolat epäorgaanisten tai orgaanisten happojen kanssa.

Erityisen suositeltuja yleiskaavan I mukaisia yhdisteitä ovat ne, joissa

X on kulloinkin happiatomi,

R_1 on bromiatomi,

R_2 on metyyli- tai ettyliryhmä,

R_3 on etyyli- tai sykloheksyyliryhmä tai R_2 ja R_3 yhdessä typpi-atomin kanssa on heksametyyleeni-iminoryhmä,

A on suoraketjuinen, 2-6-hiiliatominen alkyleeniryhmä tai suoraketjuinen, 4-6-hiiliatominen alkyleeniryhmä, jonka C-atomien 2 ja 3 tai 3 ja 4 välissä katkaisee happi- tai rikkiatomi, etyyliamino- tai propyyliaminoryhmä, ja

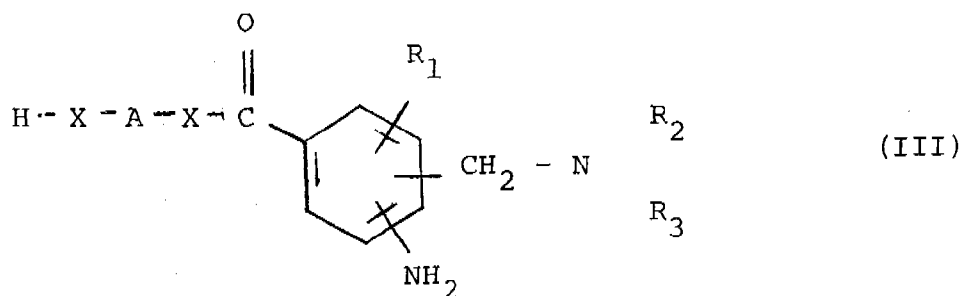
B on 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indol-3-asetyyli-, 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/fenyyliasetyyli-, 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetyyli-, (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetyyli-, α -metyyli-4-(2-metyylipropyyli)-fenyyliasetyyli- tai 2-fluori- α -metyyli-/1,1'-bifenyyli/-4-asettyliryhmä, ja niiden fysiologisesti sopivat suolat epäorgaanisten tai orgaanisten happojen kanssa.

Keksinnön mukaisesti uudet yleiskaavan I mukaiset yhdisteet saadaan seuraavilla menetelmillä:

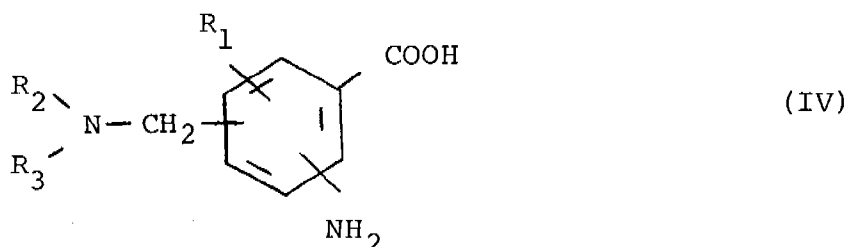
Yleiskaavan II mukainen karboksyylihappo



tai sen suola tai sen reaktiokykyinen johdos saatetaan reagoimaan yleiskaavan III mukaisen yhdisteen



tai sen alkalisuolan tai reaktiokykyisen johdoksen kanssa tai yleiskaavan IV mukainen karboksyylihapo



tai sen suola tai reaktiokykyinen johdos saatetaan reagoimaan yleiskaavan V mukaisen yhdisteen



sen alkalisuolan tai reaktiokykyisen johdoksen kanssa, joissa kaavoissa $\text{R}_1 - \text{R}_3$, A, B ja X tarkoittavat samaa kuin edellä ja ryhmä HX yhdessä viereisten, ryhmän A α - ja β -asemassa sijaitsevien hiiliatomien kanssa voi merkitä myös oksiranyyliryhmää.

Reaktiossa on siten kyse yleiskaavan III tai IV mukaisen yhdisteen asyloinnista yleiskaavan II tai IV mukaisella karboksyylihapolla tai sen funktionaalisella johdoksella, mahdollisesti, kun läsnä on happoaktivoivaaja/tai vettä sitovaa ainetta, ja yleiskaavan II tai IV mukaisen karboksyylihapon reaktio yleiskaavan III tai V mukaisen yhdisteen reaktiokykyisen johdoksen kanssa tai yleiskaavan II tai IV mukaisen karboksyylihapon suolan alkylointi yleiskaavan III tai IV mukaisen yhdisteen vastaavana funktionaalisena johdoksena.

Yleiskaavan II tai IV mukaisen karboksyylihapon funktionaalisena johdoksena tulevat kysymykseen esimerkiksi sen alkyyli-, aryyli- tai aralkyyliestri, kuten metyyli-, etyyli-, fenyyli- tai bentsyyliesteri, sen imidatsolidi, sen happohalogenidi, kuten happokloridi tai happo-

bromidi, sen anhydridi, sen seka-anhydridi alifaattisten tai aromaattisten karboksyylihappojen tai hiilihappestereiden kanssa, esimerkiksi etikkahapon, propionihapon tai hiilihappesteryliesterin kanssa, sen asyylioksitrifenyylifosfoniumsuola, sen N-asyylioksi-imidi tai, mikäli aminoryhmä on yleiskaavan IV mukaisen vastaavan karboksyylihapon 2-asemassa, myös sen isatohappesteanhydridi. Yleiskaavan III tai IV mukaisen yhdisteen reaktiokykyisenä johdoksena tulevat kysymykseen sen fosfatsojohdos, mikäli X on iminoryhmä, ja, mikäli X on happiatomi, sen epoksidi, halogenidi, kuten kloridi, bromidi tai jodidi, sen sulfonihappesteri, kuten metaanisulfonihapon tai p-tolueenisulfonihapon esteri tai sen esteri alifaattisten tai aromaattisten karboksyylihappojen kanssa, kuten esteri etikkahapon, propionihapon tai bentsoehapon kanssa, ja yleiskaavan II tai IV mukaisen karboksyylihapon suoloina tulevat kysymykseen sen alkali- ja maa-alkalisuola, kuten natrium-, kalium- tai kalsiumsuola tai sen hopeasuola.

Vettä sitovina ja/tai happestaktivoivina aineina tulevat kysymykseen esimerkiksi kloorimuurahaishappesteri, kuten kloorimuurahaishappestetyyliesteri, tionyylikloridi, fosforitrikloridi, fosforipentoksidi, N,N'-disykloheksyylikarbodi-imidi, N,N'-karbonyyli-di-imidatsoli, N,N'-tionyyli-di-imidatsoli tai booritrifluoridi-eteraatti.

Reaktio suoritetaan tarkoituksenmukaisesti liuottimessa, kuten dikloorimetaanissa, kloroformissa, hiilitetrakloridissa, eetterissä, dioksaanissa, tetrahydrofuraanissa, bentseenissä, tolueenissa, dimetyyliformamidissa tai metanolissa, mahdollisesti, kun mukana on epäorgaanista emästä, kuten natriumkarbonaattia, tai tertiääristä orgaanista emästä, kuten trietyyliamiinia, pyridiiniä ja/tai 4-dimetyyliaminopyridiiniä, joka samanaikaisesti voi toimia myös liuottimeksi, mahdollisesti, kun mukana on happestaktivoivaa ainetta, lämpötiloissa välillä - 25 ja 250°C, parhaiten kuitenkin lämpötiloissa välillä -10°C ja käytetyn liuottimen kiehumislämpötila. Mahdollisesti in situ syntyvää, yleiskaavojen II - V mukaisen yhdisteen funktionaalista johdosta ei tällöin tarvitse eristää ja lisäksi reaktio voidaan suorittaa myös ilman liuotinta ja/tai kun mukana on reaktiota jouduttavaa ainetta, kuten natriumhydridiä tai 4-dimetyyliaminopyridiiniä.

Lisäksi voidaan reaktion aikana syntyvä vesi poistaa tislamalla aseptrooppisesti, esimerkiksi kuumentamalla tolueenin kanssa veden-

erottimessa, mahdollisesti kun mukana on kuivausainetta, kuten magnesiumsulfaattia tai molekyyliseulaa.

Yleiskaavan II tai IV mukaisen karboksyylihapon alkalisuolan reaktio yleiskaavan III tai V mukaisen yhdisteen kanssa, jossa HX on halogeeniatomi, kuten kloori- tai bromiatomi, voidaan kuitenkin suorittaa erityyppisen edullisesti, kun mukana on reaktiota jouduttavaa ainetta, kuten alkalijodidia, esimerkiksi natrium- tai kaliumjodidia, tai kun mukana on faasinsiirtokatalyyttiä, kuten nk. kruunueetteriä, esimerkiksi 15-Krone-5-eetteriä.

Keksinnön mukaisesti saadut yleiskaavan I mukaiset yhdisteet, joissa ryhmä A sisältää hydroksyyli-ryhmän, voidaan myöhemmin muuntaa asyloimalla vastaaviksi yleiskaavan I mukaisiksi asyylioksiyhdisteiksi, ja yleiskaavan I mukaiset yhdisteet, joissa ryhmä A on happiatomin katkaisema alkyleeniryhmä, voidaan muuntaa hapettamalla vastaaviksi yleiskaavan I mukaisiksi sulfoksidi- tai sulfonyyliyhdisteiksi. Yleiskaavan I mukaiset yhdisteet, joissa ryhmä A tarkoittaa sulfoksidiryhmän katkaisemaa alkyleeniryhmää, voidaan muuntaa hapettamalla vastaaviksi sulfonyyliyhdisteiksi.

Jälkikäteen tapahtuva asylointi suoritetaan tarkoituksenmukaisesti liuottimessa, kuten dimetyyliformamidissa, tetrahydrofuraanissa, tolueenissa tai metyleenikloridissa vastaavalla karboksyylihapolla tai sen reaktiokykyisellä johdoksella, kuten anhydridillä, happohalogenidilla, 1-imidatsolyyli johdoksella tai sen seka-anhydrideillä karboksyylihappojen tai hiilihappoestereiden kanssa, mahdollisesti, kun mukana on happoaktivoivaa ja/tai vettä sitovaa ainetta, esimerkiksi kloorimuuraishappoetyyliesteriä, tionyylikloridia, N,N'-disykloheksyylikarbodi-imidiä tai N,N'-karbonyylidi-imidatsoli, ja mahdollisesti, kun mukana on epäorgaanista emästä, kuten natriumkarbonaattia tai tertiääristä orgaanista emästä, kuten trietyyliamiinia tai pyridiiniä, joka samanaikaisesti voi toimia myös liuottimena, lämpötiloissa välillä -25 ja 250°C , parhaiten kuitenkin lämpötilassa välillä -10°C ja käytetyn liuottimen kiehumislämpötila.

Jälkikäteen tapahtuva hapettaminen suoritetaan parhaiten liuottimessa, esimerkiksi vedessä vesi/pyridiinissä, jäätikassa tai metanolissa, käytetystä hapettimesta riippuen tarkoituksenmukaisesti lämpötiloissa välillä -80 ja 100°C .

Yleiskaavan I mukaisen sulfoksidin valmistamiseksi suoritetaan jälkikäteen tapahtuva hapettaminen ekvivalentilla käytettyä hapetinta, esimerkiksi vetyperoksidilla jääetikassa 0 - 20°C:ssa, perhapolla, kuten peretikkahapolla, m-klooriperbentsoehapolla tai peroksitrifluorietikkahapolla 0 - 50°C:ssa, natriummetaperjodaatilla vesipitoisessa metanölissä tai etanolissa 15 - 25°C:ssa, tert.butyylihypoklooriitilla metanolissa -80 - -30°C:ssa, jodibentseenidikloridilla vesipitoisessa pyridiinissä 0 - 50°C:ssa, typpihapolla jääetikassa 0 - 20°C:ssa, kromihapolla jääetikassa tai asetonissa 0 - 20°C:ssa ja sulfuryylikloridilla metyleenikloridissa -70°C:ssa, jolloin saatu tioetteri-kloorikompleksi hydrolysoidaan tarkoituksenmukaisesti vesipitoisella etanolilla.

Yleiskaavan I mukaisen sulfonin valmistamiseksi jälkikäteen tapahtuva hapettaminen suoritetaan tarkoituksenmukaisesti kahdella ekvivalentilla käytettyä hapetinta, esimerkiksi vetyperoksidilla jääetikassa 20 - 100°C:ssa, perhapolla, kuten peretikkahapolla, m-klooriperbentsoehapolla tai peroksitrifluorietikkahapolla lämpötiloissa välillä 0 ja 50°C, typpihapolla jääetikassa 0 - 20°C:ssa, kromihapolla tai kaliumpermanganaatilla jääetikassa, vesi/rikkihapossa tai asetonissa 0 - 20°C:ssa.

Lisäksi voidaan uudet yleiskaavan I mukaiset bentsoyyl johdokset muuntaa epäorgaanisilla tai orgaanisilla hapoilla fysiologisesti sopiviksi happoadditiösuoloikseen käyttämällä kyseistä happoa 1 - 3 ekvivalenttia. Happoina ovat osoittautuneet sopiviksi esimerkiksi suolahappo, bromivetyhappo, rikkihappo, fosforihappo, maitohappo, sitruunahappo, viinihappo, maleiinihappo tai fumaarihappo.

Lähtöaineina käytetyt yleiskaavojen II - V mukaiset yhdisteet ovat osaksi tunnettuja kirjallisuudesta tai ne voidaan valmistaa sinänsä tunnetuilla menetelmillä. Siten esimerkiksi yleiskaavan IV mukaiset bentsoehapot ja niiden valmistaminen on kuvattu englantilaisessa patentissa 1 469 187; yleiskaavojen III (kts. DOS-julkaisu 2 926 471, jätetty 30.6.79) ja V mukaiset yhdisteet saadaan esteröimällä tai amidoimalla vastaavat karboksyylihapot vastaavilla yhdisteillä.

Kuten edellä jo mainittiin, uusilla yleiskaavan I mukaisilla yhdisteillä sekä niiden fysiologisesti sopivilla suoloilla epäorgaanisten

tai orgaanisten happojen kanssa on arvokkaita farmakologisia ominaisuuksia, erityisesti tulehduksia estävä vaikutus, samalla kun niillä on yllättävän vähäiset sivuvaikutukset.

Esimerkiksi seuraavien yhdisteiden biologiset ominaisuudet tutkittiin jäljempänä kuvatulla tavalla:

- A = 1-/4-amino-3-bromi-5- (N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli) - bentsoyylioksi/-2- (4-klooribentsoyyli) -5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani-hydrokloridi,
- B = 1- (4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi) -2-/1- (4-klooribentsoyyli) -5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani-hydrokloridi,
- C = 1-/4-amino-3-bromi-5- (N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli) - bentsoyylioksi/-5-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyli-asetoksi/-n-pentaani-hydrokloridi,
- D = 1-/4-amino-3-bromi-5- (N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli) - bentsoyylioksi/-6-/2-/2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-n-heksaani-hydrokloridi,
- E = N-/2-/4-amino-3-bromi-5- (N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli) - bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-etyyli/-etyyliamiini-dihydrokloridi,
- F = 2-/4-amino-3-bromi-5- (N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli) - bentsoyylioksi/-2'-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-bentsyyli-asetoksi/-dietyyliksidi-hydrokloridi,
- G = 2-/4-amino-3-bromi-5- (N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli) - bentsoyylioksi/-2'-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) -amino/-fenyyli-asetoksi/-dietyylisulfidi-hydrokloridi,
- H = 1-/4-amino-3-bromi-5- (N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli) - bentsoyylioksi/-2- (3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi) - etaani-hydrokloridi,

- I = N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-
bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-
asetoksi)-etyyli/-n-propyyliamiini,
- J = 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-
bentsoyylioksi/-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-
n-propaani,
- K = 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-
bentsoyylioksi/-2'-/ (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi,
dietyylisulfidi,
- L = 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-
bentsoyylioksi/-2'-/ α -metyyli-4-(2-metyylipropyyli)-fenyyli-
asetoksi/-dietyylioksidi ja
- M = N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-
bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/ α -metyyli-4-(2-metyylipropyyli)-
fenyyliasetoksi/-etyyli/-n-propyyliamiini.

.) Antiflogistinen vaikutus:

Metodiikka:

Kumpaakin sukupuolta olevilla rotilla (oma kanta), joiden paino oli 120 - 150 g, laukaistiin ödeema Winter'in et al. (J. Pharmacol. 141, 369 (1963)) mukaisesti injisoimalla jalkapohjan alle 0,05 ml karra-geenin 1-prosenttista liuosta 0,85-prosenttisessä NaCl-liuoksessa.

Tutkittavat yhdisteet annettiin mahaletkun kautta 60 minuuttia ennen ödeeman aiheuttamista hierteenä 1-prosenttisessä metyyliiselluloosassa (1 ml/100 painogramma). Jalan turvotus mitattiin 3 tuntia ödeeman laukaisun jälkeen Doepfner'in ja Cerletti'n (Int. Arch. Allergy appl. Immunol. 12, 89 (1958)) antamalla tekniikalla.

Tutkittavien aineiden eri annoksilla saaduista turpoamisarvojen muutoksista laskettiin Linder'in lineaarisella regressioanalyysillä (Statistische Methoden, 4, painos ss. 148 - 162) Birkhäuser, Basel (1964)) Fieller'in mukaisesti (Quart. J. Pharm. Pharmacol. 17, 117-123 (1944)) ED₃₅ sinä annoksena, joka pienensi turpoamisarvoja 35 %.

Saadut arvot on esitetty seuraavassa taulukossa:

Yhdiste	n_1	n_2	ED ₃₅ mg/kg
A	4	10	84,7
B	4	10	35,5
C	4	10	9,9
D	3	10	29,9
E	4	10	18,9
F	3	10	49,2
G	3	10	6,7
H	5	10	15,8
I	3	10	2,7
J	3	10	36,1
K	3	10	36,2
L	4	10	24,7
M	3	10	53,3

n_1 = Tutkittujen annosten lukumäärä

n_2 = Eläinten lukumäärä/annos

2.) Suuntaa-antava toksisuus:

Kumpaakin sukupuolta oleville rotille (oma kanta) annettiin mahaletkun kautta tutkittavia aineita 100 mg/kg hierteenä 1-prosenttisessa metyyliiselluloosassa (1 ml/100 painogrammaa). Eläimiä tarkkailtiin 24 tuntia. Saadut arvot on esitetty seuraavassa taulukossa:

Yhdiste	Annos mg/kg	n	Oireellisten eläin- ten lukumäärä	Kuolleiden eläin- ten lukumäärä
A	100	10	0/10	0/10
B	100	10	0/10	0/10
C	100	10	0/10	0/10
D	100	10	0/10	0/10
E	100	10	0/10	0/10
F	100	10	0/10	0/10
G	100	10	0/10	0/10
H	100	10	0/10	0/10
I	100	10	0/10	0/10
J	100	10	0/10	0/10
K	100	10	0/10	0/10
L	100	10	0/10	0/10
M	100	10	0/10	0/10

Oheisen keksinnön perustana on siten tieto, että liittämällä anti-flogistika, joka sisältää karboksyyli-ryhmän, esterimäisesti ja/tai amidimäisesti siltajäsenen kautta substituoitu aminometyyli-amino-bentsoehapon kanssa saadaan uusia bentsoyyl johdoksia, joilla on tulehduksia estäviä ominaisuuksia ja samalla yllättäen erinomainen siedettävyyttä.

Farmakologisten ominaisuuksiensa vuoksi sopivat keksinnön mukaisesti valmistetut yleiskaavan I mukaiset yhdisteet sekä niiden fysiologisesti sopivat suolat epäorgaanisten tai orgaanisten happojen kanssa tulehdustilojen, kuten Periarthritis humeroscapularis, Brusiitti, Synoviitti, Tendiitti, Tendovaginiitti, kihti, Polyartriitti, Arthrosis deform., Spondylitis ankylopoetica tai noidanuoli hoitoon. Tätä tarkoitusta varten ne voidaan työstää, mahdollisesti yhdistelmänä muiden tehoaineiden kanssa, tavanomaisiksi farmaseuttisiksi valmistemuodoiksi, kuten tableteiksi lääkerakeiksi, kapseleiksi, lääkepuikoiksi, suspensioiksi, voiteiksi tai kermoiksi. Ihmisillä yksittäisannos on 100 - 600 mg, parhaiten kuitenkin 300 - 450 mg, 1 - 3 kertaa päivässä.

Seuraavat esimerkit selventävät keksintöä lähemmin:

Esimerkki A

1-/4-amino-3-bromi-5-(n-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2,3-dihydroksi-n-propaani

70 g (0,185 moolia) 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoehappo-natriumsuolaa suspendoidaan 250 ml:aan 1-kloori-2,3-dihydroksi-n-propaania ja kuumennetaan sekoittaen 3 tuntia 110 - 120°C:ssa. Sen jälkeen suurin osa ylimääräisestä 1-kloori-2,3-dihydroksi-n-propaanista tislataan pois 0,02 mm Hg paineessa, jäännös liuotetaan metyleenikloridin, metanolin ja väkevän ammoniakkin seokseen (90/10/1) ja kromatografoidaan piihappogee-lillä. Saatu raskasliikkeinen öljy liuotetaan 130 ml:aan isopropanolia, laimennetaan 200 ml:lla etikkahappoetyyliesteriä ja muunnetaan sen jälkeen eetteripitoisella suolahapolla hydrokloridiksi, joka kiteytyy 24 tunnin kuluessa 0 - 5°C:ssa. Kiteet erotetaan imulla, pestään pienellä määrällä eetteriä ja kuivataan. Hydrokloridin sulamispiste: 167 - 173°C.

Esimerkki B

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaani

41 g (0,1 moolia) 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridi-hydrokloridia liuotetaan 250 ml:aan etyleeniglykolia, lisätään 17 g (0,22 moolia) pyridiiniä ja kuumennetaan sen jälkeen tunti 105°C:ssa. Huoneen lämpötilaan jäähdyttämisen jälkeen laimennetaan litralla vettä, lisätään natriumhydroksidia ja uutetaan eetterillä. Eetteriliuos kuivataan natriumsulfaatilla ja haihdutetaan kuiviin. Jäännös kromatografoidaan piihappogee-lillä (etikkahappoetyyliesteri). Haihduttamalla eluaatti saadaan hartsia, joka kiteytyy hierrettäessä petroleetterin kanssa ja joka kiteytetään uudelleen etanolista. Sulamispiste: 72 - 75°C.

Esimerkki C

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bents-amido/-3-hydroksi-n-propaani

30 g (0,073 mooli) 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoylikloridi-hydrokloridia liuotetaan 400 ml:aan tetrahydrofuraania ja liuos tiputetaan hitaasti liuokseen, joka sisältää 15 g (0,2 moolia) 3-amino-n-propanolia 300 ml:ssa tetrahydrofuraania. Seosta sekoitetaan puoli tuntia 50°C:ssa ja haihdutetaan sen jälkeen tyhjiössä. Jäännös jaetaan veden ja kloroformin kesken, kloroformifaasi erotetaan, kuivataan ja haihdutetaan. Jäännös liuotetaan isopropanoliin, tehdään happameksi etanolipitoisella suolahapolla ja laimennetaan eetterillä. Hydrokloridi erotetaan imulla ja kuivataan.

Hydrokloridin sulamispiste: 110 - 113°C.

Esimerkki D

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bents-amido/-4-hydroksi-n-butaani

27,5 g (0,067 moolia) 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoylikloridi-hydrokloridia liuotetaan 400 ml:aan tetrahydrofuraania ja liuos tiputetaan hitaasti liuokseen, jossa on 12 g (0,135 moolia) 4-amino-butanolia. Seosta sekoitetaan puoli tuntia 50°C:ssa ja sen jälkeen haihdutetaan tyhjiössä. Jäännös jaetaan veden ja kloroformin kesken, kloroformifaasi erotetaan, kuivataan ja haihdutetaan. Jäännös puhdistetaan kromatograafisesti piihappogeelillä (kloroformi:metanoli (9/1)). Kun eluaatti haihdutetaan, saadaan öljyä.

IR-spektri (metyleenikloridi). amidi-CO 1650 cm⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 285 nm

Esimerkki E

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyl-lioksi/-2,3-dihydroksi-n-propaani

2,1 g (0,05 moolia) 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyl-lioksi/-2,3-epoksi-n-propaania liuotetaan seokseen,

jossa on 100 ml vettä ja 100 ml metanolia. Saatu liuos säädetään rikkihapolla pH-arvoon 2 - 3, lisätään noin 20 mg rauta(III)-kloridia ja keitetään sen jälkeen refluksoiden 2 tuntia. Jäähdyttämisen jälkeen neutraloidaan, haihdutetaan tyhjiössä kuiviin ja jäännös puhdistetaan kromatograafisesti piihappogeelillä (metyleenikloridi:metanoli:väkevä ammoniakki (90/10/1)). Saatu öljy liuotetaan isopropanoliin ja hydrokloridi kiteytetään lisäämällä eetteripitoista suolahappoa ja etikkahappoetyyliesteriä. Hydrokloridin sulamispiste: 167 - 173°C.

Esimerkki F

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-6-kloori-n-heksaani

5,2 g (0,013 moolia) 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-6-hydroksi-n-heksaania liuotetaan 15 ml:aan kloroformia ja sekoitetaan 15 ml:n kanssa tionyylikloridia 3 tuntia 60°C:ssa. Reaktioseos haihdutetaan ja jäännös otetaan kloroformiin. Orgaaninen faasi pestään natriumbikarbonaattiliuoksella, kuivataan ja haihdutetaan. Saatu jäännös liuotetaan isopropanoliin ja hydrokloridi saostetaan eetteripitoisella suolahapolla. Hydrokloridin sulamispiste: 121 - 122°C.

Esimerkki G

N-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli/-L-seriini-metyyliesteri

Liuokseen, joka sisältää 27,4 g (0,07 moolia) 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoehappo-hydrokloridia 250 ml:ssa dimetyyliformamidia, lisätään annoksittain 13 g (0,08 moolia) N,N'-karbonyylidi-imidatsolia huoneen lämpötilassa samalla sekoittaen. Lisäyksen jälkeen lämmitetään 50°C:een ja pidetään tässä lämpötilassa 1 tunti. Huoneen lämpötilaan jäähdyttämisen jälkeen lisätään yhä sekoittaen liuos, jossa on 12,5 g (0,08 moolia) L-seriinimetyyliesteri-hydrokloridia ja 8,1 g (0,08 moolia) trietyyliamiinia 100 ml:ssa dimetyyliformamidia, ja sekoitetaan vielä 16 tuntia. Sen jälkeen poistetaan liuotin tyhjiössä ja jäännös jaetaan veden ja kloroformin kesken. Kloroformifaasi pestään vedellä, kuiva-

taan natriumsulfaatilla ja haihdutetaan tyhjiössä. Jäljelle jää vaaleankeltaista öljyä, joka kromatografoidaan piihappogeelillä (500 g piihappogeeliä, kloroformi:etikkahappoetyyliesteri = 3/1). Saadaan väritöntä vaahtoa.

IR-spektri (metyleenikloridi): OH	3600 cm ⁻¹
NH ₂	3440 cm ⁻¹
Esteri-CO	1745 cm ⁻¹
Amidi-CO	1675 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm (olka), 29 nm.

Esimerkki H

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyl/-D-manniitti

8,25 g (8,9 millimoolia) 1,6-bis-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyl/-D-manniitti-dihydrokloridia liuotetaan seokseen, jossa on 250 ml tetrahydrofuraania ja 100 ml vettä. Huoneen lämpötilassa tiputetaan liuokseen samalla sekoittaen liuos, jossa on 13,5 ml 2N natriumhydroksidia 100 ml:ssa tetrahydrofuraania. Reaktioliuosta sekoitetaan huoneen lämpötilassa 2 1/2 tuntia, lisätään 300 ml eetteriä ohutlevykromatograafisen arvioinnin jälkeen ja syntyneet faasit erotetaan lyhyen ravistelun jälkeen. Sen jälkeen uutetaan orgaaninen faasi 2N suolahapolla, vesipitoinen suolahappoinen uute säädetään alkaliseksi väkevällä ammoniakilla ja uutetaan eetterillä. Eetteriuutteet pestään vedellä, kuivataan magneesiumsulfaatilla ja haihdutetaan tyhjiössä. Sen jälkeen haihdutusjäännös kromatografoidaan piihappogeelillä (kloroformi:metanoli: väkevä ammoniakki = 9/1/0,1) ja saadut jakeet haihdutetaan tyhjiössä kuiviin. Haihdutusjäännös liuotetaan 150 ml:aan etikkahappoetyyliesteriä ja liuokseen lisätään laskettu määrä eetteripitoista suolahappoa. Saatu hydrokloridi erotetaan imulla ja kiteytetään uudelleen metanoli/etikkahappoetyyliesteristä.

Hydrokloridin sulamispiste: 153 - 160°C (hajoaa).

Esimerkki I

1-/4-amino-3-bromi-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2,3-dihydro-n-propaani

9,8 g (0,025 moolia) 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliamino-metyyli)-bentsoehappo-hydrokloridia suspendoidaan 10 g:aan (0,135 moolia) 2,3-epoksi-n-propanolia, lisätään 250 mg rauta(III)-kloridia ja lämmitetään 3 tuntia 60°C:ssa. Reaktioseos jaetaan veden ja kloroformin kesken, kloroformifaasi erotetaan, kuivataan ja haihdutetaan kuiviin. Jäännös puhdistetaan kromatograafisesti piihappogeelillä (metyleenikloridi:metanoli:väkevä ammoniakki = 90/10/1). Eluaatti haihdutetaan, jäännös liuotetaan isopropanoliin ja hydrokloridi kiteytetään etanolipitoinen suolahappo/etikkahappoetyyli-esterillä.

Hydrokloridin sulamispiste: 167 - 173°C.

Edellisten esimerkkien kanssa analogisesti valmistettiin seuraavat yhdisteet:

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-kloori-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 162 - 164°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
lioksi/-5-hydroksi-n-pentaani

Hydrokloridin sulamispiste: 140 - 142°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-3-kloori-n-propaani

Hydrokloridin sulamispiste: 185 - 187°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-4-kloori-n-butaani

Hydrokloridin sulamispiste: 158 - 160°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-5-kloori-n-pentaani

Hydrokloridin sulamispiste: 141 - 142,5°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-7-kloori-n-heptaani

Hydrokloridin sulamispiste: 129 - 131°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-8-kloori-n-oktaani

Hydrokloridin sulamispiste: 114 - 117°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-3-hydroksi-n-propaani

Hydrokloridin sulamispiste: 184 - 185°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-4-hydroksi-n-butaani

Hydrokloridin sulamispiste: 148 - 150°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-5-hydroksi-n-pentaani

Hydrokloridin sulamispiste: 158 - 160°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-6-hydroksi-n-heksaani

Hydrokloridin sulamispiste: 98 - 101°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-7-hydroksi-n-heptaani

Hydrokloridin sulamispiste: 102 - 104°C (haj.).

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-8-hydroksi-n-oktaani

Hydrokloridin sulamispiste: 99 - 103°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-4-hydroksi-sykloheksaani

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1700 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 298 - 300 nm.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-hydroksi-n-propaani

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm (olka), 297 nm.

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-3-hydroksi-n-butaani

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-Co 1705 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm (olka), 299 nm.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-5-hydroksi-n-pentaani

Hydrokloridin sulamispiste: $162 - 163^{\circ}\text{C}$.

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli/-
(+)-viinihappodietyyliesteri

$\text{C}_{24}\text{H}_{35}\text{BrN}_2\text{O}_7$ (543,5)

Laskettu: C 53,04 H 6,49 Br 14,70 N 5,15

Saatu: 53,30 6,59 14,55 5,12

1-/4-amino-3-bromi-5-(n-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2,3-epoksi-n-propaani

IR-spektri (metyleneikloridi): Esteri-CO 1705 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 300 nm.

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2'-hydroksi-dietyleenioksidi

$\text{C}_{20}\text{H}_{31}\text{BrN}_2\text{O}_4$ (443,4)

Laskettu: C 54,18 H 7,05 Br 18,02 N 6,32

Saatu: 53,90 7,19 18,25 6,26

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyy-
lioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-metyyliamiini

$\text{C}_{21}\text{H}_{34}\text{BrN}_3\text{O}_3$ (456,4)

Laskettu: C 55,26 H 7,51 Br 17,51 N 9,21

Saatu: 55,30 7,62 17,75 9,06

1-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-4-(2-hydroksietyyli)-piperatsiini

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 cm^{-1}
Na-lkyyli 2830 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 300 nm.

1-/3-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-rpopyyli/-4-(2-hydroksietyyli)-piperatsiini

Trivetymaleinaatin sulamispiste: $144 - 146^{\circ}\text{C}$ (haj.).

1,6-bis-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli/-D-manniitti-dihydrokloridi

IR-spektri (KBr): Esteri-CO 1710 cm^{-1}
N-alkyyli 2840 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 295 nm.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-3-kloori-n-propaani

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 300 nm.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-2-hydroksi-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: lähtien 65°C (haj.).

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-5-hydroksi-n-pentaani

IR-spektri (metyleenikloridi): Amidi-CO 1650 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 285 nm.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-6-hydroksi-n-heksaani

IR-spektri (metyleenikloridi): Amidi-CO 1650 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 285 nm.

Trans-1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-4-hydroksi-sykloheksaani

Dihydrokloridin sulamispiste: 176°C (haj.).

N-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli/
D-glukoosiini

Sulamispiste: 100 - 190°C (hajoaa hitaasti samalla vaahdoten).

$C_{22}H_{24}BrN_3O_6$ (516,5)

Laskettu: C 51,16 H 6,64 Br 15,47 N 8,14

Saatu: 51,00 6,87 15,30 8,00

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/
2-amino-etaani

Sulamispiste: 85°C:sta lähtien (haj.).

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-kloori-
etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 142 - 145°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-3-kloori-
n-propaani

Hydrokloridin sulamispiste: 167 - 168°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-kloori-
n-butaani

Hydrokloridin sulamispiste: 159 - 162°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-5-kloori-
n-pentaani

Hydrokloridin sulamispiste: 117 - 119°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-6-kloori-
n-heksaani

Hydrokloridin sulamispiste: 121 - 122°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-
etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 151 - 152°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-3-hydroksi-
n-propaani

Hydrokloridin sulamispiste: 139 - 141°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaani

Hydrokloridin sulamispiste: 163 - 165°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-5-hydroksi-n-pentaani

Hydrokloridin sulamispiste: 137,5 - 138,5°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2,3-di-hydroksi-n-propaani

Massaspektri: M^+ 374/6 m/e (monobromi)

Laskettu: $C_{15}H_{23}BrN_2O_4$ (374/6)

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-3-kloori-n-propaani

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1715 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 298 - 300 nm.

1-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-iminometyyli-bentsoyylioksi)-5-kloori-n-pentaani

Hydrokloridin sulamispiste: 160 - 162°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-syklopentyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-kloori-n-pentaani

Hydrokloridin sulamispiste: 131 - 133°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-kloori-n-pentaani

Hydrokloridin sulamispiste: 156 - 158°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-kloori-n-pentaani

Hydrokloridin sulamispiste: 145 - 147°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 80 - 81°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-isorpopyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 90 - 93°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 124 - 128°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-tert.butyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 192 - 194°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-sykloheksyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaani

Dihydrokloridin sulamispiste: 149°C (haj.).

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-metyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 169 - 171°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-syklopentyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 186 - 187°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 166 - 168°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 194 - 196°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(4-pyridyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 217 - 218°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-pyrrolidinometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 213 - 214°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 214 - 216°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 179 - 181°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(4-metyyli-piperatsinometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaani

Dihydrokloridin sulamispiste: 163 - 165°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-heksametyleen-iminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaani

Hydrokloridin sulamispiste: 209°C (hajoaa).

1-/4-amino-3-bromi-5-(2-dietyyliaminoetyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaani

Dihydrokloridin sulamispiste: 87 - 90°C (haj.).

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-1-fenyyli-2-hydroksi-etaani

IR-spektri (metyleenikloridi):	OH	3600 cm ⁻¹
	NH ₂	3440 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2930 cm ⁻¹
	Esteri-CO	1710 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 297 nm.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-fenyyli-2-hydroksi-etaani

IR-spektri (metyleenikloridi):	OH	3600 cm ⁻¹
	NH ₂	3450 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2950 cm ⁻¹
	Esteri-CO	1710 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 293 nm.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-1,2-difenyyli-2-hydroksi-etaani

IR-spektri (metyleenikloridi):

OH	3600 cm ⁻¹
NH ₂	3450 cm ⁻¹
N-alkyyli	2940 cm ⁻¹
Esteri-CO	1725 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 295 nm.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyl-
lioksi/-2-hydroksimetyyli-2-metyyli-n-pentaani

IR-spektri (metyleenikloridi):

OH	3620 cm ⁻¹
NH ₂	3460 cm ⁻¹
N-alkyyli	2960 cm ⁻¹
Esteri-CO	1705 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 288 nm.

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyl-
oksimetyyli/-6-hydroksimetyyli-pyridiini

IR-spektri (metyleenikloridi):

OH	2610 cm ⁻¹
NH ₂	3440 cm ⁻¹
N-alkyyli	2920 cm ⁻¹
Esteri-CO	1710 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 298 nm.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyl-
oksimetyyli/-4-hydroksimetyyli-bentseeni

IR-spektri (metyleenikloridi):

OH	2600 cm ⁻¹
NH ₂	3450 cm ⁻¹
N-alkyyli	2940 cm ⁻¹
Esteri-CO	1705 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 295 nm.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsyyli-
oksimetyyli/-4-hydroksimetyyli-syklohekseeni

IR-spektri (metyleenikloridi):

OH	3600 cm ⁻¹
NH ₂	3440 cm ⁻¹
N-alkyyli	2910 cm ⁻¹
Esteri-CO	1695 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 294 nm.

1-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliaminometyyli-bentsoyyl-
lioksi)-5-hydroksi-n-pentaani

Hydrokloridin sulamispiste: 155 - 157°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-5-hydroksi-n-pentaani

Hydrokloridin sulamispiste: 205 - 207°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-piperridinometyyli-bentsoyylioksi)-5-hydroksi-n-pentaani

Hydrokloridin sulamispiste: 186 - 188°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(4-metyyli-piperatsinometyyli)-bentsoyylioksi/-5-hydroksi-n-pentaani

Dihydrokloridin sulamispiste: 182 - 185°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-metyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-hydroksi-n-pentaani

Dihydrokloridin sulamispiste: 123 - 126°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(4-metyylipiperatsinometyyli)-bentsoyylioksi/-4-hydroksi-n-butaani

Dihydrokloridin sulamispiste: 200 - 202°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-heksametyleenii-iminometyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaani

Hydrokloridin sulamispiste: 159 - 161°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-metyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-4-hydroksi-n-butaani

Hydrokloridin sulamispiste: 163 - 165°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-pyrrolidinometyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaani

Hydrokloridin sulamispiste: 140 - 144°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaani

Hydrokloridin sulamispiste: 182 - 184°C.

1-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaani

Hydrokloridin sulamispiste: 170 - 172°C.

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-9-hydroksi-n-nonaani

Hydrokloridin sulamispiste: 73 - 76°C.

Esimerkki 1

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

25,0 g (0,0626 moolia) 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaania ja 25,6 g (0,0626 moolia) 1-)4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidia liuotetaan 300 ml:aan tetrahydrofuraania. Liuokseen lisätään sekoittaen huoneen lämpötilassa katalyyttinen määrä natriumhydridi-dispersiota öljyssä. Seisotetaan yön yli ja tetrahydrofuraani tislataan pois vesipumpun tyhjiössä. Jäljelle jäänyt öljy otetaan kloroformiin ja pestään kaksi kertaa vedellä. Kloroformiliuos kuivataan natriumsulfaatilla ja haihdutetaan. Raakatuote puhdistetaan edelleen kromatografoimalla piihappogeelipylväässä kloroformi/metanolilla (0,5:0,5). Saatu öljymäinen emäs kiteytetään hydrokloridina isopropanolin ja etanolipitoisen kloorivedyn seoksesta (1:), joka sisältää 15 % kloroformia.

Hydrokloridin sulamispiste: 123°C:sta lähtien (haj.).

Esimerkki 2

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-3-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-2-hydroksi-n-propaani

14,9 g (0,035 moolia) 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2,3-dihydroksi-n-propaania ja 10,6 g (0,035 moolia) 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-imidatsolidia liuotetaan 250 ml:aan absoluuttista tetrahydrofuraania. Liuokseen lisätään sekoittaen huoneen lämpötilassa katalyyttinen määrä natriumvetydispersiota öljyssä. Sekoitetaan 4 tuntia ja annetaan seistä yön yli. Sen jälkeen suodatetaan ja suodos haihdutetaan tyhjiössä. Jäännös liuotetaan kloroformiin ja pestään kolme kertaa vedellä. Kloroformiliuos kuivataan natriumsulfaatilla ja haihdutetaan tyhjiössä kuiviin.

Saatu raakatuote puhdistetaan pylväskromatograafisesti piihappogee-
lillä käyttämällä tolueeni/asetonia (7:1). Hydrokloridi saadaan siten,
että emäs liuotetaan absoluuttiseen etanoliin, lisätään absoluuttista
etanolipitoista suolahappoa, kunnes reaktio on hapan, ja haihdutetaan
kuiviin vesipumpun tyhjiössä.

Hydrokloridin sulamispiste: 82 - 94°C.

Esimerkki 3

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyy-
lioksi/-etyyli/-N-/2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-
indoli-3-asetoksi/-etyyli/-metyyliamiini

Liuokseen, jossa on 6,5 g (0,02 moolia) 1-(4-klooribentsoyyli)-5-
metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappoa 150 ml:ssa vedetöntä
tetrahydrofuraania, lisätään huoneen lämpötilassa ja samalla sekoit-
taen 3,6 g (0,022 moolia) karbonyylidi-imidatsolia. Sekoitetaan 1
tunti huoneen lämpötilassa ja sen jälkeen lisätään tipottain
-10°C:ssa liuos, jossa on 9,1 g (0,02 moolia) N-/2-/4-amino-3-bromi-
5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-
N-(2-hydroksietyyli)-metyyliamiinia 100 ml:ssa vedetöntä tetrahydro-
furaania. Lisäyksen jälkeen reaktioseokseen lisätään spaatelinkärjel-
linen 50-prosenttista natriumhydridin öljysuspensiota ja sekoitetaan
vielä 12 tuntia, jolloin lämpötila nousee hitaasti huoneen lämpöti-
laan. Liuotin haihdutetaan tyhjiössä 35°C:ssa, haihdutusjäännös
liuotetaan 150 ml:aan eetteriä ja eetteriliuos pestään vedellä,
2N ammoniakilla ja vielä kerran vedellä. Magnesiumsulfaatilla kuivattu
eetteriliuos haihdutetaan tyhjiössä 30°C:ssa, minkä jälkeen saatu
haihdutusjäännös puhdistetaan piihappogeeeli-pylväässä etyleeniklo-
ridi/metanolilla (30:1). Halutut jakeet haihdutetaan kuiviin tyhjiös-
sä kuiviin 35°C:ssa. Haihdutusjäännös liuotetaan 250 ml:aan eetteriä,
lisätään eetteripitoista suolahappoa ja dihydrokloridi eristetään
amorfisena sakkana.

Dihydrokloridin sulamispiste: 179 - 184°C (hajooa).

Esimerkki 4

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyy-
lioksi/-etyyli/-N-/2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-
etyyli/-tert.butyyliamiini

10 g (0,02 moolia) N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyli-

aminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-tert.butyylimiinia liuotetaan 200 ml:aan vedetöntä tetrahydrofuraania. Liuokseen lisätään huoneen lämpötilassa liuos, joka sisältää 6,5 g (0,022 moolia) 2-/(2,6-dikloorifenyli)amino/-fenyylietikkahappoa ja 0,3 g 4-dimetyyliaminopyridiiniä 100 ml:ssa vedetöntä tetrahydrofuraania. Reaktioliuokseen tiputetaan -10°C:ssa liuos, jossa on 4,5 g (0,022 moolia) disykloheksyylikarbodi-imidiä 50 ml:ssa vedetöntä tetrahydrofuraania. Sekoitetaan 60 minuuttia -10°C:ssa ja vielä 3 tuntia, kunnes lämpötila nousee 0°C:een, lisätään uudelleen 1,2 g (0,004 moolia) 2-/(2,6-dikloorifenyli)amino/-fenyylietikkahappoa ja 0,85 g (0,004 moolia) disykloheksyylikarbodi-imidiä ja sekoitetaan edelleen 18 tuntia huoneen lämpötilassa. Saostunut disykloheksyyliurea poistetaan imulla reaktioseoksesta, suodos haihdutetaan tyhjiössä 30°C:ssa ja saatu haihdutusjäännös kromatografoidaan piihappogeeli-pylväässä eetteri/petrolieetterillä (1:2). Halutun fraktioinnin jälkeen saatu haihdutusjäännös liuotetaan 500 ml:aan eetteriä ja amorfinen dihydrokloridi otetaan talteen sen jälkeen, kun on lisätty laskettu määrä eetteripitoista suolahappoa. Dihydrokloridin sulamispiste: 150 - 180°C.

Esimerkki 5

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

Liuokseen, joka sisältää 168 g (0,387 moolia) 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksietaanidihydrokloridia ja 30,5 g (0,387 moolia) pyridiiniä 1500 ml:ssa kloroformia, lisätään sekoittaen huoneen lämpötilassa liuos, jossa on 150,5 g (0,4 moolia) 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetyylikloridia 1000 ml:ssa kloroformia. Sekoitetaan yön yli, pestään reaktioliuos viisi kertaa 2 litralla vettä, suodatetaan aktiivihiilen läpi, kuivataan natriumsulfaatilla ja haihdutetaan vesipumpun tyhjiössä. Saatu öljy liuotetaan seokseen, jossa on 150 ml kloroformia ja 750 ml isopropanolia, ja pH säädetään arvoon 3 - 4 etanolipitoisella suolahapolla. Liuokseen lisätään 500 ml eetteriä, kunnes liuos alkaa samentua, ja tuote kiteytetään. Kiteet liuotetaan 600 ml:aan metanolia, liuokseen lisätään 1200 ml isopropanolia, jolloin yhdiste kiteytyy uudelleen. Se kuivataan 80°C:ssa tyhjiössä. Hydrokloridin sulamispiste: 123°C:sta lähtien (hajooa).

Esimerkki 6

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-hydroksi-3-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-
indoli-3-asetoksi/-n-propaani

18,5 g (0,045 moolia) 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyli-aminometyyli)-bentsoyylioksi/-2,3-epoksi-n-propaania liuotetaan 250 ml:aan kuivaa dioksaania. Tähän liuokseen lisätään 15,5 g (0,045 moolia) 4-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappoa ja 750 mg rauta(III)-kloridia. Seosta keitetään 24 tuntia refluksoiden ja estämällä kosteuden pääsy, minkä jälkeen haihdutetaan tyhjiössä.

Jäännös puhdistetaan kromatograafisesti piihappogeelillä kloroformi/metanolilla (40:1). Näin saadaan lähes väritöntä, amorfista ainetta.

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 260 nm

IR-spektri (metyleenikloridi): Amidi-CO 1675 cm^{-1}
Esteri-CO 1705 cm^{-1} ja 1740 cm^{-1} .

Esimerkki 7

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-metoksikarbonyyli-2-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliini-
asetamino/-etaani

12 g (0,036 moolia) 2-metoksikarbonyyli-2-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetamino/-etanolia, 17,3 g (0,041 moolia) 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridi-hydrokloridia, 12,5 ml trietyyliamiinia ja 2,2 g 4-dimetyyliamino-pyridiiniä lisätään 200 ml:aan metyleenikloridia. Seosta kuumennetaan 1 tunti refluksoiden. Huoneen lämpötilaan jäädyttämisen jälkeen pestään kaksi kertaa 200 ml:lla vettä. Metyleenikloridiliuos erotetaan, kuivataan natriumsulfaatilla ja haihdutetaan tyhjiössä kuiviin. Öljymäinen jäännös puhdistetaan kromatografiapylväässä (piihappogeeli; bentseeni/asetoni = 19:1) ja eluaatti haihdutetaan. Saadaan väritöntä vaahtoa.

IR-spektri (metyleenikloridi):	NH ₂	2510 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2930 cm ⁻¹
	O-CH ₃	2850 cm ⁻¹
	Esteri-CO	1750 ja 1720 cm ⁻¹
	Amidi-CO	1680 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 234 nm, 295 nm.

Esimerkki 8

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

26,2 g (0,057 moolia) 5-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-pentyylikloridia, 20 g (0,063 moolia) 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyli-etikkahappo-natriumsuolaa ja 4,2 g natriumjodidia liuotetaan 280 ml:aan absoluuttista dimetyyliformamidia ja pidetään 4 tuntia 110°C:ssa silloin tällöin ravistellen. Dimetyyliformamidi tislataan pois vesipumpun tyhjiössä, jäännös liuotetaan kloroformiin, pestään vedellä, orgaaninen faasi kuivataan natriumsulfaatilla ja haihdutetaan tyhjiössä. Saatu raakatuote kromatografoidaan piihappogeelipylväässä käyttämällä sykloheksaani/asetonia (9:1) ja saatu emäs kiteytetään isopropanoli/eetteristä hydrokloridina tekemällä happameksi etanolipitoisella suolahapolla. Hydrokloridin sulamispiste: 129 - 132°C.

Esimerkki 9

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-propaani

4,6 g (0,02 moolia (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappoa liuotetaan 30 ml:aan dimetyyliformamidia ja muunnetaan natriumsuolaksi lisäämällä 875 mg (0,02 moolia) natriumhydridiä. Tähän lisätään 9 g (0,02 moolia) 3-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-n-propyylikloridia 60 ml:ssa dimetyyliformamidia. Lisätään 3,5 g (0,021 moolia) kaliumjodidia ja 1 ml 15-Krone-5-eetteriä, minkä jälkeen seosta kuumennetaan 10 tuntia noin 80°C:ssa. Tämän jälkeen suurin osa dimetyyliformamidista tislataan pois tyhjiössä ja jäännös jaetaan liuokseen, jossa on 35 g

ammoniumasetaattia 400 ml:ssa jäävettä ja kloroformia. Orgaaninen faasi kuivataan natriumsulfaatilla ja haihdutetaan tyhjiössä. Jäännös puhdistetaan kromatograafisesti piihappogeelillä käyttämällä tolueeni/asetoni/ammoniakkia (80:20:0,25). Saadaan väritöntä, raskasliikkeistä öljyä.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 cm^{-1} ja 1740 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 234 nm, 298 nm.

Amorfisen hydrokloridin sulamispiste: 80°C :sta lähtien.

Esimerkki 10

1-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetyyli/-6-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli/-D-manniitti

12,3 g (0,03 moolia) 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridi-hydrokloridia, joka on liuotettu 100 ml:aan kuivattua kloroformia, lisätään tipottain jäävedessä jäähdyttäen ja sekoittaen liuokseen, jossa on 15,6 g (0,03 moolia) 1-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetyyli/-D-manniittia 200 ml:ssa absoluuttista pyridiiniä. Reaktioliuosta sekoitetaan 15 tuntia huoneen lämpötilassa, minkä jälkeen pyridiini tislataan pois tyhjiössä 50°C :ssa ja haihdutusjäännös jaetaan seokseen, jossa on 300 ml metyleenikloridia ja 300 ml vettä. Faasit erotetaan, metyleenikloridifaasi pestään kaksi kertaa 200 ml:lla 2N ammoniakkia sekä vedellä, minkä jälkeen orgaaninen liuos haihdutetaan magnesiumsulfaatilla ja haihdutetaan kuiviin tyhjiössä 35°C :ssa. Jatkopuhdistusta varten kromatografoidaan piihappogeelipylväässä kloroformi/metanolilla (30:1) ja kiteytetään metyleenikloridi/eetteristä. Sulamispiste: $97 - 112^{\circ}\text{C}$ (hajoaa).

Esimerkki 11

1-asetoksi-2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-propaani

9 g (0,025 moolia) 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoehappoa liuotetaan 60 ml:aan tetrahydrofuraania ja lisätään 4,2 g (0,026 moolia) karbonyylidi-imidatsolia. Puolen tunnin

kuluttua lisätään liuos, jossa on 7 g (0,021 moolia) 1-asetoksi-2-hydroksi-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-propaania 60 ml:ssa tetrahydrofuraania. Seosta keitetään 2 1/2 tuntia refluksoiden, annetaan seistä yön yli huoneen lämpötilassa ja haihdutetaan tyhjiössä. Jäännös jaetaan veden ja kloroformin kesken, orgaaninen faasi erotetaan, kuivataan ja haihdutetaan. Saatu jäännös puhdistetaan kromatograafisesti piihappogeelillä käyttämällä kloroformi/etikkahappoetyyliesteriä (20:1). Saadaan väritöntä, amorfista ainetta.

UV-spektri (etanoli): λ max 243 nm, 300 nm

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 cm^{-1} ja 1740 cm^{-1} .

Esimerkki 12

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyl-
oksi/-2-asetoksi-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-
n-propaani

10 g (0,0156 moolia) 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliamino-metyyli)-bentsoyyl-
oksi/-2-hydroksi-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-propaania ja 0,97 g (0,0156 moolia) pyridiiniä liuotetaan 150 ml:aan absoluuttista tetrahydrofuraania. Tähän liuokseen lisätään tipottain ja samalla sekoittaen huoneen lämpötilassa seos, jossa on 1,25 g (0,0156 moolia) asetyylikloridia 20 ml absoluuttista tetrahydrofuraania. Tetrahydrofuraani tislataan pois vesipumpun tyhjiössä, jäljelle jäänyt öljymäinen jäännös liuotetaan kloroformiin ja pestään laimealla ammoniakiliuoksella. Kloroformifaasi kuivataan natriumsulfaatilla ja haihdutetaan tyhjiössä. Raakatuote puhdistetaan piihappogeelipylväässä tolueeni/asetonilla (4:1). Saatu öljy liuotetaan absoluuttiseen etanoli/eetteriin ja säädetään happameksi etanolipitoisella suolahapolla. Hydrokloridi saadaan haihduttamalla tämä liuos kuiviin.

Hydrokloridin sulamispiste: $87 - 93^{\circ}\text{C}$.

Esimerkki 13

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-
2-/1-(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetamido/-
etaani

4,8 g (0,012 moolia) 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliamino-

metyyli)-bentsamido/-2-aminoetaania ja 4,9 g (0,012 moolia) 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappoimidatsolidia liuotetaan 75 ml:aan tetrahydrofuraania. Lisätään katalyyttinen määrä natriumhydrididispersiota öljyssä ja sekoitetaan 1 tunti huoneen lämpötilassa. Tetrahydrofuraani tislataan pois tyhjiössä, jäännös liuotetaan kloroformiin ja pestään kolme kertaa vedellä. Orgaaninen faasi kuivataan natriumsulfaatilla ja suodatetaan aktiivihiilen läpi. Haihdutetaan tyhjiössä, liuotetaan isopropanoliin, tehdään happameksi eetteripitoisella suolahapolla ja hydrokloridi saostetaan lisäämällä eetteriä.

Hydrokloridin sulamispiste: 145°C:sta lähtien (hajoaa).

Esimerkki 14

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-dietyylisulfoksidi

Liuokseen, jossa on 10 g (0,0125 moolia) 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-dietyylisulfiidia 100 ml:ssa jääetikkaa, lisätään sekoittaen huoneen lämpötilassa 1,5 g (0,0125 moolia) 30-prosenttista vesipitoista vetyperoksidi-liuosta. Reaktioliuosta sekoitetaan 2 tuntia huoneen lämpötilassa ja sen jälkeen haihdutetaan tyhjiössä 40°C:ssa. Saatu jäännös liuotetaan 300 ml:aan eetteriä lisäämällä 100 ml tetrahydrofuraania ja liuos pestään 2N ammoniakilla ja vedellä. Sen jälkeen orgaaninen faasi kuivataan magnesiumsulfaatilla, haihdutetaan tyhjiössä kuiviin 35°C:ssa ja saatu haihdutusjäännös puhdistetaan piihappogeelipylväässä metyleenikloridi/metanolilla (75:1). Halutut jakeet yhdistetään ja haihdutetaan kuiviin tyhjiössä 35°C:ssa. Reaktiotuote saadaan öljymäisenä haihdutusjäännöksenä, johon kiinnittynyt liuotinjäännös poistetaan rikkihappo-kuivausaineella tyhjiössä huoneen lämpötilassa.

$C_{39}H_{45}BrClN_3O_7S$ (815,2)

Laskettu: C 57,46 H 5,56 Br 9,80 Cl 4,35 N 5,15

Saatu: 57,64 5,75 9,64 4,28 5,00,

Esimerkki 15

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-dietyylisulfony

Liuokseen, joka sisältää 10 g (0,0125 moolia) 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-dietyylisulfidia 150 ml:ssa jääetikkaa, lisätään 3 g (0,025 moolia) 30-prosenttista vetyperoksidiliuosta. Sekoitetaan 30 tuntia huoneen lämpötilassa, minkä jälkeen jääetikka haihdutetaan tyhjiössä 40°C:ssa. Sen jälkeen haihdutusjäännös liuotetaan seokseen, jossa on 300 ml eetteriä ja 150 ml tetrahydrofuraania, ja liuos pestään 2N ammoniakilla ja vedellä. Ennen tyhjiössä haihduttamista orgaaninen faasi kuivataan magnesiumsulfaatilla. Haihdutusjäännös kromatografoidaan kaksi kertaa piihappogeeli-pylväässä eetteri/tetrahydrofuraanilla (10:1) tai metyleenikloridi/metanolilla (75:1). Fraktioidaan, yhdistetyt jakeet haihdutetaan tyhjiössä 35°C:ssa, jolloin saadaan vahtomaista haihdutusjäännöstä.

$C_{39}H_{45}BrClN_3O_8S$ (831,2)

Laskettu: C 56,35 H 5,46 Br 9,61 Cl 4,27 N 5,06 S 3,86

Saatu: 56,11 5,41 9,91 4,41 4,95 4,10

Esimerkki 16

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-3-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyli-aminometyyli)-bentsoyylioksi/-3-hydroksin-propaanista. Öljy.

$C_{38}H_{43}BrClN_3O_6$ (743,1)

Laskettu: C 60,60 H 5,76 Br 10,61 Cl 4,71 N 5,58

Saatu: 60,80 5,93 10,73 4,76 5,35

Esimerkki 17

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-4-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-4-hydroksi-n-butaanista. Öljy.

$C_{39}H_{45}BrClN_3O_6$ (767,2)

Laskettu: C 61,06 H 5,91 Br 10,42 Cl 4,62 N 5,48

Saatu: 61,30 6,08 10,05 4,46 5,46

Esimerkki 18

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

$C_{40}H_{47}BrClN_3O_6$ (781,2)

Laskettu: C 61,50 H 6,06 Br 10,23 Cl 4,54 N 5,38

Saatu: 61,70 6,11 10,10 4,48 5,18

Esimerkki 19

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-6-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-heksaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-6-hydroksi-n-heksaanista. Öljy.

$C_{41}H_{49}BrClN_3O_6$ (795,2)

Laskettu: C 61,93 H 6,21 Br 10,05 Cl 4,46 N 5,28

Saatu: 62,20 6,15 10,30 4,57 5,32

Esimerkki 20

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bensoyylioksi/-etyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)-amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 94 - 98°C.

Esimerkki 21

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-3-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 3-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-propyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)-amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 76 - 92°C.

Esimerkki 22

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-4-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-butylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)-amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 75 - 83°C.

Esimerkki 23

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-6-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-n-heksaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 6-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-heksyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)-amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 105 - 108°C.

Esimerkki 24

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 60 - 64°C.

Esimerkki 25

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-3-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-3-hydroksi-n-propaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 56°C:sta lähtien (sintrautuu).

Esimerkki 26

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-4-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-4-hydroksi-n-butaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 59 - 64°C.

Esimerkki 27

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-5-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1700 ja 1730 cm^{-1}
 UV-spektri (etanoli): max 258 nm, 295 nm.

Esimerkki 28

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
 oksi/-6-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-heksaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-6-hydroksi-n-heksaanista. Öljy.
 IR-s-ektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 ja 1730 cm^{-1}
 UV-spektri (etanoli): λ max 258 nm, 295 nm.

Esimerkki 29

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
 oksi/-2-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2	2440 cm^{-1}
N-alkyyli	2920 cm^{-1}
OCH_3	2850 cm^{-1}
Esteri-CO	1730 ja 1710 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 234 nm, 295 nm.

Esimerkki 30

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
 oksi/3-/(+)-6-metoksi- α -metvyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-3-hydroksi-n-propaanista. Hydrokloridi on vaahto.

$C_{33}H_{41}BrN_2O_5 \times HCl$ (662,1)

Laskettu: C 59,87 H 6,39 Br 12,07 Cl 5,36 N 4,23

Saatu: 59,50 6,29 12,30 5,44 4,02

Esimerkki 31

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-4-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/4-hydroksi-n-butaanista. Öljy.

IR-spektri (metylenikloridi): NH_2 3440 cm^{-1}
 N -alkyyli 2920 cm^{-1}
 OCH_3 2850 cm^{-1}
 Esteri-CO 1835 ja 1710 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 234 nm, 295 nm.

Esimerkki 32

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-4-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3440 cm^{-1}
 N -alkyyli 2920 cm^{-1}
 OCH_3 2850 cm^{-1}
 Esteri-CO 1730 ja 1710 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 234 nm, 295 nm.

Esimerkki 33

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-6-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-heksaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naf-taliinietikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-6-hydroksi-n-heksaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3430 cm ⁻¹
Naalkyyli	2920 cm ⁻¹
OCH ₃	2850 cm ⁻¹
Esteri-CO	1730 ja 1710 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 234 nm, 295 nm.

Esimerkki 34

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-oksi/-2-/ α -metyyli-4-(2-metyylipropyli)-fenyliasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti α -metyyli-4-(2-metyylipropyli)-fenyylietikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista. Hydrokloridi on öljy.

C₃₁H₄₃BrN₂O₄ x HCl (624,1)

Laskettu: C 59,66 H 7,11 Br 12,81 Cl 5,68 N 4,49

Saatu: 59,50 7,32 12,64 5,61 4,43

Esimerkki 35

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-oksi/-3-/ α -metyyli-4-(2-metyylipropyli)-fenyliasetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti α -metyyli-4-(2-metyylipropyli)-fenyylietikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-3-hydroksi-n-propaanista. Hydrokloridi on öljy.

C₃₂H₄₅BrN₂O₄ x HCl (638,1)

Laskettu: C 60,24 H 7,27 Br 12,52 Cl 5,56 N 4,39

Saatu: 60,30 7,53 12,30 5,45 4,36

Esimerkki 36

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-4-/α-metyyli-4-(2-metyylipropyli)-fenvyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti α-metyyli-4-(2-metyylipropyli)-fenylietikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-4-hydroksi-n-butaanista. Hydrokloridin sulamispiste: 77 - 79°C.

Esimerkki 37

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-/α-metyyli-4-(2-metyylipropyli)-fenvyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti α-metyyli-4-(2-metyylipropyli)-fenylietikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-hydroksi-n-pentaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 119 - 121°C.

Esimerkki 38

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-(2-asetoksi-bentsoyylioksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 5 mukaisesti 2-asetoksi-bentsoyylikloridista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 ja 1770 cm⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 231 nm, 300 nm.

Esimerkki 39

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-(2-fluori-α-metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori-α-metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista. Hydrokloridi on öljy.

$C_{33}H_{38}BrFN O_4 \times HCl$ (662,1)

Laskettu: ^{12}C 59,87 H 5,94 Br 12,07 Cl 5,36 N 4,23

Saatu: 60,16 6,17 11,95 5,29 4,84

Esimerkki 40

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista. Hydrokloridin sulamispiste: 186 - 187°C.

Esimerkki 41

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-3-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-3-hydroksi-n-propaanista. Hydrokloridin sulamispiste: 123 - 125°C.

Esimerkki 42

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaanista. Hydrokloridin sulamispiste: 74 - 85°C.

Esimerkki 43

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-5-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidita ja 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-5-hydroksi-n-pentaa-nista.

Hydrokloridin sulmaisipiste: 70 - 74°C.

Esimerkki 44

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-6-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-heksaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-6-hydroksi-n-heksaanista. Hydrokloridin sulamisipiste: 131 - 134°C.

Esimerkki 45

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-/2-(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyliasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylitikkahappo-natriumsuolasta ja 2-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-etyylikloridista.

Hydrokloridin sulamisipiste: 76 - 82°C.

Esimerkki 46

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-3-/2-(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyliasetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylitikkahappo-natriumsuolasta ja 3-(4-amino-3-bromi-5-dietyyli-

aminometyyli-bentsoyylioksi)-n-propyylikloridista.
Hydrokloridin sulamispiste: 64 - 78°C.

Esimerkki 47

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta ja 4-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-n-butylikloridista.
Hydrokloridin sulamispiste: 58 - 69°C.

Esimerkki 48

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-5-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta ja 5-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-n-pentylikloridista.
Hydrokloridin sulamispiste: 64 - 72°C.

Esimerkki 49

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista.
Hydrokloridin sulamispiste: 123 - 124°C.

Esimerkki 50

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-nafta-

liinietikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-3-hydroksi-n-propaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 63 - 69°C.

Esimerkki 51

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliamino-metyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 47 - 71°C.

Esimerkki 52

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-5-(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1700 ja 1725 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 290 nm.

Esimerkki 53

1-/4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi/-2-(2-asetoksi-bentsoyylioksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 5 mukaisesti 2-asetoksi-bentsoyylikloridista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista. Öljy.

$\text{C}_{23}\text{H}_{27}\text{BrN}_2\text{O}_6$ (507,4)

Laskettu: C 54,45 H 5,36 Br 15,75 N 5,52

Saatu: 54,30 5,46 16,20 5,47

Esimerkki 54

1-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-iminometyyli-bentsoylyloksi)-2-/1-(4-klooribentsoylyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoylyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-imino-bentsoylyloksi)-2-hydroksi-etaanista. Hydrokloridin sulamispiste: 207 - 208°C.

Esimerkki 55

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoylyloksi/-2-/1-(4-klooribentsoylyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoylyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoylyloksi/-2-hydroksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 90 - 120°C.

Esimerkki 56

1-(4-amino-3-bromi-5-tert.butyyliaminometyyli-bentsoylyloksi)-2-/1-(4-klooribentsoylyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoylyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-tert.butyyliaminometyyli-bentsoylyloksi)-2-hydroksi-etaanista. Hydrokloridi on öljy.

$C_{33}H_{35}BrClN_3O_6 \times HCl$ (721,5)

Laskettu: C 54,89 H 5,03 Br 11,08 Cl 9,83 N 5,82

Saatu: 55,10 5,26 10,90 9,67 5,62

Esimerkki 57

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-syklopentyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-
asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-syklopentyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 206 - 207°C.

Esimerkki 58

1-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-/1-(4-
klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 174 - 176°C.

Esimerkki 59

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-metyyliaminometyyli)-bentsoyy-
lioksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-
asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-metyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 151 - 153°C.

Esimerkki 60

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyy-
lioksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-
asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-

2-metyyli-1H-indol-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 129 - 132°C.

Esimerkki 61

1-(4-amino-3-bromi-5-pyrrolidinometyyli-bentsoyylioksi)-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-pyrrolidinometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 218 - 220°C.

Esimerkki 62

1-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 208 - 209°C.

Esimerkki 63

1-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 197 - 199°C.

Esimerkki 64

1-/4-amino-3-bromi-5-(4-metyyli-piperatsinometyyli)-bentsoyyliseksi/-
2-/1-(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-
etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-
2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-
bromi-5-(4-metyyli-piperatsinometyyli)-bentsoyyliseksi/-2-hydroksi-
etaanista.

Dihydrokloridin sulamispiste: 175 - 177°C.

Esimerkki 65

1-(4-amino-3-bromi-5-isopropyliaminometyyli-bentsoyyliseksi)-2-/1-
(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-
etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-
2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-
bromi-5-isopropyliaminometyyli-bentsoyyliseksi)-2-hydroksi-etaanista.
Dihydrokloridin sulamispiste: 115°C (hajoaa).

Esimerkki 66

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-n-propyliaminometyyli)-bentsoyyl-
oksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-
asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-
2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-4-
3-bromi-5-(N-metyyli-n-propyliaminometyyli)-bentsoyyliseksi/-2-hyd-
roksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 193 - 195°C (hajoaa).

Esimerkki 67

1-(4-amino-3-bromi-5-sykloheksyliaminometyyli-bentsoyyliseksi)-2-/1-
(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-
etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-sykloheksyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 177 - 179°C.

Esimerkki 68

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-bentsyyli-metyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-bentsyyli-metyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista. Hydrokloridi on öljy.

$C_{37}H_{34}BrN_3O_6 \times HCl$ (733,1)

Laskettu: C 60,62 H 4,81 Br 10,90 Cl 4,84 N 5,73

Saatu: 60,35 5,04 11,24 4,97 5,51

Esimerkki 69

1-/4-amino-3-bromi-5-(2-dietyyliaminoetyyli-aminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(2-dietyyliaminoetyyli-aminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista.

Dihydrokloridin sulamispiste: 131 - 135°C.

Esimerkki 70

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-syklopentyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta ja 5-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-syklopentyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-pentyylikloridista.

Hydrokloridi on öljy.

$C_{34}H_{40}BrCl_2N_3O_4 \times HCl$ (742,0)

Laskettu: C 55,04 H 5,57 Br 10,77 Cl 14,33 N 5,66

Saatu: 55,08 5,62 10,57 14,07 5,47

Esimerkki 71

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliaasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta ja 5-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-pentyylikloridista. Hydrokloridin sulamispiste: 107 - 110°C.

Esimerkki 72

1-(4-amino-3-bromi-5-tert.butyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliaasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylieykkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-tert.butyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista. Hydrokloridin sulamispiste: 77 - 98°C.

Esimerkki 73

1-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-iminometyyli-bentsoyylioksi)-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliaasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylieykkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-iminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista. Hydrokloridin sulamispiste: 66 - 80°C.

Esimerkki 74

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliaasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylieykkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-

sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista.
Hydrokloridin sulamispiste: 68 - 79°C.

Esimerkki 75

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-syklopentyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-syklopentyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista.
Hydrokloridin sulamispiste: 63 - 71°C.

Esimerkki 76

1-/4-amino-3-bromi-5-(4-metyyli-piperatsinometyyli)-bentsoyylioksi/-
2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(4-metyyli-piperatsinometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista.
Dihydrokloridin sulamispiste: 182 - 184°C.

Esimerkki 77

1-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli)-bentsoyylioksi/-2-(3-bentsoyy-
li- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksietaanista.
Hydrokloridin sulamispiste: 75°C (hajoaa).

Esimerkki 78

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-n-

propyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista.
Hydrokloridin sulamispiste: 50°C:sta lähtien (hajoaa).

Esimerkki 79

1-(4-amino-3-bromi-5-isopropyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-isopropyyliamino-metyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista.
Hydrokloridin sulamispiste: 70°C:sta lähtien (hajoaa).

Esimerkki 80

1-(4-amino-3-bromi-5-sykloheksyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-(3-bentsoyyli- α -metvli-fenyvliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-sykloheksyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista.
Hydrokloridin sulamispiste: 80°C:sta lähtien (hajoaa).

Esimerkki 81

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-bentsyyli-metyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metvli-fenyvli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-bentsyyli-metyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista.
Hydrokloridin sulamispiste: 75°C:sta lähtien (hajoaa).

Esimerkki 82

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-

n-propyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista. Hydrokloridi on öljy.

$C_{35}H_{41}BrN_2O_5 \times HCl$ (686,1)

Laskettu: C 61,27 H 6,17 Br 11,65 Cl 5,17 N 4,08

Saatu: 61,15 6,36 11,60 5,13 4,07

Esimerkki 83

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-metyyliaminometyyli)-bentsovylioksi/-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-metyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 50 - 65°C (hajoaa).

Esimerkki 84

1-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliamino-metyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 65 - 75°C (hajoaa).

Esimerkki 85

1-(4-amino-3-bromi-5-pyrrolidinometyyli-bentsoyylioksi)-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-pyrrolidinometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 75°C:sta lähtien (sintrautuu).

Esimerkki 86

1-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-piperidino-metyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 120°C:sta lähtien (hajoaa).

Esimerkki 87

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etyyli/-amiini

Valmistetaan esimerkin 5 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappokloridista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-amiinihydrokloridista. Hydrokloridi on amorfinen jauhe.

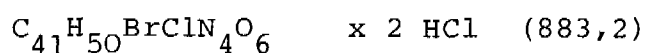
IR-spektri (metyleenikloridi):	Amidi-CO	1680 cm ⁻¹
	Esteri-CO	1720 ja 1740 cm ⁻¹
	O-metyyli	2870 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2950 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm (olka), 285 nm.

Esimerkki 88

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etyyli/-etyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-etyyliamiinista. Dihydrokloridi on amorfinen jauhe.



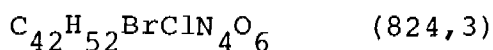
Laskettu: C 55,76 H 5,93 Br 9,05 Cl 12,04 N 6,34

Saatu: 55,48 6,12 8,97 11,91 6,24

Esimerkki 89

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etyyli/-n-propyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 5 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappokloridista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-n-propyyliamiinista dikloorimetaanissa. Öljy.



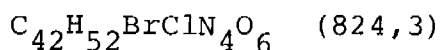
Laskettu: C 61,20 H 6,36 Br 9,70 Cl 4,30 N 6,80

Saatu: 60,80 6,61 9,94 4,30 6,77

Esimerkki 90

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etyyli/-isopropyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 5 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappokloridista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-isopropyyliamiinista dikloorimetaanissa O°C:ssa. Öljy.



Laskettu: C 61,20 H 6,36 Br 9,70 Cl 4,30 N 6,80

Saatu: 61,00 x 6,51 10,00 4,43 6,61

Esimerkki 91

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etyyli/-tert.butyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 10 mukaisesti 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-

sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoylikloridi-hydrokloridista ja N-/2-/1-(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-tert.butyyliamiinista. Vaahto.

$C_{43}H_{54}BrClN_4O_6$ (838,3)

Laskettu: C 61,61 H 6,49 Br 9,53 Cl 4,23 N 6,68

Saatu: 61,50 6,63 9,69 4,30 6,53

Esimerkki 92

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyl-
lioksi/-etyyli/-N-/2-/1-(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-2-metyyli-1H-
indoli-3-asetoksi/-etyyli/-bentsyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahaposta ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyl-lioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-bentsyyliamiinista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Amidi-CO 1675 cm^{-1}
Esteri-CO 1700 ja 1730 cm^{-1}
O-metyyli 2840 cm^{-1}
N-alkyyli 2940 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 235 nm (olka), 290 nm.

Esimerkki 93

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyl-
lioksi/-etyyli/-N-/2-/1-(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-2-metyyli-1H-
indoli-3-asetoksi/-etyyli/-aniliini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahaposta ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyli-aminometyyli)-bentsoyyl-lioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-aniliinista. Öljy.

$C_{45}H_{50}BrClN_4O_6$ (858,3)

Laskettu: C 62,97 H 5,87 Br 9,31 Cl 4,13 N 6,53

Saatu: 62,90 6,11 9,54 4,23 6,59

Esimerkki 94

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-etyyli/-metyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-kloorietyyli)-metyyliamiinista. Öljy.

$C_{35}H_{43}BrCl_2N_4O_4$ (734,6)

Laskettu: C 57,23 H 5,90 Br 10,87 Cl 9,65 N 7,62

Saatu: 57,60 6,12 10,58 9,39 7,54

Esimerkki 95

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-etyyli/-etyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-kloorietyyli)-etyyliamiinista. Dihydrokloridi on amorfinen jauhe.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1720 ja 1740 cm^{-1}
N-alkyyli 2940 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 285 nm.

Esimerkki 96

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-etyyli/-n-propyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-kloorietyyli)-n-propyyliamiinista. Öljy.

$C_{37}H_{47}BrCl_2N_4O_4$ (762,6)

Laskettu: C 58,27 H 6,21 Br 10,48 Cl 9,30 N 7,35

Saatu: 58,50 6,45 10,58 9,31 7,06

Esimerkki 97

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/etyyli/-siopropyliamiini

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-kloorietyyli)-isopropyliamiinista. Öljy.

$C_{37}H_{47}BrCl_2N_4O_4$ (762,6)

Laskettu: C 58,27 H 6,21 Br 10,48 Cl 9,30 N 7,35

Saatu: 58,40 6,37 10,22 9,05 7,08

Esimerkki 98

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-etyyli/-n-butyliamiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahaposta ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bensoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-n-butyliamiinista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 cm^{-1}
N-alkyyli 2935 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm (olak), 284 nm.

Esimerkki 99

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-etyyli/-bentsyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahaposta ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-bentsyyliamiinista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 cm^{-1}
N-alkyyli 2935 cm^{-1}

Esimerkki 103

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etyyli/-etyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-etyyliamiinista. Dihydrokloridi on amorfinen jauhe.

$C_{38}H_{48}BrN_3O_5 \times 2 HCl$ (779,6)

Laskettu: C 58,54 H 6,46 Br 10,25 Cl 9,10 N 5,39

Saatu: 58,20 6,54 10,18 9,06 5,38

Esimerkki 104

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etyyli/-n-propyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli))-n-propyyliamiinista kiehuvaassa tetrahydrofuraanissa. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Ketoni-CO 1650 cm^{-1}
 Esteri-CO 1690 ja 1720 cm^{-1}
 N-alkyyli 2850 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 253 nm, 290 nm.

Esimerkki 105

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etyyli/-isopropyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli/-isopropyyliamiinista. Öljy.

$C_{39}H_{50}BrN_3O_5$ (720,8)

Laskettu: C 64,99 H 6,99 Br 11,09 N 5,83

Saatu: 64,80 7,28 10,95 5,59

Esimerkki 106

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etyyli/-n-butyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahaposta ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-n-butyylamiinista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):	Ketoni+CO	1660 cm^{-1}
	Esteri-CO	1705 ja 1730 cm^{-1}
	N-alkyyli	2935 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 255 nm, 290 nm.

Esimerkki 107

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etyyli/-tert.butyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahaposta ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-tert.butyylamiinista. Dihydrokloridi on amorfinen jauhe.

IR-spektri (metyleeniklorid):	Ketoni-CO	1640 cm^{-1}
	Esteri-CO	1710 ja 1730 cm^{-1}
	N-alkyyli	2940 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 256 nm, 280 nm.

Esimerkki 108

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etyyli/-bentsyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-

etikkahaposta ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-bentsyyliamiinista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Ketoni-CO 1660 cm^{-1}
 Esteri-CO 1710 ja 1730 cm^{-1}
 N-alkyyli 2940 cm^{-1}

UV-spektri (etanöli): λ max 252 nm, 288 nm.

Esimerkki 109

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etyyli/-aniliini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahaposta ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-aniliinista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Ketoni-CO 1660 cm^{-1}
 Esteri-CO 1710 ja 1735 cm^{-1}
 N-alkyyli 2940 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 250 nm, 290 nm.

Esimerkki 110

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-etyyli/-amiini

Valmistetaan esimerkin 5 mukaisesti (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-kloridista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-amiini-hydrokloridista. Dihydrokloridi on amorfinen jauhe.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1720 ja 1740 cm^{-1}
 O-metyyli 2850 cm^{-1}
 N-alkyyli 2930 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 221 nm, 282 nm.

Esimerkki 111

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-etyyli/-metyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-metyyliamiinista. Dihydrokloridi on amorfinen jauhe.

IR-spektri (kaliumbromidi): Esteri-CO 1720 ja 1730 cm^{-1}
 O-metyyli 2860 cm^{-1}
 N-alkyyli 2940 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): max 233 nm, 285 nm.

Esimerkki 112

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-etyyli/-etyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-etyyliamiinista. Dihydrokloridi on amorfinen jauhe.

$\text{C}_{36}\text{H}_{48}\text{BrN}_3\text{O}_5 \times 2 \text{HCl}$ (755,7)

Laskettu: C 57,22 H 6,67 Br 10,58 Cl 9,38 N 5,56

Saatu: 57,00 6,78 10,62 9,47 5,37

Esimerkki 113

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-etyyli/-n-propyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-n-propyyliamiinista kiehuvaassa tetrahydrofuraanissa. Öljy.

$C_{37}H_{50}BrN_3O_5$ (696,7)

Laskettu: C 63,78 H 7,23 Br 11,47 N 6,03

Saatu: 63,90 7,51 11,54 5,97

Esimerkki 114

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-etyyli/-isopropyliamiini

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-isopropyliamiinista. Öljy.

$C_{37}H_{50}BrN_3O_5$ (696,7)

Laskettu: C 63,78 H 7,23 Br 11,47 N 6,03

Saatu: 63,80 7,40 11,40 6,00

Esimerkki 115

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/ α -metyyli-4-(2-metyylipropyyli)-fenyliasetoksi/-etyyli/-amiini

Valmistetaan esimerkin 5 mukaisesti α -metyyli-4-(2-metyylipropyyli)-fenyylietikkahappokloridista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-amiini-hydrokloridista. Dihydrokloridi on amorfinen jauhe.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1720 ja 1730 cm^{-1}
N-alkyyli 2950 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 218 nm, 284 nm.

Esimerkki 116

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/ α -metyyli-4-(2-metyylipropyyli)-fenyliasetoksi/-etyyli/-metyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti α -metyyli-4-(2-metyylipropyyli)-fenyylietikkahappo-imidatsolidista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-

etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-metyyliamiinista. Öljy.

$C_{34}H_{50}BrN_3O_4$ (644,7)

Laskettu: C 63,34 H 7,82 Br 12,40 N 6,52

Saatu: 63,10 7,84 12,10 6,59

Esimerkki 117

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/α-metyyli-4-(2-metyylipropyyli)-fenyyliasetoksi/-etyyli/-n-propyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti α-metyyli-4-(2-metyylipropyyli)-fenyylietikkahappo-imidatsolidista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-n-propyyliamiinista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1700 ja 1725 cm^{-1}
N-alkyyli 2820 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm (olka), 294 nm.

Esimerkki 118

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/α-metyyli-4-(2-metyylipropyyli)-fenyyliasetoksi/-etyyli/-isopropyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti α-metyyli-4-(2-metyylipropyyli)-fenyylietikkahappo-imidatsolidista ja N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-isopropyyliamiinista kiehuvaassa tetrahydrofuraanissa. Öljy.

$C_{36}H_{54}BrN_3O_4$ (672,8)

Laskettu: C 64,27 H 8,09 Br 11,88 N 6,25

Saatu: 64,50 8,28 12,05 6,32

Esimerkki 119

N-/2-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-etyyli/-N-/2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etyyli/-metyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 5 mukaisesti 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-

2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappokloridista ja N-/2-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-metyyliamiinista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Amidi-CO 1690 cm^{-1}
 Esteri-CO $1705\text{ ja }1735\text{ cm}^{-1}$

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm (olka), 290 nm.

Esimerkki 120

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-dietyylioksidi

Valmistetaan esimerkin 10 mukaisesti 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridi-hydrokloridista ja 2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-2'-hydroksi-dietyylioksidista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Amidi-CO 1690 cm^{-1}
 Esteri-CO $1710\text{ ja }1735\text{ cm}^{-1}$
 O-metyyli 1850 cm^{-1}
 N-alkyyli 2920 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm (olka), 295 nm.

Esimerkki 121

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-dietyylioksidi

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-hydroksi-dietyylioksidista ja (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista. Öljy.

$\text{C}_{34}\text{H}_{43}\text{BrN}_2\text{O}_6$ (655,6)

Laske-tu: C 62,28 H 6,61 Br 12,19 N 4,27

Saatu: 62,20 6,78 12,10 4,09

Esimerkki 122

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2'-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-dietyyli-
oksidi

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-kloori-dietyylioksidista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Hydrokloridi on amorfinen jauhe.

IR-s-ektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 ja 1720 cm^{-1}
N-alkyyli 2950 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 283 nm.

Esimerkki 123

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2'-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-dietyylioksidi

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-hydroksi-dietyylioksidista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-imidatsolidista. Öljy.

$\text{C}_{36}\text{H}_{43}\text{BrN}_2\text{O}_6$ (679,7)

Laskettu: C 63,62 H 6,38 Br 11,76 N 4,12

Saatu: 63,40 6,58 11,35 4,03

Esimerkki 124

2-/4-amino-3-bromi-5-(n-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2'-/ α -metyyli-4-(2-metyylipropyli)-fenyyliasetoksi/-dietyyli-
oksidi

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-hydroksi-dietyylioksidista ja α -metyyli-4-(2-metyylipropyli)-fenyylietikkahappo-imidatsolidista.

$\text{C}_{33}\text{H}_{47}\text{BrN}_2\text{O}_5$ (631,7)

Laskettu: C 62,75 H 7,50 Br 12,65 N 4,44

Saatu: 62,60 7,58 12,90 4,54

Esimerkki 125

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-dietyylisulfidi

Valmistetaan esimerkin 5 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-hydroksi-dietyylisulfidista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-kloridista. Hydrokloridi on amorfinen jauhe.

$C_{39}H_{45}BrClN_3O_2S \quad x HCl \quad (835,7)$

Laskettu: C 56,05 H 5,54 Br 9,56 Cl 8,49 N 5,02

Saatu: 56,00 5,80 9,74 8,69 4,84

Esimerkki 126

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-dietyylisulfidi

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(n-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-hydroksi-dietyylisulfidista ja (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1705 ja 1730 cm^{-1}
 O-metyyli 2860 cm^{-1}
 N-alkyyli 2930 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 233 nm, 298 nm.

Esimerkki 127

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-2'-(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-dietyylisulfidi

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-kloori-dietyylisulfidista ja 2'-(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Öljy.

$C_{34}H_{40}BrCl_2N_3O_4S \quad (737,6)$

Esimerkki 128

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2'-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-dietyylisulfidi

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-hydroksi-dietyylisulfidista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-imidatsolidista. Öljy.

$C_{36}H_{43}BrN_2O_5S$ (695,7)

Laskettu: C 62,15 H 6,23 Br 11,49 N 4,02 S 4,60

Saatu: 62,20 6,50 11,25 3,87 4,72

Esimerkki 129

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2'-/2-fluori- α -metyyli-1-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-dietyyli-
sulfidi

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-hydroksi-dietyylisulfidista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 ja 1735 cm^{-1}
N-alkyyli 2935 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 232 nm, 288 nm.

Esimerkki 130

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2'-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-dietyylioksid

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-hydroksi-dietyylioksidista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahaposta. Öljy.

$C_{35}H_{42}BrFN_2O_5$ (669,7)

Laskettu: C 62,78 H 6,32 Br 11,93 N 4,18

Saatu: 63,04 6,48 11,90 4,07

Esimerkki 131

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-dietyyli-sulfoksidi

Valmistetaan esimerkin 14 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-dietyylisulfidista vetyperoksidin avulla. Vaahto.

IR-spektri (metyleenikloridi):	Sulfoksidi	1040 cm ⁻¹	
	Esteri-CO	1710 cm ⁻¹	(leveä)
	N-alkyyli	2930 cm ⁻¹	

UV-spektri (etanoli): λ max 300 nm.

Esimerkki 132

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-dietyyli-sulfoni

Valmistetaan esimerkin 15 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2'-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-dietyylisulfidista käyttämällä vetyperoksidia. Vaahto.

$C_{34}H_{40}BrCl_2N_3O_6S$ (769,6)

Laskettu: C 53,06 H 5,24 Br 10,38 Cl 9,21 N 5,46

Saatu: 53,01 5,35 10,56 9,33 5,34

Esimerkki 133

2-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2'-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-dietyylioksi

Valmistetaan esimerkin 7 mukaisesti 2'-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-2-hydroksi-dietyylioksidista ja 4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylikloridi-hydrokloridista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):	Esteri-CO	1710 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2960 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm (olka), 282 nm.

Esimerkki 134

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N'-/2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etyyli/-piperatsiini

Valmistetaan esimerkin 3 mukaisesti N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N'-(2-hydroksietyyli)-piperatsiinista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista. Öljy.

$C_{43}H_{53}BrClN_5O_6$ (851,3)

Laskettu: C 60,67 H 6,28 Br 9,39 Cl 4,16 N 8,23

Saatu: 60,50 6,65 9,22 4,09 8,10

Esimerkki 135

N-/3-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-propyyli/-N'-/2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etyyli/-piperatsiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti N-/3-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-propyyli/-N'-(2-hydroksietyyli)-piperatsiinista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahaposta käyttämällä disykloheksyylikarbodi-imidiä. Trivetymaleinaatin sulamispiste: 120°C.

Esimerkki 136

N-/3-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-propyyli/-N'-/2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliaasetoksi/-etyyli/-piperatsiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti N-/3-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-propyyli/-N'-(2-hydroksietyyli)-piperatsiinista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliaetikkahaposta disykloheksyylikarbodi-imidin avulla.

Trivetymaleinaatin sulamispiste: 122°C:sta lähtien (hajoaa).

Esimerkki 137

N-/3-/4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi/-propyyli/-N'-/2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi, etyyli/-piperatsiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti N-/3-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-propyyli/-N'-(2-hydroksietyyli)-piperatsiinista j 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahaposta di sykloheksyylikarbodi-imidin avulla.

Trivetymaleinaatin sulamispiste: 132°C:sta lähtien (hajooa).

Esimerkki 138

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-1-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 7 mukaisesti 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridista ja 1-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-2-hydroksi-n-propaanista, mutta pyridiinin asemesta käytetään 4-dimetyyliamino-pyridiiniä ja tolueenin asemesta metyleenikloridia. Öljy.

I R-spektri (metyleenikloridi: NH_2 3420 - 3450 cm^{-1}
 N-alkyyli 2925 cm^{-1}
 OCH_3 2850 cm^{-1}
 Esteri-CO 1730 ja 1720 cm^{-1}
 Amidi-CO 1680 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 290 nm.

Esimerkki 139

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-n-propaanista ja (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi)	NH ₂	3430 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2920 cm ⁻¹
	OCH ₃	2850 cm ⁻¹
	Esteri-CO	1730 ja 1710 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 234 nm, 295 nm.

Esimerkki 140

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-3-hydroksi-n-butaanista ja (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):	NH ₂	3430 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2920 cm ⁻¹
	OCH ₃	2850 cm ⁻¹
	Esteri-CO	1730 ja 1710 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 234 nm, 295 nm.

Esimerkki 141

3-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-propyylikloridi

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 3-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliamino-metyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-n-propyylikloridista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):	NH ₂	3440 cm ⁻¹
	Esteri-CO	1730 ja 1705 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 290 - 300 nm.

Esimerkki 142

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-3-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-propyylikloridi

Valmistetaan esimerkin 11 mukaisesti 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-

sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoehappo-imidatsolidista ja 3-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-2-hydroksin-propyylikloridista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 ja 1740 cm^{-1}
Amidi-CO 1670 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 295 nm.

Esimerkki 143

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli/-3-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetyyli/-(+)-viinihappodietyyliesteri

Valmistetaan esimerkin 10 mukaisesti 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridi-hydrokloridista ja 2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-astyyli/-3-hydroksi-(+)-viinihappodietyyliesteristä tetrahydrofuraani/pyridiinissä. Vaahto.

IR-spektri (metyleenikloridi): Amidi-CO 1680 cm^{-1}
Esteri-CO 1720 ja 1750 - 1760 cm^{-1}
O-metyyli 2850 cm^{-1}
Na-lkyyli 2930 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 237 nm (olka), 305 nm.

Esimerkki 144

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-oksi/-1-asetoksi-3-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 10 mukaisesti 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridista ja 3-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-1-asetoksi-2-hydroksin-propaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 ja 1745 cm^{-1}
Amidi-CO 1675 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 295 nm.

Esimerkki 145

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-1-oktadekanoyylioksi-3-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 10 mukaisesti 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridista ja 3-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-1-oktadekanoyylioksi-2-hydroksi-n-propaanista. Öljy.

$C_{56}H_{77}BrClN_3O_8$ (1035,6)

Laskettu: C 64,95 H 7,49 Br 7,72 Cl 3,42 N 4,06

Saatu: 64,70 7,43 7,70 3,40 3,70

Esimerkki 146

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-1-oktadekanoyylioksi-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliini-asetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 11 mukaisesti 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoehappo-imidatsolidista ja 3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-1-oktadekanoyylioksi-2-hydroksi-n-propaanista. Öljy.

$C_{51}H_{75}BrN_2O_7$ (908,1)

Laskettu: C 67,46 H 8,32 Br 8,80 N 3,08

Saatu: 67,80 8,36 8,63 3,16

Esimerkki 147

1,2-bis-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 11 mukaisesti 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoehappo-imidatsolidista ja 3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-1,2-dihydroksi-n-propaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi). Esteri-CO 1710 ja 1740 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 243 nm, 302 nm.

Esimerkki 148

3-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-
asetoksi/-1-hydroksi-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 6 mukaisesti 3-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-1,2-epoksi-n-propaanista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikka-haposta. Kiinteä amorfinen aine.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 ja 1735 cm^{-1}
Amidi-CO 1675 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 297 nm.

Esimerkki 149

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-hydroksi-3-/2-/(2,6-dikloorifenyli)amino/-fenyyliasetoksi/-
n-propaani

Valmistetaan esimerkin 2 mukaisesti 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoheppo-imidatsolidista ja 1-/2-/(2,6-dikloorifenyli)amino/-fenyyli-asetoksi/-2,3-dihydroksi-n-propaanista. Hydrokloridin sulamispiste: 87 - 96°C.

Esimerkki 150

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-pentanoyylioksi-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniase-
toksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 12 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-propaanista ja valeriaana-happokloridista. Hydrokloridi on öljy.

$\text{C}_{38}\text{H}_{49}\text{BrN}_2\text{O}_7 \times \text{HCl} \quad (762,2)$

Laskettu: C 59,88 H 6,61 Br 10,48 Cl 4,65 N 3,68

Saatu: 59,60 6,74 10,78 4,78 3,97

Esimerkki 151

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-tetradekanoyylioksi-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliini-asetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 12 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-propaanista ja myrsitiinihappokloridista. Hydrokloridi on öljy.

$C_{47}H_{65}BrN_2O_7 \times HCl$ (886,4)

Laskettu: C 63,69 H 7,51 Br 9,02 Cl 4,00 N 3,16

Saatu: 63,40 7,78 9,13 4,04 3,05

Esimerkki 152

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-oktadekanoyylioksi-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliini-asetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 12 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-propaanista ja steariinihappokloridista. Hydrokloridi on öljy.

$C_{51}H_{75}BrN_2O_7 \times HCl$ (944,6)

Laskettu: C 64,85 H 8,11 Br 8,46 Cl 3,75 N 2,97

Saatu: 64,58 8,04 8,45 3,74 3,09

Esimerkki 153

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-dekanoyylioksi-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 12 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-propaanista ja kapriinihappokloridista. Hydrokloridi on öljy.

$C_{43}H_{59}BrN_2O_7 \times HCl$ (832,3)

Laskettu: C 62,05 H 7,27 Br 9,60 Cl 4,26 N 3,37

Saatu: 61,62 7,25 10,15 4,46 3,74

Valmistetaan esimerkin 13 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-3-hydroksi-n-propaanista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappoimidatsolidista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1730 cm^{-1}
Amidi-CO 1650 ja 1675 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 275 nm, olka $\sim$ 325 nm

Esimerkki 158

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-4-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 13 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-4-hydroksi-n-butaanista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappoimidatsolidista. Öljy. Hydrokloridi on kiinteä, amorfinen aine.

$\text{C}_{39}\text{H}_{46}\text{BrClN}_4\text{O}_5 \times \text{HCl}$ (802,6)

Laskettu: C 58,36 H 5,90 Br 9,96 Cl 8,83 N 6,98

Saatu: 58,10 6,02 9,92 8,81 6,84

Esimerkki 159

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-5-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 13 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-5-hydroksi-n-pentaanista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappoimidatsolidista. Öljy.

Hydrokloridina on kiinteä, amorfinen aine.

$\text{C}_{40}\text{H}_{48}\text{BrClN}_4\text{O}_5 \times \text{HCl}$ (816,7)

Laskettu: C 58,83 H 6,05 Br 9,79 Cl 8,68 N 6,86

Saatu: 58,60 6,18 9,62 8,53 6,85

Esimerkki 160

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-6-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-heksaani

Valmistetaan esimerkin 13 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-6-hydroksi-n-heksaanista ja 1-) 4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidisa. Öljy.

Hydrokloridi on kiinteä, amorfinen aine.

$C_{41}H_{50}BrClN_4O_5 \times HCl$ (830,7)

Laskettu: C 59,28 H 6,19 Br 9,62 Cl 8,53 N 6,74

Saatu: 59,00 6,32 9,68 8,58 6,50

Esimerkki 161

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-2-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 13 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-2-hydroksi-etaanista ja (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista. Vety-maleinaatti on amorfinen jauhe.

$C_{32}N_4O_4BrN_3O_4 \times C_4H_4O_4$ (726,7)

Laskettu: C 59,30 H 6,16 Br 10,86 N 5,64

Saatu: 59,50 6,10 11,00 5,78

Esimerkki 162

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 13 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-3-hydroksi-n-propaanista ja (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista.

Hydrokloridin sulamispiste: 70 - 90°C.

Esimerkki 163

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-5-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 13 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-5-hydroksi-n-pentaanista ja (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1725 cm^{-1}

Amidi-CO 1650 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 235 nm, 280 nm.

Esimerkki 164

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-6-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-heksaani

Valmistetaan esimerkin 13 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-6-hydroksi-n-heksaanista ja (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista. Öljy.

Hydrokloridi on kiinteä, amorfinen aine:

$\text{C}_{36}\text{H}_{48}\text{BrN}_3\text{O}_4 \times \text{HCl} \quad (703,2)$

Laskettu: C 61,49 H 7,02 Br 11,36 Cl 5,04 N 5,98

Saatu: 61,70 7,10 11,22 4,98 5,59

Esimerkki 165

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyl-
oksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-aset-
amido/-etaani

Valmistetaan esimerkin 5 mukaisesti 1-/1-(4-klooribentsoyyl)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetamido/-2-hydroksi-etaanista ja 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyl-
kloridista.

Hydrokloridin sulamispiste: 140°C :sta lähtien (hajooa).

UV-spektri (etanoli): max 230 nm, 290 nm.

Esimerkki 169

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-6-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-
asetamido/-n-heksaani

Valmistetaan esimerkin 10 mukaisesti 1-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetamido/-6-hydroksi-n-heksaanista ja 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 cm⁻¹
Amidi-CO 1665 ja 1680 cm⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 232 nm, 285 nm.

Esimerkki 170

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-fenyyliasetamido/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 10 mukaisesti 1-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-fenyyliasetamido/-3-hydroksi-n-propaanista ja 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 cm⁻¹
Amidi-CO 1640 cm⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 234 nm, 285 nm.

Esimerkki 171

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-5-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-fenyyliasetamido/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 10 mukaisesti 1-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-fenyyliasetamido/-5-hydroksi-n-pentaanista ja 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1700 cm⁻¹
Amidi-CO 1670 cm⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 235 nm, 295 nm.

Esimerkki 175

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamidi/-
2-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetamido/-etaani

Valmistetaan esimerkin 7 mukaisesti 1-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetamido/-2-amino-etaanista ja 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridista trietyyliaminin läsnäollessa.

Sulamispiste: 136 - 137°C.

Esimerkki 176

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-
3-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetamido/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 7 mukaisesti 1-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetamido/-3-amino-n-propaanista ja 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridista trietyyliaminin läsnäollessa.

Hydrokloridin sulamispiste: 126°C:sta lähtien (hajoaa).

Esimerkki 177

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-
4-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetamido/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 7 mukaisesti 1-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetamido/-4-amino-n-butaanista ja 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridista trietyyliamiinin läsnäollessa.

Sulamispiste: 130 - 131,5°C.

Esimerkki 178

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-
5-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetamido/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 7 mukaisesti 1-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetamido-5-amino-n-pentaanista ja 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoylikloridista trietyyliamiinin läsnäollessa.

Sulamispiste: 72°C:sta lähtien (sintrautuu).

Esimerkki 179

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-6-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetamido/-h-heksaani

Valmistetaan esimerkin 7 mukaisesti 1-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetamido/-6-amino-n-heksaanista ja 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoylikloridista trietyyliamiinin läsnäollessa.

Sulamispiste: 149 - 150°C.

Esimerkki 180

N-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli/-O-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetyyli/-L-seriini-metyyliesteri

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti N-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli/-L-seriini-metyyliesteristä ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappoimidatsolidista. Vaahto.

IR-spektri (metyleenikloridi):	NH ₂	3435 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2920 cm ⁻¹
	OCH ₃	2850 cm ⁻¹
	Esteri-CO	1745 cm ⁻¹
	Amidi-CO	1675 ja 1655 cm ⁻¹

UV-spektri (metanoli): λ 230 nm, 290 nm.

Esimerkki 181

O-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli/-N-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetyyli/-L-seriini-metyyliesteri

Valmistetaan esimerkin 7 mukaisesti N-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetyyli/-L-seriini-metyyliesteristä ja 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-kloridista, mutta trietyyliamiinin ja 4-dimetyyliamino-pyridiinin asemesta käytetään pyridiiniä. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3410 cm ⁻¹
N-alkyyli	2910 cm ⁻¹
OCH ₃	2840 cm ⁻¹
Esteri-CO	1750 ja 1700 cm ⁻¹
Amidi-CO	1675 cm ⁻¹

UV-spektri (metanoli): λ max 230 nm, 295 nm.

Esimerkki 182

N-) 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli/-O-/(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetyyli/-L-seriini-metyyli-esteri

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti N-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli/-L-seriini-metyyliesteristä ja (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-imidatsolidista. Vaahto.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3440 cm ⁻¹
N-alkyyli	2920 cm ⁻¹
OCH ₃	2850 cm ⁻¹
Esteri-CO	1730 cm ⁻¹
Amidi-CO	1660 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 234 nm ja 295 nm.

Esimerkki 183

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-bentsyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-bentsyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3450 cm ⁻¹
Esteri-CO	1705 cm ⁻¹ , 1725 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 232 nm ja 292 nm.

Esimerkki 184

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentosyylioksi/-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentosyylioksi/-5-hydroksi-n-pentaanista. Hydrokloridin sulamispiste: 107 - 111°C.

Esimerkki 185

1-(4-amino-3-bromi-5-sykloheksyyliaminometyyli-bentosyylioksi)-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-sykloheksyyliaminometyyli-bentosyylioksi)-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3440 cm^{-1}
Esteri-CO 1700 cm^{-1} , 1730 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 232 nm ja 290 nm.

Esimerkki 186

1-(4-amino-3-bromi-5-isopropyyliaminometyyli-bentosyylioksi)-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-isopropyyliaminometyyli-bentosyylioksi)-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3440 cm^{-1}
Esteri-CO 1700 cm^{-1} , 1725 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 234 ja 292 nm.

Esimerkki 187

1-(4-amino-3-bromi-5-tert.butyyliaminometyyli-bentosyylioksi)-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-tert.-butyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3450 cm^{-1}
 Esteri-CO 1710 cm^{-1} , 1730 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 235 nm ja 295 nm.

Esimerkki 188

1-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-5-hydroksi-n-pentaanista.

Hydrokloridin sulamispiste: 105°C (sintrautuu 75°C:sta lähtien).

Esimerkki 189

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-piperatsinometyyli)-bentsoyylioksi/-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-piperatsinometyyli)-bentsoyylioksi/-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3440 cm^{-1}
 Esteri-CO 1700 cm^{-1} , 1730 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 232 nm ja 286 nm.

Esimerkki 190

1-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metylaanikloridi): NH_2 3440 cm^{-1}
 Esteri-CO 1700 cm^{-1} , 1725 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 232 nm ja 290 nm.

Esimerkki 191

1-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-iminometyyli-bentsoyylioksi)-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-astoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-iminometyyli-bentsoyylioksi)-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3440 cm^{-1}
 Esteri-CO 1700 cm^{-1} , 1730 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 232 nm ja 290 nm.

Esimerkki 192

1-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3450 cm^{-1}
 Esteri-CO 1705 cm^{-1} , 1730 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 235 nm ja 288 nm.

Esimerkki 193

1-(4-amino-3-bromi-5-pyrrolidinometyyli-bentsoyylioksi)-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-(4-amino-3-bromi-5-pyrrolidinometyyli-bentsoyylioksi)-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3450 cm^{-1}
 Esteri-CO 1705 cm^{-1} , 1730 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 232 nm ja 290 nm.

Esimerkki 194

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-n-propyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-n-propyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3450 cm^{-1}
Esteri-CO 1700 cm^{-1} , 1725 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 233 nm ja 290 nm.

Esimerkki 195

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3450 cm^{-1}
Esteri-CO 1705 cm^{-1} , 1730 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm ja 285 nm.

Esimerkki 196

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-syklopentyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahappo-imidatsolidista ja 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-syklopentyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-hydroksi-n-pentaanista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3450 cm^{-1}
Esteri-CO 1700 cm^{-1} , 1730 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 232 nm ja 290 nm.

Esimerkki 197

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-n-pentaanista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3440 cm ⁻¹
N-alkyyli	2940 cm ⁻¹
Esteri-CO	1705 ja 1735 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 235 nm, 280 nm.

Esimerkki 198

1-(4-amino-3-bormi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3440 cm ⁻¹
N-alkyyli	2940 cm ⁻¹
Esteri-CO	1705 ja 1735 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 235 nm, 280 nm.

Esimerkki 199

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-3-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-3-hydroksi-n-propaanista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3440 cm ⁻¹
N-alkyyli	2930 cm ⁻¹
Esteri-CO	1700 ja 1730 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 235 nm, 280 nm.

Esimerkki 200

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksis)-4-hydroksi-n-butaanista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3440 cm ⁻¹
N-alkyyli	2940 cm ⁻¹
Esteri-CO	1700 ja 1730 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 235 nm, 280 nm.

Esimerkki 201

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-6-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-heksaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-6-hydroksi-n-heksaanista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3440 cm ⁻¹
N-alkyyli	2940 cm ⁻¹
Esteri-CO	1700 ja 1730 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 235 nm, 280 nm.

Esimerkki 202

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-3-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/3-hydroksi-n-propaanista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3440 cm ⁻¹
N-alkyyli	2930 cm ⁻¹
Esteri-CO	1705 ja 1730 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 235 nm, 280 nm.

Esimerkki 203

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-4-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-4-hydroksi-n-butaanista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahapoista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3460 cm ⁻¹
N-alkyyli	2930 cm ⁻¹
Esteri-CO	1705 ja 1730 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 235 nm, 280 nm.

Esimerkki 204

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-5-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-hydroksi-n-pentaanista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahapoista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3440 cm ⁻¹
N-alkyyli	2930 cm ⁻¹
Esteri-CO	1700 ja 1730 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 235 nm, 280 nm.

Esimerkki 205

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-6-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-heksaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-6-hydroksi-n-heksaanista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahapoista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3440 cm ⁻¹
N-alkyyli	2930 cm ⁻¹
Esteri-CO	1700 ja 1730 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 235 nm, 280 nm.

Esimerkki 206

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-
4-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 3 tai 4 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-4-hydroksi-n-butaanista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkaposta. Väritön vaahto.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3510 cm ⁻¹
Esteri-CO	1740 cm ⁻¹
Amidi-CO	1670 cm ⁻¹

Esimerkki 207

N-/2-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-etyyli/-
N'-/3-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-propyyli/-
piperatsiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti N-/3-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-propyyli/-N'-(2-hydroksietyyli)-piperatsiinista ja 4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsohaposta.

Tris-vetymaleinaatin sulamispiste: 163 - 166°C.

Esimerkki 208

N-/3-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-propyyli/-
N'-/2-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-etyyli/-
piperatsiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti N-/3-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-propyyli/-N'-(2-hydroksietyyli)-piperatsiinista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahapoista.

Tris-vetymaleinaatin sulamispiste: 144 - 147°C.

Esimerkki 209

N-/3-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-propyyli/-N'-/2-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-etyyli/-piperatsiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti N-/3-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-propyyli/-N'-(2-hydroksietyyli)-piperatsiinista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahaposta.

Tris-vetymaleinaatin sulamispiste: 132 - 135°C.

Esimerkki 210

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N'-/3-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-propyyli/-piperatsiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti N-/3-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-propyyli/-N'-(2-hydroksietyyli)-piperatsiinista ja 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoehaposta.

Tris-vetymaleinaatin sulamispiste: 150 - 153°C.

Esimerkki 211

N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-etyyli/-metyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-metyyliamiinista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahaposta. Öljy.

$C_{36}H_{45}BrFN_3O_4$ (682,7)

Laskettu: C 63,34 H 6,64 Br 11,71 N 6,16

Saatu: 63,45 6,59 11,85 6,05

Esimerkki 212

N-/2-) 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-/2-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-etyyli/-etyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti N-/2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-

sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-etyyliamiinista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahposta. Öljy.

$C_{37}H_{47}BrFN_3O_4$ (696,7)

Laskettu: C 63,79 H 6,80 Br 11,47 N 6,04

Saatu: 63,80 6,85 11,40 5,96

Esimerkki 213

N-/2-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-etyyli/-N-/2-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-etyyli/-metyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti N-/2-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-metyyliamiinista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahposta. Öljy

$C_{32}H_{39}BrFN_3O_4$ (628,6)

Laskettu: C 61,44 H 6,25 Br 12,71 N 6,69

Saatu: 61,36 6,54 12,55 6,71

Esimerkki 214

N-/2-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-etyyli/-N-/2-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-etyyli/-etyyliamiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti N-/2-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-etyyli/-N-(2-hydroksietyyli)-etyyliamiinista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahposta. Öljy.

$C_{33}H_{41}BrFN_3O_4$ (642,6)

Laskettu: C 61,68 H 6,43 Br 12,44 N 6,54

Saatu: 61,87 6,21 12,30 6,50

Esimerkki 215

2-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2'-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-dietyvlioksidi

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 2-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliami-

nometyyli-bentsoyylioksi)-2'-hydroksi-dietyylioksidista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahaposta. Öljy.

$C_{31}H_{36}BrFN_2O_5$ (615,6)

Laskettu: C 60,49 H 5,90 Br 12,98 N 4,55

Saatu: 60,72 5,78 12,75 4,69

Esimerkki 216

2-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2'-/2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-asetoksi/-dietyylisulfidi

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 2-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2'-hydroksi-dietyylisulfidista ja 2-fluori- α -metyyli-(1,1'-bifenyyli)-4-etikkahaposta. Öljy.

$C_{31}H_{36}BrFN_2O_4S$ (631,6)

Laskettu: C 58,95 H 5,75 Br 12,65 N 4,44 S 5,08

Saatu: 59,45 5,75 12,95 4,58 5,18

Esimerkki 217

1-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaanista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyli-etikkahappo-imidatsolidista.

Hydrokloridin sulamispiste: 117 - 122°C.

Esimerkki 218

1-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-4-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-amino-3-bromi-4-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaanista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-imidatsolidista.

Hydrokloridin sulamispiste: 123 - 125°C.

Esimerkki 219

1-(4-amino-3-bromi-5-pyrrolidinometyyli-bentsoyylioksi)-4-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-amino-3-bromi-5-pyrrolidinometyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaanista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-imidatsolidista. Amorfinen hydrokloridi.

$C_{32}H_{35}BrN_2O_5 \cdot xHCl$ (644,02)

Laskettu: C 59,68 H 5,63 Br 12,41 Cl 5,51 N 4,35

Saatu: 59,63 5,61 12,18 5,40 4,34

Esimerkki 220

1-(4-amino-3-bromi-5-sykloheksyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-amino-3-bromi-5-sykloheksyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaanista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-imidatsolidista. Amorfinen hydrokloridi.

$C_{34}H_{39}BrN_2O_5 \cdot xHCl$ (672,1)

Laskettu: C 60,76 H 6,00 Br 11,89 Cl 5,27 N 4,17

Saatu: 60,52 6,02 12,05 5,35 4,34

Esimerkki 221

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-piperatsinometyyli)-bentsoyylioksi/-4-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-piperatsinometyyli)-bentsoyylioksi/-4-hydroksi-n-butaanista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-imidatsolidista.

Hydrokloridin sulamispiste: 183 - 186°C.

Esimerkki 222

1-(4-amino-3-bromi-5-isopropyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-amino-3-bromi-5-isopropyyli-aminometyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaanista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-imidatsolidista. Amorfinen hydrokloridi.

$C_{31}H_{35}BrN_2O_5 \cdot x HCl$ (632,0)

Laskettu: C 58,9 H 5,70 Br 12,60 Cl 5,60 N 4,41

Saatu: 57,7 6,08 12,57 5,60 4,70

Esimerkki 223

1-(4-amino-3-bromi-5-tert.butyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-amino-3-bromi-5-tert.butyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaanista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-imidatsolidista. Amorfinen aine.

IR-spektri (metyleenikloridi): CO 1660 cm^{-1}
Esteri-CO 1710 cm^{-1} , 1730 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 254 nm, 280 nm.

Esimerkki 224

1-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-iminometyyli-bentsoyylioksi)-4-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-iminometyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaanista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-imidatsolidista. Amorfinen hydrokloridi.

$C_{34}H_{39}BrN_2O_5 \cdot x HCl$ (672,1)

Laskettu: C 60,8 H 6,0 Br 11,9 Cl 5,3 N 4,2

Saatu: 59,5 6,5 12,0 5,3 4,5

Esimerkki 225

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-4-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-

sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-4-hydroksi-n-butaanista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-imidatsolidista. Amorfinen hydrokloridi.

$C_{37}H_{45}BrN_2O_5 \times HCl$ (714,2)

Laskettu: C 62,2 H 6,5 Br 11,2 Cl 5,0 N 3,9

Saatu: 61,2 6,7 11,2 5,1 4,1

Esimerkki 226

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-syklopentyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-4-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-syklopentyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-4-hydroksi-n-butaanista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-imidatsolidista. Amorfinen hydrokloridi.

$C_{35}H_{41}BrN_2O_5 \times HCl$ (686,1)

Laskettu: C 61,3 H 6,2 Br 11,6 Cl 5,2

Saatu: 61,7 6,5 11,4 5,1

Esimerkki 227

1-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-4-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-4-hydroksi-n-butaanista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-imidatsolidista.

Hydrokloridin sulamispiste: 148 - 150°C.

Esimerkki 228

1-/4-amino-3-bromi-5-(2-dietyyliaminoetyyli-aminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(2-dietyyliaminoetyyli-aminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-imidatsolidista.

Hydrokloridin sulamispiste: 70°C:sta lähtien (hajooa).

Esimerkki 229

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-etyylikloridista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 53 - 59°C.

Esimerkki 230

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-3-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 3-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-n-propyylikloridista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3450 cm^{-1}
 CO 1660 cm^{-1}
 Esteri- CO 1710 cm^{-1} , 1730 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 254 nm, 288 nm.

Esimerkki 231

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-n-butylikloridista ja 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

$\text{C}_{32}\text{H}_{37}\text{BrN}_2\text{O}_5$ (609)

Laskettu: C 63,05 H 6,11 N 4,59

Saatu: 62,50 6,51 4,42

Esimerkki 232

2-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bensoyylioksi)-2'-(3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetoksi)-dietyylisulfidi

Esimerkki 236

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)-amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3440 cm^{-1}
 Esteri-CO 1710 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 228 nm, 286 nm.

Esimerkki 237

1-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-2-/2-/(2,6-
dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-etyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)-amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3440 cm^{-1}
 Esteri-CO 1710 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 282 nm.

Esimerkki 238

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyy-
lioksi/-2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi)-etyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Sulamispiste: 110,5 - 112°C.

Esimerkki 239

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)-amino/-fenvyliasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenvylietikkahappo-natriumsuolasta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3440 cm^{-1}
 Esteri-CO 1710 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 285 nm.

Esimerkki 240

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-syklopentyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenvyliasetoksi)-etaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-syklopentyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-etyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenvylietikkahappo-natriumsuolasta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3440 cm^{-1}
 Esteri-CO 1710 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 285 nm.

Esimerkki 241

1-(4-amino-3-bromi-5-tert.butyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenvyliasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-(4-amino-3-bromi-5-tert.butyyliaminometyylibentsoyylioksi)-etyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenvylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 224 - 225 °C.

Esimerkki 242

1-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenvyliasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyli-aminometyyli-bentsoyylioksi)-etyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 130,5 - 132°C.

Esimerkki 243

1-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-iminometyyli-bentsoyylioksi)-2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-iminometyyli-bentsoyylioksi)-etyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 182 - 183°C.

Esimerkki 244

1-/2-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-/2-/(2,5-dikloorifenyyli)amino)-fenyyliasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-/2-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksi-etaanista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1690 ja 1725 cm⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 222, 275 ja 348 nm.

Esimerkki 245

1-(2-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-(2-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksi-etaanista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1730 ja 1690 cm⁻¹

Na-lkyyli 2810 cm⁻¹

UV-spketri (etanoli): λ max 223, 276 ja 346 nm.

Esimerkki 246

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-
3-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyli-asetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 3-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-n-propyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)-amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Sulamispiste: 148 - 150°C.

Esimerkki 247

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsovyli-
oksi/-4-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheptyyliaminometyyli)-bentsovylioksi/-n-butylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)-amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

$C_{35}H_{42}BrCl_2N_3O_4$ (719)

Laskettu: C 58,42 H 5,88 Br 11,11 Cl 9,86 N 5,84

Saatu: 58,97 5,77 10,84 9,61 5,71

Esimerkki 248

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-n-propyyliaminometyyli)-
bentsovylioksi/-4-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-
n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsovylioksi/-n-butylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyliamino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Öljy.

$C_{35}H_{42}BrCl_2N_3O_4$ (719)

Laskettu: C 58,42 H 5,88 Br 11,11 Cl 9,86 N 5,84

Saatu: 58,16 6,03 10,95 9,73 5,84

Esimerkki 249

1-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-iminometyyli-bentsoyylioksi)-4-
/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-iminometyyli-bentsoyylioksi)-n-butylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyliamino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 122 - 125°C.

Esimerkki 250

1-(4-amino-3-bromi-5-tert.butyyliminometyyli-bentsoyylioksi)-4-/2-
/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-(4-amino-3-bromi-5-tert.butyyliminometyyli-bentsoyylioksi)-n-butylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyliamino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 122 - 124°C.

Esimerkki 251

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-sykloheksyyliminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-4-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-sykloheksyyliminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-butylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyliamino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 145 - 147°C.

Esimerkki 252

1-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliminometyyli-bentsoyylioksi)-4-/2-/(2,6-
dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliminometyyli-bentsoyylioksi)-n-butylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyliamino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 87 - 90°C.

Esimerkki 253

1-(4-amino-3-bromi-5-pyrrolidinometyyli-bentsoyylioksi)-4-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-(4-amino-3-bromi-5-pyrrolidinometyyli-bentsoyylioksi)-n-butylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyliamino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 143 - 145°C.

Esimerkki 254

1-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-4-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-n-butylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyliamino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 174 - 176°C.

Esimerkki 255

1-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-4-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-n-butylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyliamino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 184 - 185°C.

Esimerkki 256

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-4-/2-/(2,6-dikloorifenyyli) amino/-fenyyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-butylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyliamino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3450 cm^{-1}
 Esteri-CO 1700 cm^{-1}
 UV-spektri (etanoli): λ max 282 nm.

Esimerkki 257

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-bentsyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-4-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-bentsyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-butylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyliamino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3445 cm^{-1}
 Esteri-CO 1700 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 283 nm.

Esimerkki 258

1-(4-amino-3-bromi-5-sykloheksyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-(4-amino-3-bromi-5-sykloheksyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-n-butylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyliamino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 166 - 168°C.

Esimerkki 259

1-(4-amino-3-bromi-5-isopropyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-4-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-butaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 4-(4-amino-3-bromi-5-isopropyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-n-butylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyliamino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3440 cm^{-1}
 Esteri-CO 1705 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 282 nm.

Esimerkki 263

1-(4-amino-3-bromi-5-sykloheksyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-5-/2-
/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 5-(4-amino-3-bromi-5-sykloheksyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-n-pentyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 152 - 153°C.

Esimerkki 264

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-5-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 5-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-pentyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 50 - 60°C.

Esimerkki 265

1-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-5-/2-/(2,6-
dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 5-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-n-pentyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 183 - 185°C.

Esimerkki 266

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-piperatsinometyyli)-bentsoyylioksi/-5-
/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 5-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-piperatsinometyyli)-bentsoyylioksi/-n-pentyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 193 - 196°C.

Esimerkki 267

1-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-5-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 5-(4-amino-3-bromi-5-morfolinometyyli-bentsoyylioksi)-n-pentyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 185 - 187°C.

Esimerkki 268

1-(4-amino-3-bromi-5-pyrrolidinometyyli-bentsoyylioksi)-5-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 5-(4-amino-3-bromi-5-pyrrolidinometyyli-bentsoyylioksi)-n-pentyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 152 - 153°C.

Esimerkki 269

1-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-5-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 5-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-n-pentyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 140 - 144°C.

Esimerkki 270

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 5-/4-amino-3-bromi-5-(N-metyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-pentyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 105 - 110°C.

Esimerkki 271

1-(4-amino-3-bromi-5-tert.butyyliaminometyyli-bentsoyylioksi/-5-/2-
/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 5-(4-amino-3-bromi-5-tert.butyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-n-pentyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 109 - 111°C.

Esimerkki 272

1-(4-amino-3-bromi-5-heksametyleen-iminometyyli-bentsoyylioksi)-5-
/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 5-(4-amino-3-bromi-5-heksametyleen-iminometyyli-bentsoyylioksi)-n-pentyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 149 - 150°C.

Esimerkki 273

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyy-
lioksi/-5-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 5-/4-amino-3-bromi-5-(N-sykloheksyyli-n-propyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-pentyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.

Hydrokloridin sulamispiste: 113 - 115°C.

Esimerkki 274

1-/2-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-5-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-/2-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-hydroksi-n-pentaanista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1685 ja 1710 cm^{-1}
 N-alkyyli 2830 cm^{-1}
 UV-spektri (etanoli): λ max 233, 275 ja 348 nm.

Esimerkki 275

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliamino-metyyli)-bentsamido/5-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 5-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-n-pentyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Amorfinen dihydrokloridi.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1720 cm^{-1}
 Amidi-CO 1640 cm^{-1}
 UV-spektri (etanoli): λ max 275 nm.

Esimerkki 276

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoylylioksi)-6-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-heksaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 6-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoylylioksi)-n-heksyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Hydrokloridin sulamispiste: 63 - 69°C.

Esimerkki 277

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-6-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-heksaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 6-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsamido/-n-heksyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Amorfinen hydrokloridi:

$\text{C}_{36}\text{H}_{45}\text{BrCl}_2\text{N}_4\text{O}_3$ (769,1)

Laskettu: C 56,22 H 6,03 Br 10,39 Cl 13,83 N 7,28
 Saatu: 56,69 6,23 10,15 13,54 7,25

Esimerkki 278

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-7-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-heptaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 7-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-heptyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Hydrokloridin sulamispiste: 96 - 100°C.

Esimerkki 279

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-8-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-oktaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 8-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-oktyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Hydrokloridin sulamispiste: 131 - 133°C.

Esimerkki 280

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-9-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-nonaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 9-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-nonyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Hydrokloridin sulamispiste: 106 - 108°C.

Esimerkki 281

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-10-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-dekaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 10-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-n-dekyylikloridista ja

2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta.
Hydrokloridin sulamispiste: 125 - 127°C.

Esimerkki 282

2-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-2'-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-dietyylisulfidi

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 2-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-2'-hydroksi-dietyylisulfidista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahaposta.
Hydrokloridin sulamispiste: 135 - 138°C (vaahtoaa).

Esimerkki 283

2-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-2'-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-dietyylioksidi

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 2-(4-amino-3-bromi-5-piperidinometyyli-bentsoyylioksi)-2'-hydroksi-dietyylioksidista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahaposta. Öljy.

$C_{31}H_{34}BrCl_2N_3O_5$ (679,5)

Laskettu: C 54,80 H 5,04 Br 11,76 Cl 10,44 N 6,18

Saatu: 54,50 5,18 11,75 10,44 6,27

Esimerkki 284

2-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-iminometyyli-bentsoyylioksi)-2'-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-dietyylioksidi

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 2-(4-amino-3-bromi-5-heksametyyleeni-iminometyyli-bentsoyylioksi)-2'-hydroksi-dietyylioksidista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahaposta. Öljy.

$C_{32}H_{36}BrCl_2N_3O_5$ (693,5)

Laskettu: C 55,42 H 5,23 Br 11,52 Cl 10,23 N 6,06

Saatu: 55,77 5,53 11,20 9,93 5,78

Esimerkki 285

2-(4-amino-3-bromi-5-dimetyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2'-/2-
/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-dietyylioksidi

Esimerkki 288

1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-6-(+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetoksi/-n-heksaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 6-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-n-heksyylikloridista ja (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliinietikkahappo-natriumsuolasta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): OCH_3 2830 cm^{-1}
 Esteri-CO 1700 cm^{-1} , 1730 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 282 nm.

Esimerkki 289

1-(2-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-(2-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-hydroksietaanista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahaposta. Öljy.

$\text{C}_{33}\text{H}_{35}\text{BrClN}_3\text{O}_6$ (685,0)

Laskettu: C 57,86 H 5,15 Br 11,67 Cl 5,18 N 6,13

Saatu: 57,99 5,18 11,43 5,07 6,09

Esimerkki 290

1-/4-amino-3-kloori-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 7 mukaisesti 4-amino-3-kloori-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylikloridista ja 1-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-2-hydroksietaanista. Amorfinen hydrokloridi.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 ja 1735 cm^{-1}
 Amidi-CO 1680 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): λ max 228 nm (olka), 276 nm.

Esimerkki 291

1-/2-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-
asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-/2-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-hydroksietaanista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahaposta. Öljy.

$C_{37}H_{41}BrClN_3O_6$ (739,1)

Laskettu: C 60,13 H 5,39 Br 10,81 Cl 4,80 N 5,69

Saatu: 60,16 5,55 11,04 4,90 5,86

Esimerkki 292

1-(4-amino-3-kloori-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-/1-(4-
klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-etaani

Valmistetaan esimerkin 7 mukaisesti 4-amino-3-kloori-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylikloridista ja 1-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-2-hydroksi-etaanista. Amorfinen hydrokloridi.

IR-spektri (metyleenikloridi): Esteri-CO 1710 ja 1725 cm^{-1}
 Amidi-CO 1680 cm^{-1}

UV-spektri (etanoli): max 228 nm (olka), 275 nm.

Esimerkki 293

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-metyyli-2-n-propyyli-3-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-
metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-n-propaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-metyyli-2-n-propyyli-3-hydroksi-n-propaanista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi): NH_2 3450 cm^{-1}
 N-alkyyli 2940 cm^{-1}
 Esteri-CO 1705 ja 1735 cm^{-1}
 Amidi-CO 1685 cm^{-1}

Esimerkki 294

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-2-fenyyli-etaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-fenyyli-2-hydroksi-etaanista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):	NH ₂	3440 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2940 cm ⁻¹
	O-CH ₃	2860 cm ⁻¹
	Esteri-CO	1710 ja 1745 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 295 nm.

Esimerkki 295

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-1,2-difenyyli-etaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-1,2-difenyyli-2-hydroksi-etaanista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):	NH ₂	3450 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2930 cm ⁻¹
	O-CH ₃	2860 cm ⁻¹
	Ester-CO	1710 ja 1740 cm ⁻¹
	Amidi-CO	1685 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 225 nm, 288 nm.

Esimerkki 296

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-asetoksi/-1-fenyyli-etaani

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-

sykloheksyyliaminometyyli)-bentsyylioksi/-1-fenyyli-2-hydroksi-etaa-
nista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-
etikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3440 cm ⁻¹
N-alkyyli	2915 cm ⁻¹
O-CH ₃	2850 cm ⁻¹
Esteri-CO	1710 ja 1740 cm ⁻¹
Amidi-CO	1685 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 288 nm.

Esimerkki 297

2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksimetyyli/-6-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-
indoli-3-asetoksimetyyli/-pyridiini

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-
sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksimetyyli/-6-hydroksimetyyli-
pyridiinistä ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-
3-etikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):

NH ₂	3440 cm ⁻¹
N-alkyyli	2930 cm ⁻¹
O-CH ₃	2850 cm ⁻¹
Esteri-CO	1710 ja 1735 cm ⁻¹
Amidi-CO	1685 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 285 nm.

Esimerkki 298

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksimetyyli/-4-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-
3-asetoksimetyyli/-bentseeni

Valmistetaan esimerkin 4 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-
sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksimetyyli/-4-hydroksimetyyli-
bentseenistä ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-
3-etikkahaposta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):	NH ₂	3450 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2940 cm ⁻¹
	O-CH ₃	2860 cm ⁻¹
	Esteri-CO	1705 ja 1740 cm ⁻¹
	Amidi-CO	1685 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 280 nm.

Esimerkki 299

1-) 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksimetyyli/-4-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-
3-asetoksimetyyli/-sykloheksaani

Valmistetaan esimerkin 1 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksimetyyli/-4-hydroksimetyyli-sykloheksaanista ja 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indoli-3-etikkahappo-imidatsolidista. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):	NH ₂	3450 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2940 cm ⁻¹
	O-CH ₃	2860 cm ⁻¹
	Esteri-CO	1705 ja 1735 cm ⁻¹
	Amidi-CO	1685 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 230 nm, 290 nm.

Esimerkki 300

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksi/-2-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-2-fenyyli-
etaani

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 2-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-1-fenyyli-etyylikloridista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):	NH ₂	3450 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2940 cm ⁻¹
	Esteri-CO	1725 cm ⁻¹

UV-spektri (etanoli): λ max 282 nm.

Esimerkki 301

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksimetyyli/-4-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksimetyy-
li/-bentseeni

Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksimetyyli/-4-hydroksimetyyli-bentseenistä ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)-amino/-fenyylietikkahappo-natriumsuolasta. Öljy.

IR-spketri (metyleenikloridi):	NH ₂	3450 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2940 cm ⁻¹
	Esteri-CO	1710 cm ⁻¹

UV-spketri (etanoli): λ max 283 nm.

Esimerkki 302

1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyyli-
oksimetyyli/-4-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksimetyyli/
sykloheksaani

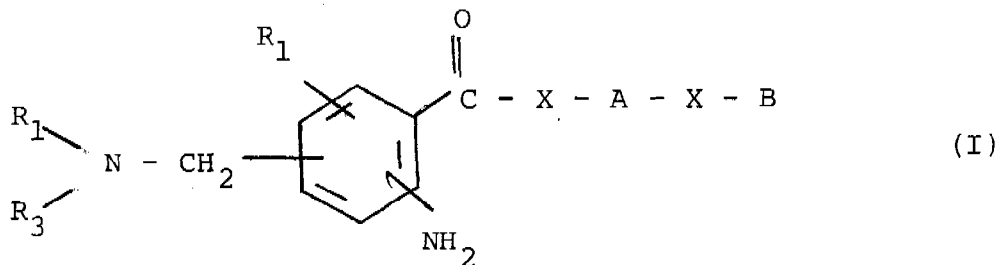
Valmistetaan esimerkin 8 mukaisesti 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksimetyyli/-4-kloorimetyyli-sykloheksaanista ja 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyylietikka-happo-natriumsuolasta. Öljy.

IR-spektri (metyleenikloridi):	NH ₂	3440 cm ⁻¹
	N-alkyyli	2430 cm ⁻¹
	Esteri-CO	1705 ja 1720 cm ⁻¹

UV-spketri (etanoli): λ max 283 nm.

Patenttivaatimukset

1. Uudet yleiskaavan (I) mukaiset bentsoyylijohdokset



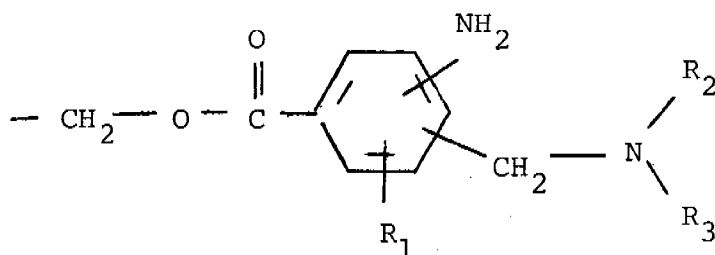
jossa

X on happiatomi tai iminoryhmä, jolloin molemmat X-ryhmät voivat olla samanlaisia tai erilaisia,

R₁ on vety-, fluori-, kloori- tai bromiatomi,

R_2 ja R_3 , jotka voivat olla samanlaisia tai erilaisia, ovat vetyatomeja, 1-6-hiiliatomisia, suoraketjuisia tai haarautuneita alkyyliryhmiä, jotka voivat olla substituoidut fenyyli- tai dialkyylilaminoryhmällä, jossa on 1 - 3 hiiliatomia kummassakin alkyyliosassa, 5-7-hiiliatomisia pyridyyl- tai sykloalkyyli- tai R_2 ja R_3 yhdessä niiden välissä sijaitsevan typpi-atomin kanssa merkitsee pyrrolidino-, piperidino-, heksametyleeni-imino-, morfolino-, N-aryylipiperatsino- tai N-alkyyli-piperatsinoryhmää, jolloin alkyyliryhmässä voi olla 1 - 3 hiiliatomia,

A on 5-7-hiiliatominen sykloalkyyli-ryhmä tai 2-10-hiiliatominen alky-leeniryhmä, joka voi olla substituoitu yhdellä tai kahdella alkyyliryhmällä, jossa kulloinkin 1 - 3 hiiliatomia, yhdellä tai kahdella karbalkoksiryhmällä, joissa on yhteensä kulloinkin 2 - 4 hiiliatomia, yhdellä tai kahdella fenyyli-ryhmällä, 1 - 4 hydroksyyli-ryhmällä, halogeenimetyyli-, hydroksimetyyli-, alkanoyylioksi- tai alkanoyyli-oximetyyli-ryhmällä, jossa kulloinkin on 1 - 18 hiiliatomia alkanoyli-liosassa, tai ryhmällä, jonka kaava on



jolloin R_1 , R_2 ja R_3 tarkoittavat samaa kuin edellä, tai sen voi katkaista happi- tai rikkiatomi, sulfoksidi-, sulfonyyli-, bentseeni-, sykloheksaani-, pyridiini-, piperatsino- tai iminoryhmä, jolloin iminoryhmä voi olla substituoitu 1-6-hiiliatomisella alkyyliryhmällä, fenyyli- tai fenyylialkyyliryhmällä, jossa on 1 - 3 hiiliatomia alkyylilosassa, ja

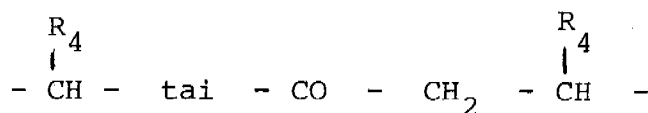
B on antiflogistikan, joka sisältää karboksyyli-ryhmän, asyyli-ryhmä ja sidottu sillä ryhmään X, ja näiden yhdisteiden fysiologisesti sopivat happoadditiosuolat epäorgaanisten tai orgaanisten happojen kanssa.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukaiset uudet yleiskaavan (I) bentsoyyli-johdokset, joissa

R_1 , R_2 , R_3 , A ja X tarkoittavat samaa kuin patenttivaatimuksessa 1, ja B on asyyli-ryhmä, jonka yleiskaava on

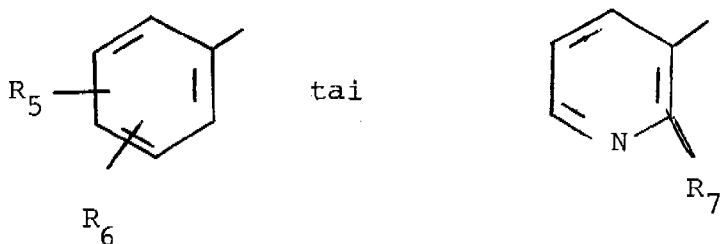


jossa D on yksinkertainen sidos ryhmän E ja karbonyyli-ryhmän hiiliatomin välillä tai ryhmä, jonka kaava on



jolloin

R_4 on vetyatomi, metyyli- tai etyyli-ryhmä, ja E on ryhmä, jonka kaava on



jolloin

R₅ on vety-, fluori-, kloori- tai bromiatomi tai hydroksiryhmä, R₆ on mahdollisesti metyyliryhmällä, trifluorimetyyliryhmällä, fluori-, kloori- ja/tai bromiatomeilla mono-, di- tai trisubstituoitu fenyyli-, fenoksi- tai fenyyliaminoryhmä, 2-metyylipropyyli-, sykloheksyyli-, asetoksi-, bentsoyyli-, 2-tienyylikarbonyyli-, 2,5-dihydro-1H-pyrrol-1-yyli- tai 1,3-dihydro-1-okso-2H-isoindol-2-yyli-ryhmä ja

R₇ on metyyli-, trifluorimetyyliryhmällä, fluori-, kloori- ja/tai bromiatomeilla mono- tai disubstituoitu fenyyliaminoryhmä, tai B on

1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indol-3-asetyyli-,
 (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetyyli-,
 5-bentsoyyli- α -metyyli-2-tiofeeeniasetyyli-,
 1-metyyli-5-(4-metyylibentsoyyli)-1H-pyrroli-2-asetyyli-,
 5-fluori-2-metyyli-1-//4-(metyylisulfinyyli)-fenyyli/-metyleeni/-1H-inden-3-asetyyli-,
 6,11-dihydro-11-okso-dibents/b,e/oksepiini-3-asetyyli-,
 6,11-dihydro-11-okso-dibents/b,e/oksepiini-2-asetyyli-,
 α -metyyli-5-okso-4H-dibentso/a,d/syklohepteeni-asetyyli-,
 2-(4-kloorifenyyli)-metyyli-5-bentsoksatsoliasetyyli-,
 6-kloori- α -metyyli-9H-karbatsoli-2-asetyyli-,
 1,3,4,9-tetrahydro-1-propyyli-pyrano/3,4-b/indol-1-asetyyli-,
 1,8-dietyyli-1,3,4,9-tetrahydro-pyrano/3,4-b/indol-1-asetyyli-,
 2-//4,5-bis(4-kloorifenyyli)-2-oksatsolyyli/tio/propanoyyli-,
 1-(4-kloorifenyyli)-2,5-dimetyyli-1H-pyrroli-3-asetyyli-,
 4-(4-kloorifenyyli)-2-fenyyli-5-tiatsoliasetyyli-,
 10-metyyli-10H-fenotiatsiini-2-asetyyli-,
 7-metoksi- α ,10-dimetyyli-10H-fenotiatsiini-2-asetyyli- tai
 5-kloori-3-metyyli-bentso/b/tiofeeni-2-asetyyliryhmä, ja niiden fysiologisesti sopivat happoadditiosuolat epäorgaanisten tai orgaanisten happojen kanssa.

3. Patenttivaatimuksen 2 mukaiset uudet yleiskaavan (I) bentsoyyli-

johdokset, joissa

X on happiatomi tai iminoryhmä, jolloin molemmat X-ryhmät voivat olla samanlaisia tai erilaisia,

R_1 on vety-, kloori- tai bromiatomi,

R_2 ja R_3 , jotka voivat olla samanlaisia tai erilaisia, ovat vety-atomeja, 1-4-hiiliatomisia alkyyliryhmiä, 5-7-hiiliatomisia syklo-alkyyliryhmiä, bentsyyli- tai 2-dietyyliamino-etyyliryhmiä tai R_2 ja R_3 yhdessä niiden välissä sijaitsevan typpi-atomin kanssa tarkoittaa pyrrolidino-, piperidino-, heksametyyleeni-imino-, morfolino-, N-metyyli-piperatsino- tai N-fenyyli-piperatsinoryhmää,

A on 2-10-hiiliatominen suoraketjuinen alkyleeniryhmä, etyleeniryhmä, joka on substituoitu yhdellä tai kahdella metyyliryhmällä, yhdellä tai kahdella alkoksikarbonyyliryhmällä, joissa on yhteensä kulloinkin 2 tai 3 hiiliatomia, yhdellä tai kahdella fenyyli-ryhmällä, hydroksi-, kloorimetyyli-, hydroksimetyyli-, 4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylisimetyyli- tai alkanoyylioksimeetyli-ryhmällä, jossa on 1 - 18 hiiliatomia alkanoyyliolosassa, propyleeniryhmä, joka on 2-asemassa substituoitu hydroksiryhmällä tai 1-18-hiiliatomisella alkanoyylioksiryhmällä tai kahdella alkyyliryhmällä, joissa kulloinkin on 1 - 3 hiiliatomia, 4 hydroksiryhmällä substituoitu n-heksyleeniryhmä, sykloheksyleeniryhmä tai 4-6-hiiliatominen suoraketjuinen alkyleeniryhmä, jonka C-atomien 2 ja 3 tai 3 ja 4 välissä katkaisee happi- tai rikkiatomi, sulfoksidi-, sulfonyyli-, amino-, fenyyliamino-, bentsyyliamino-, piperatsino- tai alkyyliaminoryhmä, jossa on 1 - 4 hiiliatomia, 1,4-sykloheksaani-dimetyyleeni-, p-ksylyleeni- tai 2,6-pyridiini-dimetyleeniryhmä ja B on 2-asetoksibentsoyyli-, 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyli-asetyyli-, 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indol-3-asetyyli-, 3-bentsoyyli- α -metyyli-fenyyliasetyyli-, α -metyyli-4-(2-metyylipropyyli)-fenyyliasetyyli-, 2-fluori- α -metyyli-/1,1'-bifenyyli/-4-asetyyli- ja (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetyyliryhmä, ja niiden fysiologisesti sopivat happoadditiosuolat epäorgaanisten tai orgaanisten happojen kanssa.

4. Patenttivaatimuksen 3 mukaiset uudet yleiskaavan (I) bentsoyyli-johdokset, joissa

X on kulloinkin happiatomi,

R_1 on bromiatomi,

R_2 on metyyli- tai etyyliryhmä,

R_3 on etyyli- tai sykloheksyyli-ryhmä tai R_2 ja R_3 yhdessä typpi-atomin kanssa merkitsee heksametyyleeni-iminoryhmää,

A on 2-6-hiiliatominen suoraketjuinen alkyleeniryhmä tai 4-6-hiiliatominen suoraketjuinen alkyleeniryhmä, jonka C-atomien 2 ja 3 tai 3 ja 4 välissä katkaisee happi- tai rikkiatomi, etyyliamino- tai propyyliaminoryhmä, ja

B on 1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indol-3-asetyyli-, 2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/fenyyliasetyyli-, 3-bentsoyyli- -metyyli-enyyliasetyyli-, (+)-6-metoksi- α -metyyli-2-naftaliiniasetyyli- α -metyyli-4-(2-metyyllipropyyli)-fenyyliasetyyli- tai 2-fluori- α -metyyli-/1,1'-bifenyyli/-4-asetyyli-ryhmä, ja niiden fysiologisesti sopivat suolat epäorgaanisten tai orgaanisten happojen kanssa.

5. 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indol-3-asetoksi/-etaani ja sen happoadditiosuolat.

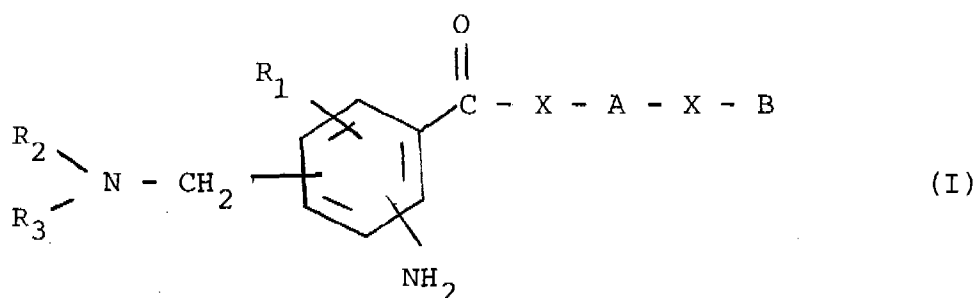
6. 1-/4-amino-3-bromi-5-(N-etyyli-sykloheksyyliaminometyyli)-bentsoyylioksi/-5-/2-/(2,6-dikloorifenyyli)amino/-fenyyliasetoksi/-n-pentaani ja sen happoadditiosuolat.

7. 1-(4-amino-3-bromi-5-dietyyliaminometyyli-bentsoyylioksi)-2-/1-(4-klooribentsoyyli)-5-metoksi-2-metyyli-1H-indol-3-asetoksi/-etaani ja sen happoadditiosuolat.

8. Lääkeaineet, jotka sisältävät patenttivaatimusten 1 - 7 mukaista yhdistettä yhden tai useamman inertin kantoaineen ja/tai laimentimen lisäksi.

9. Patenttivaatimusten 1 - 7 mukaisen yhdisteen käyttö tulehdusprosessien torjuntaan tarkoitetun lääkeaineen valmistamiseen ei-kemiallista tietä.

10. Menetelmä valmistaa uusia yleiskaavan (I) mukaisia bentsoyylijohdoksia



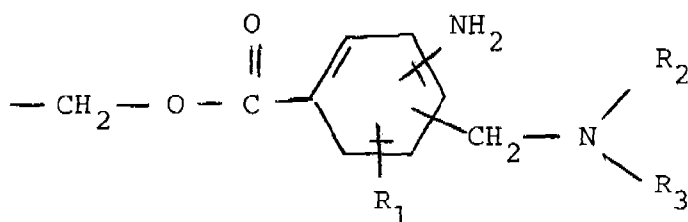
jossa

X on happiatomi tai iminoryhmä, jolloin molemmat X-ryhmät voivat olla samanlaisia tai erilaisia,

R_1 on vety-, fluori-, kloori- tai bromiatomi,

R_2 ja R_3 , jotka voivat olla samanlaisia tai erilaisia, ovat vetyatomeja, 1-6-hiiliatomisia suoraketjuisia tai haarautuneita alkyyliryhmiä, jotka voivat olla substituoidut fenyyli- tai dialkyyliminoryhmällä, jossa on kussakin alkyyliosassa 1 - 3 hiiliatomia, 5-7-hiiliatomisia pyridyyl- tai sykloalkyyliryhmiä tai R_2 ja R_3 yhdessä niiden välissä sijaitsevan typpi- tai happiatomin kanssa merkitsee pyrrolidino-, piperidino-, heksametyyleeni-imino-, morfolino-, N-aryylipiperatsino- tai N-alkyylipiperatsinoryhmää, jolloin alkyyliryhmä voi sisältää 1 - 3 hiiliatomia,

A on 5-7-hiiliatominen sykloalkyleeniryhmä tai 2-10-hiiliatominen alkyleeniryhmä, joka on substituoitu yhdellä tai kahdella alkyyliryhmällä, joissa kulloinkin on 1 - 3 hiiliatomia, yhdellä tai kahdella karbalkoksiryhmällä, joissa on yhteensä kulloinkin 2 - 4 hiiliatomia, yhdellä tai kahdella fenyyli- tai alkyyliryhmällä, 1 - 4 hydroksyyli- tai alkanoyyli- tai alkanoyyliminoryhmällä, jossa kulloinkin on 1 - 18 hiiliatomia alkanoyyli- tai alkanoyyliminoryhmässä, tai ryhmällä, jonka kaava on



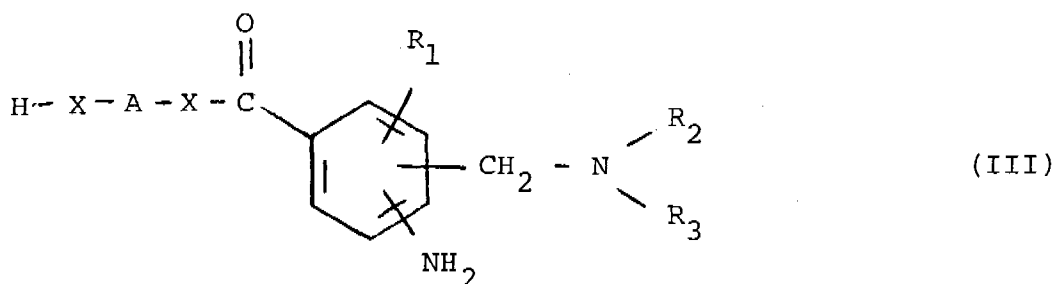
jolloin R_1 , R_2 ja R_3 tarkoittavat samaa kuin edellä, tai sen katkaisee happi- tai rikkiatomi, sulfoksidi-, sulfonyyli-, bentseeni-, sykloheksaani-, pyridiini-, piperatsino- tai iminoryhmä, jolloin iminoryhmä

voi olla substituoitu 1-6-hiiliatomisella alkyyliryhmällä, fenyyli- tai fenyylialkyyliryhmällä, jossa on 1 - 3 hiiliatomia alkyylisosassa, ja

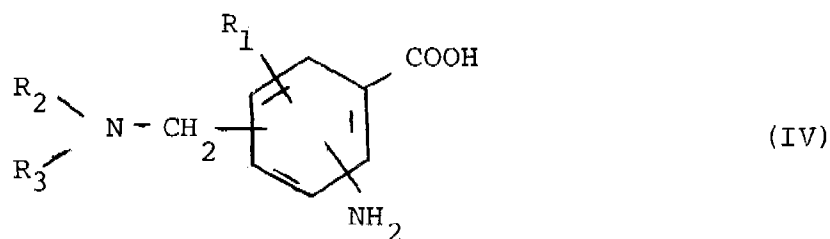
B on antiflogistikan, joka sisältää karboksyyliryhmän, asyyliryhmä ja on sillä liittynyt ryhmään X, ja näiden yhdisteiden fysiologisesti sopivia happoadditiosuoloja epäorgaanisten tai orgaanisten happojen kanssa, t u n n e t t u siitä, että yleiskaavan (II) mukainen karboksyylihapo



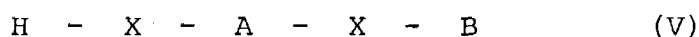
sen suola tai reaktiokykyinen johdos saatetaan reagoimaan yleiskaavan (III) mukaisen yhdisteen



sen alklisuolojen tai reaktiokykyisten johdosten kanssa, tai yleiskaavan (IV) mukainen karboksyylihapo



sen suola tai reaktiokykyinen johdos saatetaan reagoimaan yleiskaavan (V) mukaisen yhdisteen



sen alkalisuolojen tai reaktiokykyisten johdosten kanssa, joissa kaavoissa

$R_1 - R_3$, A, B ja X tarkoittavat samaa kuin edellä ja ryhmä HX yhdessä ryhmän A vierekkäisten, α - ja β -asemassa sijaitsevien C-atomien kanssa voi tarkoittaa myös oksiranyyliryhmää, ja haluttaessa sen jälkeen muunnetaan saatu yleiskaavan (I) mukainen yhdiste, jossa A sisältää hydroksyyliryhmän, asyloimalla vastaavaksi

yleiskaavan (I) mukaiseksi asyylioksiyhdisteeksi tai muunnetaan saatu yleiskaavan (I) mukainen yhdiste, jossa A tarkoittaa rikkiatomin katkaisemaa alkyleeniryhmää, hapettamalla vastaavaksi sulfoksidi- tai sulfonyyliyhdisteeksi tai

saatu yleiskaavan (I) mukainen yhdiste, jossa A tarkoittaa sulfoksidiryhmän katkaisemaa alkyleeniryhmää, muunnetaan hapettamalla vastaavaksi sulfonyyliyhdisteeksi tai

saatu yleiskaavan (I) mukainen yhdiste muunnetaan fysiologisesti sopiviksi happoadditiosuoloikseen käyttämällä 1 - 3 ekvivalenttia kyseen tulevaa epäorgaanista tai orgaanista happoa.

11. Patenttivaatimuksen 10 mukainen menetelmä, t u n n e t t u siitä että yleiskaavan (III) tai V) mukaisen yhdisteen tai sen alkalisuolan reaktion yleiskaavan (III tai IV) mukaisen karboksyylihapon tai sen funktionaalisen johdoksen kanssa suoritetaan mahdollisesti happoaktivoivan ja/tai vettä sitovan aineen läsnäollessa lämpötiloissa välillä -25 ja 250°C .

12. Patenttivaatimuksen 10 mukainen menetelmä, t u n n e t t u siitä että yleiskaavan (II) tai IV) mukaisen karboksyylihapon tai sen suolan reaktio yleiskaavan (III tai V) mukaisen yhdisteen reaktiokykyisen johdoksen kanssa suoritetaan lämpötiloissa välillä -25 ja 250°C .

13. Patenttivaatimuksen 11 mukainen menetelmä, t u n n e t t u siitä että yleiskaavan (II tai IV) mukaisen karboksyylihapon funktionaalisenä johdoksena käytetään sen esterää, imidatsolidia, happohalogeniä, sen anhydridiä, sen seka-anhydridiä, sen asyylioksitrifenyylifosfoniumsuolaa, sen N-asyylioksi-imidiä tai myös sen isatohappoanhydridiä, kun aminoryhmä on yleiskaavan (IV) mukaisen karboksyylihapon 2-asemassa.

14. Patenttivaatimuksen 12 mukainen menetelmä, t u n n e t t u siitä, että yleiskaavan (III tai V) mukaisen yhdisteen reaktiokykyisenä johdoksena käytetään sen fosfatsojohdosta, mikäli X on iminoryhmä, tai, mikäli X on happiatomi, sen epoksidia, sen halogenidia tai sen esterää sulfoni- tai karboksyylihapon kanssa.

15. Patenttivaatimuksen 12 mukainen menetelmä, t u n n e t t u siitä, että yleiskaavan (II tai IV) mukaisen karboksyylihapon suolana käytetään alkali-, maa-alkali- tai hopeasuolaa.

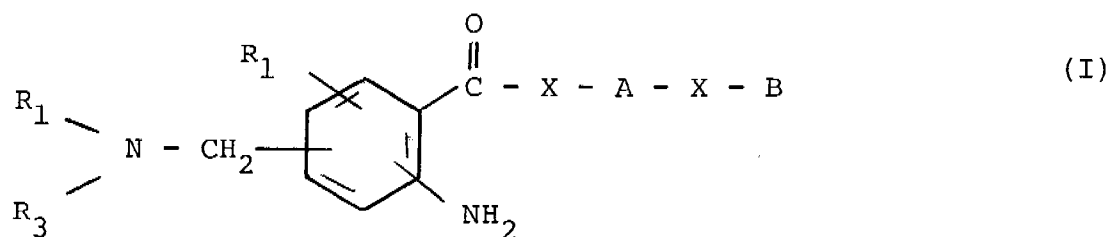
16. Patenttivaatimusten 10 - 15 mukainen menetelmä, t u n n e t t u siitä, että reaktio suoritetaan liuottimessa ja lämpötiloissa välillä -10°C ja käytetyn liuottimen kiehumislämpötila.

17. Patenttivaatimusten 10 - 16 mukainen menetelmä, t u n n e t t u siitä, että reaktio suoritetaan epäorgaanisen tai tertiäärisen orgaanisen emäksen läsnäollessa.

18. Patenttivaatimusten 10 - 16 mukainen menetelmä, t u n n e t t u siitä, että reaktio suoritetaan, kun mukana on reaktiota jouduttavaa ainetta, kuten natriumhydridiä, 4-dimetyyliaminopyridiiniä, natriumjodidia tai kaliumjodidia tai kun mukana on faasinsiirtokatalyyttiä, kuten kruunueetteriä.

Patentkrav

1. Nya benzoylderivater enligt den allmänna formeln (I)



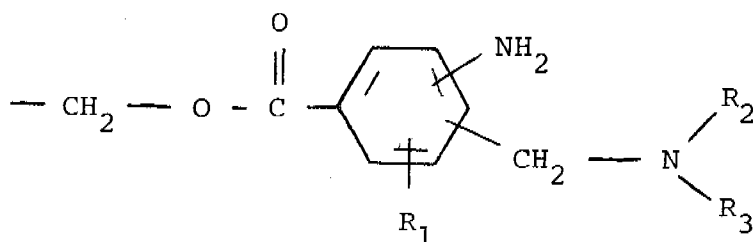
där

X avser syreatomen eller iminogruppen, varvid de båda X-grupperna kan vara likadana eller olika,

R₁ avser väte-, fluor-, klor- eller bromatomen,

R₂ och R₃, vilka kan vara likadana eller olika, avser väteatomer, alkylgrupper med 1 - 6 kolatomer och rak ked eller grenar, vilka kan vara substituerade medels fenylgruppen eller dialkylaminogruppen med 1 - 3 kolatomer i de båda alkyldelarna, pyridyl- eller cykloalkylgrupper med 5 - 7 kolatomer eller R₂ och R₃ tillsammans med kväveatomen mellan dem avser pyrrolidino-, piperidino-, hexametylen-imino-, morfolino-, N-arylpiperazino- eller N-alkylpiperazino-gruppen, varvid alkylgruppen kan uppvisa 1 - 3 kolatomer,

A avser cykloalkylgruppen med 5 - 7 kolatomer eller alkylengruppen med 2 - 10 kolatomer, som kan vara substituerad medels en eller två alkylgrupper med 1 - 3 kolatomer, medels en eller två karbalkoxigrupper med tillsammans 2 - 4 kolatomer, medels en eller två fenylgrupper, medels 1 - 4 hydroxylgrupper, medels halogenmetyl-, hydroximetyl-, alkanoyloxi- eller alkanoyloxi-metylgruppen, som uppvisar 1 - 18 kolatomer i alkyldelen eller medels gruppen med formeln



varvid R_1 , R_2 och R_3 avser detsamma som förut eller den kan brytas medels syre- eller svavelatomen, sulfoxid-, sulfonyl-, benzen-, cyklohexan-, pyridin-, piperazino- eller iminogruppen, varvid iminogruppen kan vara substituerad medels alkylgruppen med 1 - 6 kolatomer, medels fenyl- eller fenylalkylgruppen med 1 - 3 kolatomer i alkyliden, och

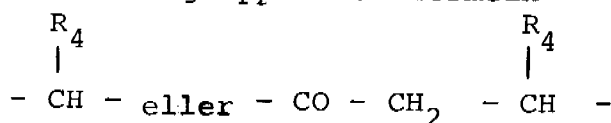
B avser acylgruppen av antilogistika, som innehåller karboxylgruppen och bunden medels den med gruppen X, och dessa föreningars fysiologiskt passande syraadditionssalter med oorganiska eller organiska syror.

2. Nya benzoylderivater enligt den allmänna formeln (I) i patentkravet 1 där

R_1 , R_2 , R_3 , A och X avser detsamma som i patentkravet 1, och B avser acylgruppen med den allmänna formeln



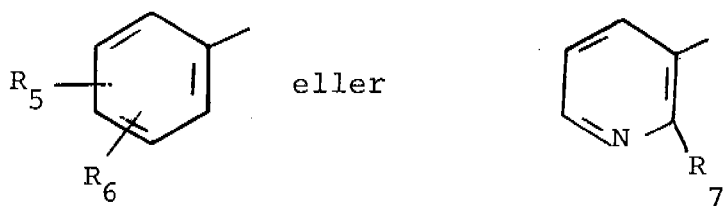
där D avser en enkel bindning mellan gruppen E och karbonylgruppens kolatom eller gruppen med formeln



varvid

R_4 avser väteatomen, metyl- eller etylgruppen, och

E avser gruppen med formeln



varvid

R_5 avser väte-, fluor-, klor- eller bromatomen eller bromatomen och hydroxigruppen,

R_6 avser möjligt medels metylgrupper, trifluormetylgrupper, fluor-, klor- och/eller bromatomer mono-, di- eller trisubstituerad fenyl-, fenoxi- eller fenylaminogruppen, 2-metylpropyl-, cyklohexyl-, acetoxi-, benzoyl-, 2-tienylkarbonyl-, 2,5-dihydro-1H-pyrrol-1-yl eller 1,3-dihydro-1-oxo 2H-isoindol-2-ylgruppen och

3.

R₇ avser medels trifluormetylgrupper, fluor-, klor- och/eller brom-
atomer mono- eller disubstituerad fenylaminogrupp,
eller B avser

1-(4-klorbenzoyl)-5-metoxi-2-metyl-1H-indol-3-acetyl-, (+)-6-metoxi- α -
metyl-2-naftalinacetyl-,
5-benzoyl- α -metyl-2-tiofenacetyl-,
1-metyl-5-(4-metylbenzoyl)-1H-pyrrol-2-acetyl-,
5-fluor-2-metyl-1-//4-(metylsulfinyl)-fenyl/-metylen/-1H-inden-3-acetyl-,
6,11-dihydro-11-oxo-dibenz/b,e/oxepin-3-acetyl-,
6,11-dihydro-11-oxo-dobenz/b,e/oxepin-2-acetyl-,
 α -metyl-5-oxo-4H-dibezo/a,d/cyklohepten-acetyl-,
2-(4 klorfenyl)-metyl-5-benzoxazolacetyl-,
6-klor- α -metyl-9H-karbazol-2-acetyl-,
1,3,4,9-tetrahydro-1-propyl-pyrano/3,4-b/indol-1-acetyl-,
1,8-dietyl-1,3,4,9-tetrahydro-pyrano/3,4-b/indol-1-acetyl-,
2-//4,5-bis(4-klorfenyl)-2-oxazolyl/tio/propanoyl-,
1-(4-klorfenyl)-2,5-dimetyl-1H-pyrrol-3-acetyl-,
4-(4-klorfenyl)-2-fenyl-5-tiazolacetyl-,
10-metyl-10H-fenotiazin-2-acetyl-,
7-metoxi- α ,10-dimetyl-10H-fenotiazin-2-acetyl- eller
5-klor-3-metyl-benzo/b/tiofen-2-acetylgruppen, och deras fysiologiskt
passande syraadditionssalter med oorganiska eller organiska syror.

3. Nya benzoylderivater enligt den allmänna formeln (I) och patent-
kravet 2, där

X avser syreatomen eller iminogruppen, varvid de båda X-grupperna kan
vara likadana eller olika,

R₁ avser väte-, klor- eller bromatomen,

R₂ och R₃, vilka kan vara likadana eller olika, avser väteatomer,
alkylgrupper med 1 - 4 kolatomer, cykloalkylgrupper med 5 - 7 kolatomer,
benzyl eller 2-dietyl-amino-etylgrupper eller R₂ och R₃ tillsammans med
kväveatomen mellan dem avser pyrrolidino-, piperidino-, hexametylen-
imino-, morfolino-, N-metyl-piperazino- eller N-fenyl-piperazinogruppen,
A avser alkylengruppen med 2 - 10 kolatomer och rak ked, etylengruppen,
som substituerats medels en eller två metylgrupper, en medels en eller
två metylgrupper substituerad etylengrupp, medels en eller två alkoxi-
karbonylgruppen, vilka tillsammans uppvisar 2 eller 3 kolatomer, medels
en eller två fenylgrupper, medels hydroxi-, klormetyl-, hydroximetyl-,
4-amino-3-brom-5-(N-etyl-cyklohexylaminometyl-benzoyloxometyl- eller
alkanoyloximetylgruppen med 1 - 18 kolatomer i alkanoyldelen,
propylengruppen, som är vid 2-läget substituerad medels hydroxigruppen

eller medels alkanoylgruppen med 1 - 18 kolatomer eller med två alkylgrupper, vilka uppvisar 1 - 3 kolatomer, en medels 4 hydroxigrupper substituerad n-hexylengrupp, cyklohexylengruppen eller alkylengruppen med 4 - 6 kolatomer och rak ked, som mellan C-atomer 2 och 3 eller 3 och 4 bryts av syre- eller svavelatomen, sulfonyl-, amino-, fenylamino-, benzylamino, piperazino- eller alkylaminogruppen med 1 - 4 kolatomer, 1,4-cyklohexan-dimetyl-, p-xylen- eller 2,6-pyridin-dimetylgruppen och B avser 2- acetoxibenzoyl-, 2-/(2,6-diklorfenyl) amino/-fenyl-acetyl-, 1-(4-klorbenzoyl)-5-metoxi-2-metyl-1H-indol-3-acetyl-, 3-benzoyl- α -metyl-fenylacetyl-, α -metyl-4-(2-metylpropyl)-fenylacetyl-, 2-fluor- α -metyl-/1,1'-bifenyl/-4-acetyl-och (+)-6-metoxi- α -metyl-2-naftalinacetylgruppen, och deras fysiologiskt passande syraadditionssalter med oorganiska eller organiska syror.

4. Nya benzoylfenylderivater enligt den allmänna formeln (I) enligt patentkravet 3, där

X avser syreatomen,

R₁ avser bromatomen,

R₂ avser metyl- eller etylgruppen,

R₃ avser etyl- eller cyklohexylgruppen eller R₂ och R₃ tillsammans med kväveatomen avser hexametyl-iminogruppen,

A avser alkylengruppen med 2-6 kolatomer och rak ked, mellan C-atomer 2 och 3 eller 3 och 4 bryts syre- eller svavelatomen, etylamino- eller propylaminogruppen, och

B avser 1-(4-klorbenzoyl)-5-metoxi-2-metyl-1H-indol-3-acetyl-, 2-/(2,6-diklorfenyl) amino/fenylacetyl-, 3-benzoyl-metyl-enylacetyl-, (+)-6-metoxi- α -metyl-2-naftalinacetyl-, α -metyl-4-(2-metylpropyl)-fenylacetyl- eller 2-fluor α -metyl-/1,1'-bifenyl/-4-acetylgruppen, och deras fysiologiskt passande salter med oorganiska eller organiska syror.

5. 1-/4-amino-3-brom-5-(N-etyl-cyklohexylaminometyl)-benzoyloxi/-2-/1-(4-klorbenzoyl)-5-metoxi-3-metyl-1H-indol-3-acetoxi/-etan och dess syraadditionssalter.

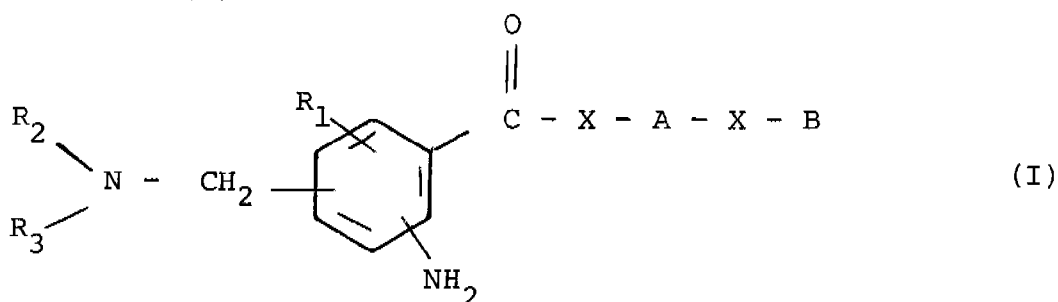
6. 1-/4-amino-3-brom-5-(N-etyl-cyklohexylaminometyl)-benzoyloxi/-5-/2-/(2,6-diklorfenyl) amino/-fenylacetoxi/-n-pentan och dess syraadditionssalter.

7. 1-(4-amino-3-brom-5-dietylaminometyl-benzoyloxi)-2-/1-(4-klorbenzoyl)-5-metoxi-2-metyl-1H-indol-3-acetoxi/-etan och dess syraadditionssalter.

8. Läkemedel, vilka innehåller föreningen enligt patentkraven 1 - 7 utom ett eller flera inert bärämne och/eller förlamare.

9. Bruk av föreningen enligt patentkraven 1 - 7 för framställning av läkemedel för avvärjning av inflammationsprocesser på icke-kemisk väg.

10. Förfarande för framställning av nya benzoylderivater enligt den allmänna formeln (I)



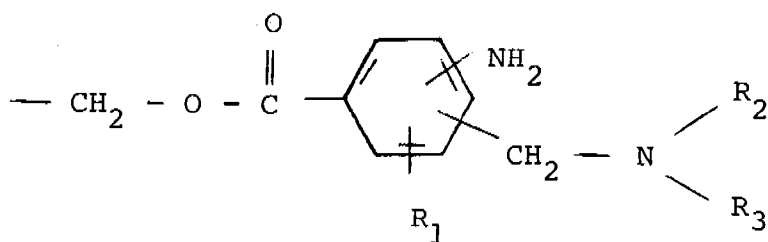
där

X avser syreatomen eller iminogruppen, varvid de båda X-grupperna kan vara likadan eller olika,

R₁ avser väte-, fluor-, klor- eller bromatomen,

R₂ och R₃, vilka kan vara likadana eller olika, avser väteatomer, alkylgrupper med 1 - 6 kolatomer eller rak ked eller grenar, vilka kan vara substituerade medels fenylgruppen eller dialkylaminogruppen, som uppvisar i varje alkyl-del 1 - 3 kolatomer, pyridyl- eller cykloalkylgrupper med 5 - 7 kolatomer eller R₂ och R₃ tillsammans med kväveatomen mellan dem avser pyrrolidino-, piperidino-, hexametylen-imino-, morfolino-, N-arylpiperazino eller N-alkylpiperazinogruppen, varvid alkylgruppen kan innehålla 1 - 3 kolatomer,

A avser cykloalkylengruppen med 5 - 7 kolatomer eller alkylengruppen med 2 - 10 kolatomer, som är substituerad medels en eller flera alkylgrupper, vilka varje uppvisar 1 - 3 kolatomer, medels en eller karbalkoxigrupper vilka uppvisar tillsammans 2 - 4 kolatomer, medels en eller två fenylgrupper, medels 1 - 4 hydroxylgrupper, medels halogenmetyl-, hydroximetyl alkanoyloxi- eller alkanoyloximetylgruppen uppvisande 1 - 18 kolatomer i alkanoyldelen, eller medels gruppen med formeln

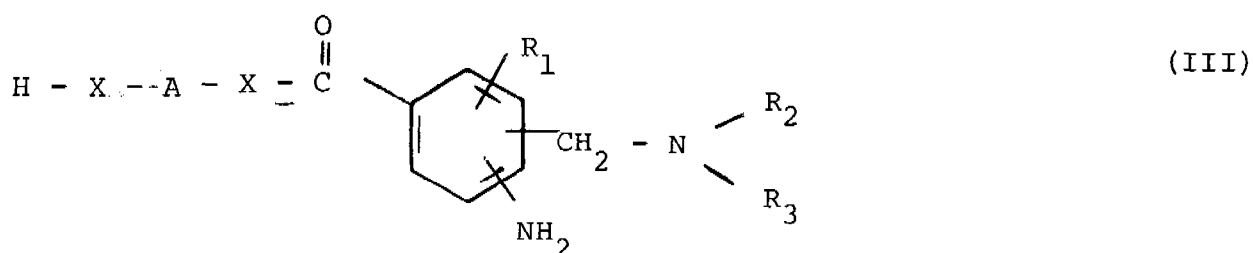


varvid R_1 , R_2 och R_3 avser detsamma som förut, eller den bryts av syre- eller svavelatomen, sulfoxid-, sulfonyl-, benzen-, cyklohexan-, pyridin-, piperazino- eller iminogruppen, varvid iminogruppen kan vara substituerad medels alkylgruppen med 1 - 6 kolatomer, medels fenyl- eller fenylalkylgruppen med 1 - 3 kolatomer i alkyliden, och

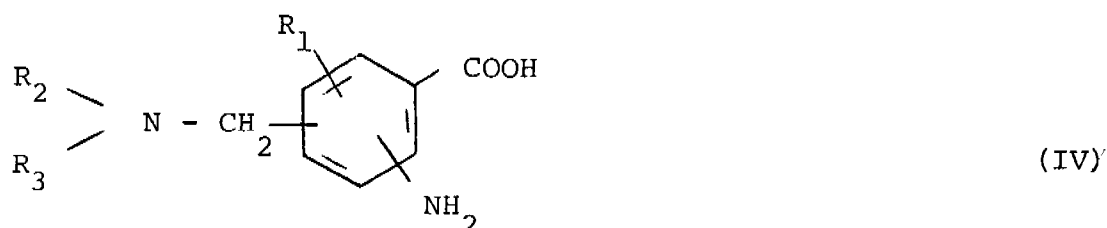
B avser acylgruppen av antilogisktika, som innehåller karboxylgruppen och är medles den förenad med gruppen X och dessa föreningars fysiologiskt passande syraadditionssalter med oorganiska eller organiska salter, k ä n n e t e c k n a t därav, att karboxylsyran enligt den allmänna formeln (II)



dess salt eller reaktionsförmåga ägande derivat bringas att reagera med föreningen enligt den allmänna formeln (III)



dess alkalsalter eller reaktionsförmåga ägande derivater, eller karboxylsyran enligt den allmänna formeln (IV)



dess salt eller reaktionsförmågan uppvisande derivat bringas att reagera med föreningen enligt den allmänna formeln (V)



dess alkalsalter eller reaktionsförmågan uppvisande derivater, i vilka formler

R_1-R_3 , A, B och X avser detsamma som förut och gruppen HX tillsammans med invida C-atomer av gruppen A vid α - och β -läget kan också avse oxiranylgruppen,

och vid behov därefter transformeras den erhållna föreningen enligt den allmänna formeln (I), där A innehåller hydroxylgruppen, medels acylering till motsvarande acyloxiföreningen enligt den allmänna formeln (I) eller den erhållna föreningen enligt den allmänna formeln (I), där A avser alkylengruppen bryts av svavelatomen, transformeras medels oxidering till den motsvarande sulfoxid- eller sulfonylföreningen eller den erhållna föreningen enligt den allmänna formeln (I), där A avser alkylengruppen bryten av sulfoxidgruppen, transformeras medels oxidering till en motsvarande sulfonylförening eller den erhållna föreningen enligt den allmänna formeln (I) transformeras till sina fysiologiskt passande syraadditionssalter medels bruk av 1 - 3 ekvivalenter ifrågavarande oorganisk eller organisk syra.

11. Förfarandet enligt patentkravet 10, k ä n n e t e c k n a t därav, att reaktionen av föreningen enligt den allmänna formeln (III eller V) med dess funktionella derivat utförs möjligt under närvaro av syraaktiverande och/eller vatten bindande ämne vid temperaturer mellan $-25 - 250^{\circ}\text{C}$.

12. Förfarandet enligt patentkravet 10, k ä n n e t e c k n a t därav, att reaktionen av karboxylsyran enligt den allmänna formeln (II eller IV) eller dess salt med reaktionsförmågan ägande derivat av föreningen enligt den allmänna formeln (III eller V) utförs vid temperaturer mellan $-25 - 250^{\circ}\text{C}$.

13. Förfarandet enligt patentkravet 11, k ä n n e t e c k n a t därav, att som den funktionella derivaten av karboxylsyran enligt den allmänna formeln (II eller IV) användes dess ester, imidazolid, syrahalogenis, dess anhydrid, dess semianhydrid, dess acyloxitrifenylfosforiumsalt, dess N-acyloxi-imid eller också dess isatosyraanhydrid medan aminogruppen är vid 2-läget av karboxylsyran enligt den allmänna formeln (IV).

14. Förfarandet enligt patentkravet 12, k ä n n e t e c k n a t därav, att som den reaktionsförmågan ägande derivaten av föreningen enligt den allmänna formeln (III eller V) användes dess fosfazoderivat, om X avser iminogruppen eller, om X avser syreatomen, dess epoxid, dess halogenid eller dess ester med sulfon- eller karboxylsyran.
15. Förfarandet enligt patentkravet 12, k ä n n e t e c k n a t därav, att som saltet av karboxylsyran enligt den allmänna formeln (II eller IV) användes alkal-, jordalkal- eller silversalt.
16. Förfarandet enligt patentkraven 10 - 15, k ä n n e t e c k n a t därav, att reaktionen utförs i lösaren och vid temperaturer mellan -10°C och den använda lösarens koktemperatur.
17. Förfarandet enligt patentkraven 10 - 16, k ä n n e t e c k n a t därav, att reaktionen utförs under närvaro av oorganisk eller tertiärisk organisk bas.
18. Förfarandet enligt patentkraven 10 - 16, k ä n n e t e c k n a t därav, att reaktionen utförs medan det finns med reaktionen påskyndande ämne, såsom natriumhydrid, 4-dimetylamino-pyridin, natriumjodid eller kaliumjodid, eller medan det finns med fasförflyttningskatalyt, såsom kronäter.