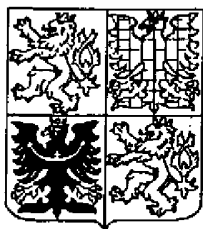


ČESKÁ
REPUBLIKA

(19)



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

ZVEŘEJNĚNÁ PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

(12)

(22) 29.04.93
(32) 30.04.92, 24.07.92
(31) 92/4214465, 92/4224440
(33) DE, DE
(40) 19.01.94

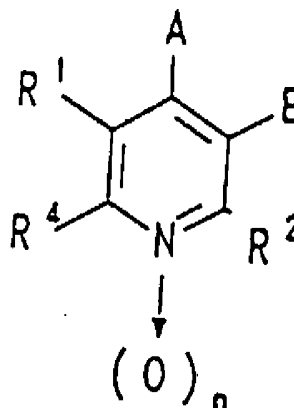
(21) 780-93

(13) A3

5(51)

C 07 D 213/82
C 07 D 213/76
C 07 D 213/79
C 07 D 213/75
C 07 D 213/89
C 07 D 401/12
C 07 D 405/12
C 07 D 409/12
A 61 K 31/64
A 61 K 31/635
A 61 K 31/455

- (71) HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT, Frankfurt am Main, DE;
- (72) Weidmann Klaus dr., Kronberg/Taunus, DE;
Bickel Martin dr., Bad Homburg, DE;
Günzler-Pukall Volkmar dr., Marburg, DE;
- (54) 4- nebo 5-(sulf)imido- a (sulfon)amidopyridiny a jejich pyridin-N-oxidy, způsob jejich přípravy a jejich použití jako léčiv
- (57) Nové 4- nebo 5-(sulf)imido- a (sulfon)-amidopyridiny a odpovídající pyridin-N-oxidy obecného vzorce I a způsob přípravy těchto sloučenin, které tvoří aktivní složku léčiv proti fibrosním chorobám.



č.j.	025502
Dodáno	29. IV 93
URAD	PRŮM. S. OYÉHO
PRIL.	PLAST. NICTVIT

4- nebo 5-(Sulf)imido- a (sulfon)amidopyridiny a jejich pyridin-N-oxidy, způsob jejich přípravy a jejich použití jako léčiv

Oblast techniky

Vynález se týká 4- nebo 5-(sulf)imido- a (sulfon)amido pyridinů a jejich pyridin-N-oxidů, způsobu jejich přípravy a jejich použití jako léčiv proti fibrosním chorobám.

Dosavadní stav techniky

Sloučeniny, které inhibují enzymy prolin- a lysinhydroxylázu, způsobují velmi selektivní inhibici biosyntézy kolagenu ovlivněním pro kolagen specifických hydroxylačních reakcí. Při těchto reakcích se enzymy prolin-, popřípadě lysinhydroxylázou hydroxyluje proteinicky vázaný prolin nebo lysin. V případě, že je působením inhibitoru těmito reakcím zabráněno, vznikne nefunkční podhydroxylovaná molekula kolagenu, která může být jen v nepatrné míře převáděna z buněk do extracelulárního prostoru. Podhydroxylovaný kolagen kromě toho nemůže být zabudován do kolagenové struktury a je takto velmi snadno proteolyticky odbourán. V důsledku těchto účinků se zmenšuje celkové množství extracelulárně uloženého kolagenu.

Inhibitory prolinhydroxylázy jsou proto vhodnými látkami pro použití v terapii chorob, u kterých k celkovému obrazu choroby výrazně přispívá ukládání kolagenu. K těmto chorobám mezi jinými patří fibrosy plic, jater a pokožky (sklerodermie), jakož i ateroskleróza.

Je známo, že enzym prolinhydroxyláza je účinně inhibován kyselinou pyridin-2,4- a -2,5-dikarboxylovou (K. Majamaa a kol., Eur.J.Biochem.138(1984) 239-245). Tyto sloučeniny jsou ovšem v buněčné kultuře účinné jako inhibitory pouze ve velmi vysokých koncentracích (Tschank G. a kol., Biochem.J 238 (1987) 625-633). V J.Med.Chem. 1992, 35, str. 800-804 jsou popsány 5-sulfonylimidy

pyridin-2,5-dikarboxylových kyselin.

V patentovém spisu DE-A 34 32 094 jsou jako prostředky sloužící jako léčivo pro inhibici prolin- a lysinhydroxylázy popsány diestery pyridin-2,4- a -2,5-dikarboxylových kyselin s 1 až 6 uhlíkovými atomy.

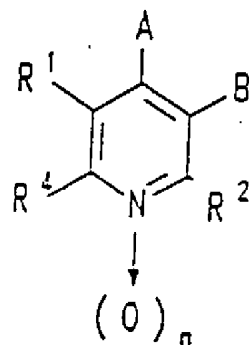
Tyto nízkoalkylované diestery však mají nevýhodu spočívající v tom, že se v organismu příliš rychle štěpí na kyseliny a že tedy nedospějí na místo účinku v buňce v dostatečně vysoké koncentraci a v důsledku toho jsou méně vhodné pro případné podávání ve funkci léčiva.

V patentových spisech DE-A 37 03 959, DE-A 37 03 962 a DE-A 37 03 963 jsou obecně popsány smíšené ester/amidy, výše alkylované diestery a diamidy pyridin-2,4- a -2,5-dikarboxylových kyselin, u kterých bylo na zvířecím modelu prokázáno, že účinně inhibují biosyntézu kolagenu.

Cílem vynálezu je nalézt sloučeniny, které by měly silnější antifibrosní účinnost než dosud známé sloučeniny.

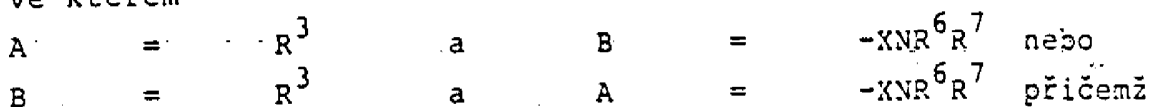
Podstata vynálezu

Tohoto cíle je dosaženo 4- nebo 5-(sulf)imido- a (sulfon)-amidopyridiny a analogickými sloučeninami a jejich pyridin-N-oxidy obecného vzorce I



(I)

ve kterém



X znamená jednoduchou vazbu nebo skupinu $-\text{CO}-$ a

R^1 , R^2 a R^3 , které jsou stejné nebo odlišné, znamenají atom vodí-

ku, nesubstituovanou nebo substituovanou alkylovou skupi-
nu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupi-
nu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, atom halogenu,
zejména atom fluoru, atom chloru nebo atom bromu, nitrí-
lovou skupinu, hydroxy-skupinu nebo aminovou skupinu,

R^6 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až
20 uhlíkových atomů nebo N-ochrannou skupinu, jakou je
acylová skupina, alkanoylová skupina obsahující 1 až 20
uhlíkových atomů, alkenoylová skupina obsahující 1 až 20
uhlíkových atomů, alkinoylová skupina obsahující 1 až 20
uhlíkových atomů, aralkanoylová skupina obsahující 7 až 20
uhlíkových atomů, aroylová skupina obsahující 6 až 18 uhlí-
kových atomů, alkylkarbamoylová skupina, ve kterém alkylový
zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxykarbonylová
skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíko-
vých atomů, benzyloxykarbonylová skupina, acyloxyalkylová
skupina, ve které acylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíko-
vých atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových
atomů, výhodně alkanoyloxyalkylová skupina, ve které alka-
noylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylo-
vý zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzoyloxy-

alkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až
6 uhlíkových atomů, benzyloxykarbonyloxyalkylová skupina,
ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů
nebo alkoxykarbonyloxyalkylová skupina, ve které alkoxylo-
vý zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a alkylový zby-
tek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, fyziologicky použi-
telný kationt, jako Na^+ , K^+ , Mg^{2+} , Ca^{2+} , Al^{3+} nebo amonio-
vý iont, případně jednou až třikrát substituovaný alkylo-
vou skupinou obsahující 1 až 16 uhlíkových atomů, hydroxy-
alkylovou skupinou, ve které alkylový zbytek obsahuje 1
až 16 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinou, ve které
alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alky-
lový zbytek obsahuje 1 až 16 uhlíkových atomů, fenylovou
skupinou, benzylovou skupinou nebo alkylovou skupinou,
obsahující 1 až 16 uhlíkových atomů,

která může být jednou až třikrát substituována hydroxy-skupinou nebo alkoxylovou skupinou obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, nebo kationt bázeického derivátu aminokyseliny, přičemž aryllový zbytek může být případně substituován,

R^7 znamená skupinu YR^8 , ve které
 Y znamená skupinu $-SO_2-$, $-CO-$, $-CONR^9$ nebo $-SO_2NR^9$ a
 R^8 a R^9 znamenají skupinu $/C-U/_{r-D-W}$, ve které

C znamená vazbu nebo
rozvětvenou nebo nerozvětvenou alifatickou alkan-
diylovou skupinu obsahující 1 až 16 uhlíkových ato-
mů nebo cyklalifatickou alkandiylovou skupinu obsa-
hující 3 až 10 uhlíkových atomů nebo rozvětvenou
nebo nerozvětvenou alkandiylovou skupinu obsahující
2 až 16 uhlíkových atomů nebo cykloalkandiylovou
skupinu nebo alkindiylovou skupinu obsahující 2 až
16 uhlíkových atomů nebo alkenindiylovou skupinu
obsahující 2 až 16 uhlíkových atomů, které mohou
vždy obsahovat jednu nebo více vícenásobných vazeb
uhlík-uhlík,

U znamená vazbu nebo
atom vodíku nebo
heteroatomovou skupinu zvolenou z množiny zahrnující
skupinu $-CO-$, skupinu $-O(CO)-$, skupinu $-(CO)-O-$,
skupinu $-(CO)NR-$, skupinu $-NR(CO)-$, skupinu $-O-$, sku-
pinu $-SO-$, skupinu $-SO_2-$ a skupinu $-NR$, kde R zname-
ná alkylovou skupinu obsahující 1 až 3 uhlíkové ato-
my, alkanoylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových
atomů, aralkanoylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlí-
kových atomů, aroylovou skupinu obsahující 6 až 12
uhlíkových atomů nebo atom vodíku,

r znamená 1, 2, 3 nebo 4,

D znamená vazbu nebo atom vodíku nebo
rozvětvenou nebo nerozvětvenou alifatickou alkandiy-
lovou skupinu obsahující 1 až 10 uhlíkových atomů
nebo
rozvětvenou nebo nerozvětvenou alkandiylovou skupinu
obsahující 1 až 10 uhlíkových atomů, alkindiylovou
skupinu obsahující 2 až 10 uhlíkových atomů nebo

alkenindiylovou skupinu obsahující 2 až 10 uhlíkových atomů, které mohou vždy obsahovat jednu nebo více vícenásobných vazeb uhlík-uhlík,

W znamená

atom vodíku nebo cykloalifatickou alkylovou, alkenylovou, alkinylovou nebo alkeninylovou skupinu obsahující 3 až 10 uhlíkových atomů nebo arylovou skupinu obsahující 6 až 16 uhlíkových atomů nebo 5- nebo 6-člennou heteroarylovou skupinu, přičemž alespoň jeden z obecných substituentů C nebo D nebo W neznámá vazbu a U znamená heteroatomovou skupinu pouze tehdy, kdy C neznámá vazbu, a C, D a/nebo W, pokud neznámají vazbu nebo atom vodíku, jsou výhodně samy o sobě substituovány,

nebo

R^8 a R^9 jsou také spojeny přes 3 až 6 uhlíkových atomů, přičemž $-NR^8R^9$ tvoří heterocyklický kruh s dusíkem jako heteroatomem,

nebo

R^9 znamená R^6

a

pro skupinu $/C-U/_{r-D-W}$ je vyloučen význam $-SO_2H$,

R^4 znamená skupinu, která může být fyziologicky, zejména v játrech, převedena na karboxylátovou skupinu nebo její soli, přičemž jsou vyloučeny estery a amidy,

n znamená 0 nebo 1,

f znamená 1 až 8, výhodně 1 až 5,

g znamená 0,1 až $(2f+1)$ a

x znamená 0 až 8, výhodně 0 nebo 1.

Výhodnými sloučeninami podle vynálezu jsou sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém

X znamená jednoduchou vazbu nebo skupinu $-CO-$,

R^1 , R^2 a R^3 , které jsou stejné nebo odlišné, znamenají atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, atom halogenu, zejména atom fluoru, atom chloru nebo atom bromu, nitrilovou skupinu, hydroxy-skupinu, aminovou skupinu, případně mono- nebo disubstituovanou alkylovou

R⁶

skupinou obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy, hydroxyalkylovou skupinou, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy nebo alkylkarbonyloxy-skupinou, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů nebo N-ochrannou skupinu, jakou je acylová skupina, alkanoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, alkenoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, alkinoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, aralkanoylová skupina obsahující 7 až 20 uhlíkových atomů, aroylová skupina obsahující 6 až 18 uhlíkových atomů, alkylkarbamoylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxykarbonylová skupina obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxykarbonylová skupina, acyloxyalkylová skupina, ve které acylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, výhodně alkanoyloxyalkylová skupina, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxykarbonyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů nebo alkoxykarbonyloxyalkylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, fyziologicky použitelný kationt, jako Na^+ , K^+ , Mg^{2+} , Ca^{2+} , Al^{3+} nebo amoniový iont, případně jednou až třikrát substituovaný alkylovou skupinou obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinou, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 16 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinou, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 16 uhlíkových atomů, fenylovou skupinou, benzylovou skupinou nebo alkylovou skupinou obsahující 1 až 16 uhlíkových atomů, která může být jednou až třikrát substituována hydroxy-skupinou nebo alkoxy-skupinou obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, nebo kationt báze aminokyseliny, přičemž arylový zbytek může být případně substituován, znamená skupinu YR^8 , ve které

R⁷

Y znamená skupinu $-SO_2$, $-CO-$, $-CONR^9$ nebo skupinu $-SO_2NR^9$ a R^8 a R^9 znamenají skupinu $/C-U/_{r-D-W}$, ve které

C znamená vazbu nebo

rozvětvenou nebo nerozvětvenou alifatickou-alkan-
diylovou skupinu obsahující 1 až 16 uhlíkových ato-
mů nebo cyklalifatickou alkandiylovou skupinu obsa-
hující 3 až 10 uhlíkových atomů nebo rozvětvenou
nebo nerozvětvenou alkandiylovou skupinu obsahující
2 až 16 uhlíkových atomů nebo cykloalkandiylovou
skupinu nebo alkandiylovou skupinu obsahující 2 až
16 uhlíkových atomů nebo alkenindiylovou skupinu
obsahující 2 až 16 uhlíkových atomů, které mohou
vždy obsahovat jednu nebo více vícenásobných vazeb
uhlík-uhlík,

U znamená vazbu nebo

atom vodíku nebo

heteroatomovou skupinu zvolenou z množiny zahrnující
skupinu $-CO-$, skupinu $-O(CO)-$, skupinu $-(CO)-O-$,
skupinu $-(CO)NR-$, skupinu $-NR(CO)-$, skupinu $-O-$, sku-
pinu $-SO-$, skupinu $-SO_2-$ a skupinu $-NR$, kde R zname-
ná alkylovou skupinu obsahující 1 až 3 uhlíkové ato-
my, alkanoylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových
atomů, aralkanoylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlí-
kových atomů, aroylovou skupinu obsahující 6 až 12
uhlíkových atomů nebo atom vodíku,

r znamená 1, 2, 3 nebo 4,

D znamená vazbu nebo atom vodíku nebo

rozvětvenou nebo nerozvětvenou alifatickou alkandí-
ylovou skupinu obsahující 1 až 10 uhlíkových atomů
nebo

rozvětvenou nebo nerozvětvenou alkandiylovou skupinu
obsahující 1 až 10 uhlíkových atomů, alkandiylovou
skupinu obsahující 2 až 10 uhlíkových atomů nebo
alkenindiylovou skupinu obsahující 2 až 10 uhlíko-
vých atomů, které mohou vždy obsahovat jednu nebo
více vícenásobných vazeb uhlík-uhlík,

W znamená

atom vodíku nebo cykloalifatickou alkylovou, alkeny-

lovou, alkinylovou nebo alkeninylovou skupinu obsahující 3 až 10 uhlíkových atomů nebo arylovou skupinu obsahující 6 až 16 uhlíkových atomů nebo 5- nebo 6-člennou heteroarylovou skupinu, přičemž alespoň jeden z obecných substituentů C nebo D nebo W neznamená vazbu a U znamená heteroatomovou skupinu pouze tehdy, kdy C neznamená vazbu, a C, D a/nebo W, pokud neznamenají vazbu nebo atom vodíku, jsou výhodně samy o sobě substituovány kombinací až 5 stejných nebo odlišných substituentů z množiny zahrnující hydroxylovou skupinu, atom halogenu, kyano-skupinu, trifluormethylovou skupinu, nitro-skupinu, karboxylovou skupinu, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, alkenylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 12 uhlíkových atomech, alkoxyalkoxylovou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxyskupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, skupinu $-O-CH_2/\overset{\cdot}{C}_fH_{(2f+1-g)}$, skupinu $-OCF_2Cl$, skupinu $-OCF_2-CHFCl$,

alkylkarbonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

cinnamoylovou skupinu, alkenylkarbonylovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylkarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkoxykarbonylovou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxykarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkoxykarbonylovou skupinu, ve které aralkoxylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoyloxy-skupinu, alkenylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxykarbonyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxykarbonyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

alkenyloxykarbonyloxy-skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinyloxykarbonyloxy-skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 10 uhlíkových atomech, N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10

uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

karbamoyloxy-skupinu, N-alkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12, N-cykloalkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbamoyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, aralkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylkarbamoyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aryloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

aminovou skupinu, alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, dialkylaminovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylaminovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenylaminovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylaminovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, N-arylamínovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-aralkylaminovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkylaralkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylamínovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkylaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylamínovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkanoylamínovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, aroylamínovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkanoylamínovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aroyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje

6 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-aminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminoalkylovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aralkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aminoalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkylmerkaptó-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfinylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, arylmerkaptó-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfinylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, aralkylmerkaptó-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje

7 až 16 uhlíkových atomů, aralkylsulfinylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, aralkylsulfonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

sulfamoylovou skupinu, N-alkylsulfamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylsulfamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkylsulfamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylsulfamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylsulfamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylsulfamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylsulfamoylovou skupinu,

alkylsulfonamidovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(alkyl)-alkylsulfonamidovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkylsulfonamidovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkyl)-aralkylsulfonamidovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

příčemž skupiny, které obsahují arylový zbytek, mohou být samy o sobě na arylovém zbytku substituovány 1, 2, 3, 4 nebo 5 stejnými nebo odlišnými substituenty z množiny zahrnující hydroxylovou skupinu, atom halogenu, kyano-skupinu, trifluormethylovou skupinu, nitro-skupinu, karboxylovou skupinu, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu

obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, alkenylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 12 uhlíkových atomech, alkoxyalkoxylovou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxyskupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, skupinu $-O-CH_2/C_xF_{2x+1-g}F_g$, skupinu $-OCF_2Cl$, skupinu $-OCF_2-CH_2Cl$,

alkylkarbonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

cinnamoylovou skupinu, alkenylkarbonylovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylkarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkoxykarbonylovou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxykarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkoxykarbonylovou skupinu, ve které aralkoxylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu,

ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoyloxy-skupinu, alkenylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxykarbonyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxykarbonyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenyloxykarbonyloxy-skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinyloxykarbonyloxy-skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které arylový

zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 10 uhlíkových atomech, N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

karbamoyloxy-skupinu, N-alkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12, N-cykloalkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbamoyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, aralkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylkarbamoyloxy-skupinu, ve které

alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aryloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

aminovou skupinu, alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, dialkylaminovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylaminovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenylaminovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylaminovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, N-arylaminovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-aralkylaminovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkylaralkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových

atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylamínovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxy-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylamínovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkanoylamínovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, aroylamínovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkanoylamínovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aroyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminoalkylovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aralkanoylaminoalkylovou sku-

pinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aminoalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkylmerkpto-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfinylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, arylmerkpto-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfinylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, aralkylmerkpto-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, aralkylsulfinylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, aralkylsulfonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

sulfamoylovou skupinu, N-alkylsulfamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylsulfamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkylsulfamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylsulfamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylsulfamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylsul-

famoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylsulfamoylovou skupinu,

alkylsulfonamidovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(alkyl)-alkylsulfonamidovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkylsulfonamidovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkyl)-aralkylsulfonamidovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

nebo

R^8 a R^9 jsou také spojeny přes 3 až 6 uhlíkových atomů, přičemž $-NR^8R^9$ tvoří heterocyklický kruh s dusíkem jako heteroatomem,

nebo

R^9 znamená R^6 a

pro skupinu $/C-U/_{r-D-W}$ je vyloučen význam $-SO_2H$,

R^4 znamená alkylovou skupinu obsahující 1 až 10 uhlíkových atomů, která může být případně substituována hydroxy-skupinou nebo alkoxylovou skupinou obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, aldehydovou skupinu, imino-skupinu, N-alkylimino-

skou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, acetalovou skupinu, thioacetalovou skupinu, cyklickou acetalovou skupinu, cyklickou thioacetalovou skupinu nebo jinou skupinu ekvivalentní aldehydové skupině nebo skupinu $-CH_2OR^5$, ve které

R^5 znamená atom vodíku nebo zbytek fyziologicky snesitelné, výhodně v játrech za fyziologických podmínek odštěpitelné, ochranné skupiny alkoholové funkce,

n znamená 0 nebo 1,

f znamená 1 až 8, výhodně 1 až 5,

g znamená 0, 1 až $(2f+1)$ a

x znamená 0 až 8, výhodně 0 nebo 1.

Pod aryl-, aryloxy-, heteroaryl-, popřípadě heteroaryl-oxy-sloučeninami se rozumí sloučeniny obsahující zejména fenyl-ový, bifenylový nebo naftyl-ový kruh, popřípadě nesubstituovaný 5- nebo 6-členný heteroaromatický kruh s 1,2 nebo 3 atomy dusíku a/nebo atomy kyslíku a/nebo atomy síry, jakým je pyridyl-ový, pyridazylový, pyrimidyl-ový, pyrazyl-ový, imidazolylový, triazolylový, thienyl-ový, oxazolylový nebo thiazolylový kruh a jeho benzoanelované deriváty.

Jakožto alkohol-ochranné skupiny přicházejí zejména v úvahu substituované nebo nesubstituované methyletherové, ethyletherové, benzyletherové, silyletherové, esterové, karbonátové nebo sulfonátové skupiny. Sem spadají následující skupiny:

jako substituované methyletherové skupiny:

methoxymethyl-ová skupina, methylthiomethyl-ová skupina, terc.butylthiomethyl-ová skupina, (fenyldimethylsilyl)methoxymethyl-ová skupina, benzyloxymethyl-ová skupina, p-methoxybenzyloxymethyl-ová skupina, (4-methoxyfenoxy)methyl-ová skupina, guajakolmethyl-ová skupina, terc.butoxymethyl-ová skupina, 4-pentenylloxymethyl-ová skupina, siloxymethyl-ová skupina, 2-methoxyethoxymethyl-ová skupina, 2,2,2-trichlorethoxymethyl-ová skupina, bis(2-chlorethoxy)methyl-ová skupina, 2-(trimethylsilyl)ethoxymethyl-ová skupina, tetrahydropyranylová skupina, 3-bromtetrahydropyranylová skupina, 1-methoxycyklohexyl-ová skupina, 4-methoxytetrahydropyranylová skupina, 4-methoxytetrahydrothiopyranylová skupina, 4-methoxytetrahydrothiopyranyl-S,S-dioxo-skupina, 1-/2-chlor-4-methyl-fenyl-/4-methoxypiperidin-4-yl-ová skupina, 1,4-dioxan-2-yl-ová skupina, tetrahydrofuranylová skupina, tetrahydrothiofuranylová skupina;

jako substituované ethyletherové skupiny:

2-ethoxyethyl-ová skupina, 1-(2-chlorethoxy)ethyl-ová skupina, 1-methyl-1-methoxyethyl-ová skupina, 1-methyl-1-benzyloxyethyl-ová skupina, 1-methyl-1-benzyloxy-2-fluorethyl-ová skupina, 2,2,2-trichlorethyl-ová skupina, 2-trimethylsilylethyl-ová skupina, 2-(fenylselenyl)ethyl-ová skupina, terc.butyl-ová skupina, allyl-ová skupina, p-chlorfenyl-ová skupina, p-methoxyfenyl-ová skupina, 2,4-dinitrofenyl-ová skupina, benzylová skupina;

jako substituované benzyletherové skupiny:

p-methoxybenzylová skupina, 3,4-dimethoxybenzylová skupina, o-nitrobenzylová skupina, p-nitrobenzylová skupina, p-halogenbenzylová skupina, 2,6-dichlorbenzylová skupina, p-kyanobenzylová skupina, p-fenylbenzylová skupina, 2- a 4-pikolylová skupina, 3-methyl-2-pikolyl-N-oxido-skupina, difenylmethylová skupina, p,p'-dinitrobenzhydrylová skupina, trifenylmethylová skupina, alfa-naftyl-difenylmethylová skupina, p-methoxyfenyl-difenylmethylová skupina, di(p-methoxyfenyl)fenylmethylová skupina, tri(p-methoxyfenyl)methylová skupina, 4-(4'-bromfenacyloxy)fenyldifenylmethylová skupina, 4,4',4"-tris-(4,5-dichlorftalimidofenyl)methylová skupina, 4,4',4"-tris(levulinooxyfenyl)methylová skupina, 4,4',4"-tris(benzoyloxyfenyl)methylová skupina, 3-(imidazol-1,4'-methyl-bis(4',4"-dimethoxyfenyl)methylová skupina, 1,1-bis(4-methoxyfenyl)-1'-pyrenylmethylová skupina, 9-anthrylová skupina, 9-(9-fenyl)xanthylová skupina, 9-(9-fenyl-10-oxo)anthylová skupina;

jako silyletherové skupiny:

trimethylsilylová skupina, triethylsilylová skupina, triisopropylsilylová skupina, dimethylisopropylsilylová skupina, diethylisopropylsilylová skupina, dimethylhexylsilylová skupina, terc.butyldimethylsilylová skupina, terc.butyldifenylsilylová skupina, tribenzylsilylová skupina, tri-p-xylylsilylová skupina, trifenylsilylová skupina, difenylmethylsilylová skupina, terc.butylmethoxyfenylsilylová skupina;

jako esterové skupiny:

formiátová skupina, benzoylformiátová skupina, acetátová skupina, propionátová skupina, butyrátová skupina, valeroátová skupina, kapronátová skupina, heptanoátová skupina, kaprylátová skupina, kaprinátová skupina, laurinátová skupina, palmitátová skupina, stearátová skupina, chloracetátová skupina, dichloracetátová skupina, trichloracetátová skupina, trifluoracetátová skupina, methoxyacetátová skupina, trifenylmethoxyacetátová skupina, fenoxycetátová skupina, p-chlorfenoxycetátová skupina, p-chlorfenylacetát-

tová skupina, 3-fenylpropionátová skupina, 4-oxopentanoátová (levulinátová) skupina, 4,4-(ethyldithio)pentanoátová skupina, pivaloátová skupina, adamantoátová skupina, krotonátová skupina, 4-methoxykrotonátová skupina, benzoátová skupina, p-fenylbenzoátová skupina, 2,4,6-trimethylbenzoátová (mesitoátová) skupina, 2-methylbenzoátová skupina, 2-methylpropionátová skupina, 3-methylbutyrátová skupina, 4-methylvaleroátová skupina, 2-ethylbutyrátová skupina, a další esterové skupiny odvozené od esterů s jednou nebo vícekrát nenasycenými mastnými kyselinami, jakými jsou kyselina olejová, kyselina sorbová, kyselina linolová a kyselina linolenová, a esterů s troloxem a žlučovými kyselinami, jakými jsou například kyselina cholová, kyselina lithocholová, kyselina chenoseoxycholová a kyselina ursodesoxycholová.

Složky karboxylových kyselin mohou také obsahovat další karboxylové skupiny. V tomto případě jsou jedna nebo více karboxylových skupin esterifikovány zbytky obecného vzorce I, ve kterém R_4 znamená skupinu CH_2OH . Příklady těchto di- a polykarboxylových kyselin jsou kyselina oxalová, kyselina malonová, kyselina jantarová, kyselina maleinová, kyselina fumarová, kyselina citronová, kyselina ftalová, kyselina isoftalová, kyselina tereftalová a kyselina adipová.

jako karbonátové skupiny:

methylová skupina, 9-fluorenylmethylová skupina, ethylová skupina, 2,2,2-trichlorethylová skupina, 2-(trimethylsilyl)ethylová skupina, 2-(fenylsulfonyl)ethylová skupina, 2-(trifenylfosfonio)ethylová skupina, isobutylová skupina, vinylová skupina, allylová skupina, p-nitrofenylová skupina, benzylová skupina, p-methoxybenzylová skupina, 3,4-dimethoxybenzylová skupina, o-nitrobenzylová skupina, p-nitrobenzylová skupina, S-benzylthiokarbonátová skupina, 4-ethoxy-1-naftylová skupina, methyldithiokarbonátová skupina;

jako další esterové skupiny:

2,6-dichlor-4-methylfenoxyacetátová skupina, 2,6-dichlor-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)fenoxyacetátová skupina, 2,4-bis(1,1-dimethylpropyl)fenoxyacetátová skupina, chlordinfenylacetátová skupina, isobutyrátová skupina, monosukcinátová skupina, (E)-2-methylbutenoátová

(tigloátová) skupina, O-(methoxykarbonyl)benzoátová skupina, p-P-benzoátová skupina, alfa-naftoátová skupina, nitrátová skupina, alkyl-N,N,N',N'-tetramethylfosforodiamidátová skupina, N-fenylkarbamátová skupina, borátová skupina, dimethylfosfinothioylová skupina, 2,4-dinitrofenylsulfenátová skupina;

jako sulfonátové skupiny:

sulfátová skupina, methansulfonátová (mesylátová) skupina, benzylsulfonátová skupina, tosylátová skupina.

Obzvláště výhodnými jsou následující ochranné skupiny:

alkanoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, alkenoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, alkinoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, alkylkarbamoylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů, dialkylkarbamoylová skupina, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylová skupina, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkoxykarbonylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů, aryloxykarbonylová skupina, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxykarbonylová skupina, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, zejména benzyloxykarbonylový zbytek, arylkarbonylová skupina, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonylová skupina, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, alkylová skupina obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, případně substituovaná aralkylová skupina obsahující 7 až 18 uhlíkových atomů, alkoxyalkylová skupina, ve které alkoxylový zbytek a alkylový zbytek obsahují po 1 až 12 uhlíkových atomech, karbamoylalkylesterová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, acyloxyalkylová skupina, ve které acylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, výhodně alkanoyloxyalkylová skupina, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxykarbonyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových

atomů, alkoxykarbonyloxyalkylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, přičemž tyto skupiny mohou případně nésti další substituenty, tetrahydropyranylová skupina, skupiny odvozené od esterů aminokyselin nebo esterů s polypeptidy a polypeptidovými deriváty, výhodně s di- a tripeptidy, které jsou zejména esterifikovány na jejich koncové karboxylové skupině.

Ze složek, které zahrnují aminokyseliny, jsou výhodné zejména přírodní alfa-aminokyseliny, přičemž jejich amino-skupina může být derivatizována ochrannými skupinami aminové funkce.

Pod amino-ochrannými skupinami se zde rozumí zejména skupiny, které jsou popsány R.Geiger-em a W.König-em v "The Peptides", sv.3, "Protection of functional Groups in Peptide Synthesis", E. G.Gross, J.Meienhofer Edit, Academic Press, New York (1981), zejména str. 7-46.

Takové skupiny jsou rovněž popsány A. Hubbuch-em v Schutzgruppen in der Peptidsynthese, Kontakte 3/79, str. 14-23.

Obzvláště výhodnými amino-ochrannými skupinami jsou:

acetaamidomethylová skupina,
1-adamantyloxykarbonylová skupina,
1-(1-adamantyl)-1-methylethoxykarbonylová skupina,
allyloxykarbonylová skupina,
terc.butyloxykarbonylová skupina,
1-(4-bifenylyl)-1-methylethoxykarbonylová skupina,
alfa,alfa-dimethyl-3,5-dimethoxybenzyloxykarbonylová skupina,
4-dihydroxyborylbenzyloxykarbonylová skupina,
9-fluorenylmethyloxykarbonylová skupina,
isobornyloxykarbonylová skupina,
1-methylcyklobutyloxykarbonylová skupina,
4-methoxybenzyloxykarbonylová skupina,
methylsulfonylethyloxykarbonylová skupina,
4-Pyridylmethyloxykarbonylová skupina,
2,2,2-trichlor-terc.butyloxykarbonylová skupina,
benzyloxykarbonylová skupina,

halogenem substituovaná benzyloxykarbonylová skupina,
4-nitrobenzyloxykarbonylová skupina,
2-fosfonoethyloxykarbonylová skupina,
fenylsulfonylethoxykarbonylová skupina,
toluensulfonylethoxykarbonylová skupina a
2,3,5-trimethyl-4-methoxyfenylsulfonylová skupina.

Výhodnými sloučeninami podle vynálezu jsou sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém

X znamená jednoduchou vazbu a Y znamená skupinu $-\text{SO}_2-$ nebo $-\text{CO}-$ nebo

X znamená skupinu $-\text{CO}-$ a Y znamená skupinu $-\text{SO}_2-$, $-\text{CO}-$ nebo $-\text{CONR}^9$, přičemž

R^1 , R^2 a R^3 , které jsou stejné nebo odlišné, znamenají atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, atom halogenu, zejména atom fluoru a atom chloru, hydroxy-skupinu, aminovou skupinu nebo hydroxyalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy,

R^6 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů nebo N-ochrannou skupinu, jakou je acylová skupina, alkanoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, alkenoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, alkinoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, aralkanoylová skupina obsahující 7 až 20 uhlíkových atomů, aroylová skupina obsahující 6 až 18 uhlíkových atomů, alkylkarbamoylová skupina, ve kterém alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxykarbonylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxykarbonylová skupina, acyloxyalkylová skupina, ve které acylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, výhodně alkanoyloxyalkylová skupina, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzoyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxykarbonyloxyalkylová skupina,

ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů nebo alkoxykarbonyloxyalkylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, fyziologicky použitelný kationt, jako Na^+ , K^+ , Mg^{2+} , Ca^{2+} , Al^{3+} nebo amoniový iont, případně jednou až třikrát substituovaný alkylovou skupinou obsahující 1 až 16 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinou, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 16 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinou, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 16 uhlíkových atomů, fenylovou skupinou, benzylovou skupinou nebo alkylovou skupinou, která může být jednou až třikrát substituována hydroxyskupinou nebo alkoxylovou skupinou obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, nebo kationt báze derivátu aminokyseliny, přičemž arylový zbytek může být případně substitován,

R^7 znamená skupinu YR^8 ,
ve které

Y má výše uvedený význam a

R^8 a R^9 znamenají skupinu $/\text{C-U}/_x\text{-D-W}$, ve které

C znamená vazbu nebo

rozvětvenou nebo nerozvětvenou alifatickou alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, rozvětvenou nebo nerozvětvenou alkendiylovou skupinu obsahující 2 až 12 uhlíkových atomů, alkindiylovou skupinu obsahující 2 až 12 uhlíkových atomů nebo alkenindiylovou skupinu obsahující 2 až 12 uhlíkových atomů, která může obsahovat jednu nebo více vícenásobných vazeb uhlík-uhlík,

Z znamená vazbu nebo

atom vodíku nebo heteroatomovou skupinu z množiny zahrnující skupinu $-(\text{CO})\text{NR}-$, skupinu $-\text{NR}(\text{CO})-$, skupinu $-\text{O}-$, skupinu $-\text{SO}-$ a skupinu $-\text{SO}_2-$, kde R znamená alkylovou skupinu obsahující 1 až 3 uhlíkové atomy, alkanoylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, aralkanoylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, aroylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů nebo atom vodíku,

r znamená 1 nebo 2,

D znamená vazbu nebo
atom vodíku nebo
rozvětvenou nebo nerozvětvenou alifatickou alkandi-
ylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů
nebo
rozvětvenou nebo nerozvětvenou alkendiylovou skupinu
obsahující 2 až 6 uhlíkových atomů nebo
alkendiylovou skupinu obsahující 2 až 8 uhlíkových
atomů a

W znamená
atom vodíku nebo cykloalifatickou alkylovou, alkeny-
lovou, alkinylovou nebo alkeninylovou skupinu obsahu-
jící 3 až 10 uhlíkových atomů nebo
arylovou skupinu obsahující 6 až 16 uhlíkových atomů
nebo 5- nebo 6-člennou heteroarylovou skupinu,
příčemž alespoň jeden z obecných substituentů C nebo
D nebo W neznámá vazbu a U znamená heteroatomovou
skupinu pouze tehdy, kdy C neznámá vazbu, a
C, D a/nebo W, pokud neznámají vazbu nebo atom vo-
díku, jsou samy o sobě výhodně substituovány kombinací až
5 stejných nebo odlišných substituentů z množiny zahrnující
hydroxylovou skupinu, atom halogenu, kyslo-
skupinu, trifluormethylovou skupinu, nitro-skupinu,
karboxylovou skupinu, alkylovou skupinu obsahující
1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu
obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, arylovou skupinu
obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylovou
skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, alkeny-
lovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů,
alkinylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových
atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíko-
vých atomů, alkoxyalkylovou skupinu, ve které alkoxy-
lový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 12 uhlíko-
vých atomech, alkoxyalkoxylovou skupinu, ve které
každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových
atomů, aryloxyskupinu, ve které arylový zbytek obsa-
huje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxy-skupinu,
ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíko-
vých atomů, hydroxyalkylovou skupinu, ve které alky-

lový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, skupinu $-O-CH_2/x C_f H_{(2f+1-g)} F_g$, skupinu $-OCF_2Cl$, skupinu $-OCF_2-CHFC1$,

alkylkarbonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoylovou skupinu, alkenylkarbonylovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylnkarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkoxykarbonylovou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxykarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkoxykarbonylovou skupinu, ve které aralkoxylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoyloxy-skupinu, alkenylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylnkarbonyloxy-skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 10 uhlíkových atomech, N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

aminovou skupinu, alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů,

dialkylaminovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylaminovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenylaminovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylaminovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, N-arylaminovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-aralkylaminovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkylaralkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxy-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkanoylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aroyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkanoyl-N-alkylaminovou

skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminoalkylovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aralkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aminoalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkylmerkpto-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfinylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, arylmerkpto-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfinylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, aralkylmerkpto-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, aralkylsulfinylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16

uhlíkových atomů, aralkylsulfonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

příčemž skupiny, které obsahují arylový zbytek, mohou být samy o sobě a arylovém zbytku substituovány 1, 2, 3, 4 nebo 5 stejnými nebo odlišnými substituenty z množiny zahrnující atom vodíku, hydroxylovou skupinu, atom halogenu, kyano-skupinu, tri-fluormethylovou skupinu, nitro-skupinu, karbo-xylovou skupinu, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, alkenylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 12 uhlíkových atomech, alkoxyalkoxylovou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxyskupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, skupinu $-O-CH_2/xC_fH_{(2f+1-g)}F_g$, skupinu $-OCF_2Cl$, skupinu $-OCF_2-CHFCl$,

alkylkarbonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoylovou skupinu, alkenylkarbonylovou skupinu,

ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylkarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkoxykarbonylovou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxykarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkoxykarbonylovou skupinu, ve které aralkoxylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoyloxy-skupinu, alkenylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které arylový

zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkyl-karbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 10 uhlíkových atomech, N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

aminovou skupinu, alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, dialkylaminovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylaminovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenylaminovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylaminovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, N-arylaminovou skupinu, ve které arylový zbytek obsa-

huje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-aralkylaminovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkylaralkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 5 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl - arylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 5 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxy-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkanoylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aroyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový

zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminoalkylovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aralkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aminoalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkylmerkpto-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfinylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, arylmerkpto-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfinylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, aralkylmerkpto-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, aralkylsulfinylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, aralkylsulfonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

nebo

R^8 a R^9 jsou také spojeny přes 3 až 6 uhlíkových atomů, přičemž $-NR^8R^9$ tvoří heterocyklický kruh s dusíkem jako hetero-

atomem,

nebo

R^9 znamená R^6

a pro skupinu $/C-U/_{R^4}-D-W$ je vyloučen význam $-SO_2H$,

R^4 znamená methylovou skupinu nebo skupinu $-CH_2OR^5$, ve které
 R^5 znamená atom vodíku nebo zbytek fyziologicky snesitelné, výhodně v játrech za fyziologických podmínek odštěpitelné, ochranné skupiny alkoholové funkce,

n znamená 0 nebo 1,

f znamená 1 až 8, výhodně 1 až 5,

g znamená 0, 1 až $(2f+1)$ a

x znamená 0 až 8, výhodně 0 nebo 1.

Obzvláště výhodnými jsou následující ochranné skupiny:

alkanoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, alkenoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, alkinoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, alkylkarbamoylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů, dialkylkarbamoylová skupina, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylová skupina, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkoxykarbonylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů, aryloxykarbonylová skupina, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxykarbonylová skupina, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, zejména benzyloxykarbonylová skupina, arylkarbonylová skupina, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonylová skupina, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, alkylová skupina obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, případně substituovaná benzylová skupina, alkoxyalkylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, karbamoylalkylesterová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, acyloxyalkylová skupina, ve které acylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových

atomů, výhodně alkanoyloxyalkylová skupina, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxykarbo-nyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxykarbo-nyloxyalkylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, přičemž tyto skupiny mohou případně nést i další substituenty, tetrahydropyranylová skupina, skupiny odvozené od esterů aminokyselin nebo esterů s polypeptidy nebo polypeptidovými deriváty, výhodně s di- a tripeptidy, které jsou zejména esterifikovány na jejich koncové karboxylové skupině.

Obzvláště výhodnými sloučeninami podle vynálezu jsou sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém

- A znamená R^3 a B znamená skupinu $-XNR^6R^7$,
- X znamená jednoduchou vazbu a Y znamená skupinu $-SO_2-$ nebo CO nebo
- X znamená skupinu CO a Y znamená skupinu $-SO_2$ nebo $-CONR^9$ a R^1, R^2 a R^3 , které jsou stejné nebo odlišné, znamenají atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 3 uhlíkové atomy, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 3 uhlíkové atomy, hydroxy-skupinu, atom fluoru nebo atom chloru,
- R^6 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů nebo N-ochrannou skupinu, jakou je acylová skupina, alkanoylová skupina obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, alkenoylovou skupinu obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, případně substituovanou benzoylovou skupinu, 1-, 2-, 3- nebo 4-mocný fyziologicky použitelný kationt, zejména Na^+ , K^+ , Ca^{2+} , Mg^{2+} , Al^{3+} nebo amoniový aniont, případně jednou až třikrát substituovaný alkylovou skupinou obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinou obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinou, ve které alkoxylový zbytek obsahuje

1 až 4 uhlíkové atomy a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, fenylou skupinou, benzylovou skupinou nebo alkylovou skupinou obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, která může být jednou až třikrát substituována hydroxy-skupinou nebo alkoxylovou skupinou obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, přičemž arylový zbytek může být případně substituován, nebo kationt báze derivátu aminokyseliny,

R⁷

znamená skupinu YR⁸, ve které

Y má výše uvedený význam a

R⁸ znamená skupinu /C-U/_r-D-W, ve které

C znamená vazbu nebo alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů,

U znamená vazbu nebo atom vodíku nebo -O-,

r znamená 1,

D znamená vazbu nebo atom vodíku nebo nerozvětvenou alifatickou alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů a

W znamená atom vodíku, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů nebo 5- nebo 6-člennou heteroarylovou skupinu, přičemž alespoň jeden z obecných substituentů C nebo D nebo W neznámá vazbu a U znamená heteroatomovou skupinu pouze tehdy, když C neznámá vazbu nebo když D a/nebo W neznámají vazbu, a W, pokud W neznámá atom vodíku, je výhodně sám o sobě substituován až 3 stejnými nebo různými substituenty zvolenými z množiny zahrnující hydroxylovou skupinu, atom halogenu, kyano-skupinu, trifluormethylovou skupinu, nitro-skupinu, karboxylovou skupinu, alkylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, alkenylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, alkinylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aryloxy-skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aral-

kyloxy-skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, skupinu $-O-/CH_2/xC_fH_{(2f+1-G)}F_g'$, alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aryloxykarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkoxykarbonylovou skupinu, ve které aralkoxylový zbytek obsahuje 7 až 14 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoyloxy-skupinu,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkylarylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkylaralkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)-karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)-

karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

aminovou skupinu, alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, dialkylaminovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkylaminovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylaminovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-aralkylaminovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 3 uhlíkové atomy a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů,

alkanoylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkanoylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aroyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminoalkylovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, aralkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,

alkylmerkpto-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, alkylsulfinylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, alkylsulfonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, arylmerkpto-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, arylsulfinylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, arylsulfonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylmerkpto-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 14 uhlíkových atomů, aralkylsulfinylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 14 uhlíkových atomů, aralkylsulfonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 14 uhlíkových atomů,

přičemž skupiny, které obsahují arylový zbytek, mohou být samy o sobě na arylovém zbytku substituovány 1, 2, 3, 4 nebo 5 stejnými nebo odlišnými substituenty zvolenými z množiny zahrnující atom vodíku, hydroxylovou skupinu, atom halogenu, kyano-skupinu, trifluormethylovou skupinu, nitro-skupinu, karboxylovou skupinu, alkylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, alkenylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylovou skupinu obsahující

3 až 12 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, aryloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, skupinu $-O-/CH_2/xC_fH_{2f+1-g})F_g$, alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkylarylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkylaralkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)-karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)-

karbamoylovou skupinu, ve které první alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a druhý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které první alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a druhý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které první alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a druhý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,

aminovou skupinu, alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, dialkylaminovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, cykloalkylaminovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylaminovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-aralkylaminovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkylaralkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 3 uhlíkové atomy a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkylarylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 3 uhlíkové atomy a arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů,

alkanoylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkanoylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 12 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,

cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, aroyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,

alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, cykloalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, aroylaminoalkylovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, aralkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy,

R^9 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, fenylovou skupinu, která je případně jednou substituována, nebo

R^8 a R^9 jsou spojeny přes skupinu $(-CH_2-)_i$, přičemž $-NR^8R^9$ tvoří kruh a i může znamenat 3, 4, 5 nebo 6, a

pro skupinu $/C-U/_R-D-W$ je vyloučen význam $-SO_2H$,

R^4 znamená methylovou skupinu nebo skupinu $-CH_2OR^5$, ve které
 R^5 znamená atom vodíku nebo zbytek fyziologicky snesitelné, výhodně v játrech za fyziologických podmínek odštěpitelné, ochranné skupiny alkoholové funkce,

n znamená 0 nebo 1,

f znamená 1 až 8, výhodně 1 až 5,

g znamená 0, 1 až $(2f+1)$ a

x znamená 0 až 8, výhodně 0 nebo 1.

Obzvláště výhodné jsou následující ochranné skupiny:

alkanoylová skupina s 1 až 18 uhlíkovými atomy, alkenoylová skupina obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, alkylkarbamoylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů, dialkylkarbamoylová skupina, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylová skupina, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkoxykarbonylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů, aryloxykarbonylová skupina, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxykarbonylová skupina, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, zejména benzyloxykarbonylová skupina, arylkarbonylová skupina, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonylová skupina, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, alkylová skupina obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, karbamoylalkylesterová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, acyloxyalkylová skupina, ve které acylová skupina obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, výhodně alkanoyloxyalkylová skupina, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 18 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxykarbonyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxykarbonyloxyalkylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, přičemž tyto skupiny mohou případně nést i další substituenty, skupiny odvozené od esterů aminokyselin nebo tetrahydropyranylová skupina.

Zcela mimořádně výhodnými sloučeninami podle vynálezu jsou sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém

- A znamená R^3 a B znamená skupinu $-XNR^6R^7$,
- X znamená jednoduchou vazbu a Y znamená skupinu $-SO_2-$ nebo
- X znamená skupinu $-CO-$ a Y znamená skupinu $-SO_2-$ nebo $-CONR^9$,
- R^1, R^2 a R^3 znamenají atom vodíku,
- R^6 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů nebo acylovou skupinu, jakou je alkanoylová skupina obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, alkenoylová skupina obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů nebo případně substituovaná benzoylová skupina, nebo 1-, 2- nebo 3-mocný fyziologicky použitelný kationt, zejména Na^+ , K^+ , Mg^+ , Ca^+ nebo amoniový iont, případně jednou až třikrát substituovaný alkylovou skupinou obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinou obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinou, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, fenylovou skupinou, benzylovou skupinou nebo alkylovou skupinou obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, která může být jednou až třikrát substituována hydroxy-skupinou nebo alkoxylovou skupinou obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy, jako například $NH_3^+C(CH_2OH)_3$ nebo kationt báze derivátu aminokyseliny,
- R^7 znamená skupinu YR^8 s výjimkou $-SO_2H$, ve které
-
- Y má výše uvedený význam a
- R^8 znamená skupinu $/C-U/_r-D-W$, ve které
- C znamená vazbu nebo alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy,
- U znamená vazbu, atom vodíku nebo $-O-$,
- r znamená 1,
- D znamená vazbu, atom vodíku nebo alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkové atomy,
- W znamená atom vodíku nebo fenylovou skupinu, přičemž alespoň jeden z obecných substituentů C nebo D nebo W neznámá vazbu a U znamená $-O-$ pouze tehdy, kdy C nezna-

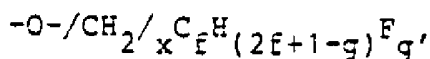
mená vazbu a W je substituován substituenty zvolenými z množiny zahrnující atom vodíku, atom fluoru, atom chlóru, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, alkenylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, fenylovou skupinu, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, fenoxyskupinu, $-O-CH_2-C_xF_{2f+1-g}F_g$, karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-fenylkarbamoylovou skupinu, N-fenylalkylkarbamoylovou skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-fenylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů,

N-alkyl-N-fenylalkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-(fenoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-(fenylalkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(fenoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každá alkylová skupina obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(fenylalkyloxyalkyl)karbamoylová skupina, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových

atomů a fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

alkanoylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, fenylaminovou skupinu, fenylalkanoylaminovou skupinu, ve které fenylalkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, fenylalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které fenylalkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, fenylaminoalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, fenylalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které fenylalkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů,

přičemž skupiny, které obsahují arylový zbytek, mohou být samy o sobě substituovány na arylovém zbytku 1, 2, 3, 4 nebo 5 stejnými nebo odlišnými substituenty zvolenými z množiny zahrnující hydroxylovou skupinu, karboxylovou skupinu, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy, fenoxyskupinu, benzyloxy-skupinu, atom fluoru, atom chloru, trifluormethylovou skupinu, skupinu



alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 9 uhlíkových atomů, fenoxycarbonylovou skupinu, fenylalkoxykarbonylovou skupinu, ve které fenylalkoxylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, benzyloxy-skupinu, fenylalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů,

alkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, fenoxycarbonyloxy-skupinu, fenylalkyloxykarbonyloxy-skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-fenylkarbamoylovou skupinu, N-fenylalkylkarbamoylovou skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, hydroxyalkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, acyloxyalkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy,

karbamoyloxy-skupinu, N-alkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylový zbytek, ve kterém cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

- R^9 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy nebo fenylovou skupinu,
- R^4 znamená skupinu $-CH_2OR^5$, ve které
- R^5 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, případně substituovanou benzylovou skupinu, alkanoylovou skupinu obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, alkenoylovou skupinu obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů nebo případně substituovanou benzoylovou skupinu,
- n znamená 0,
- f znamená 1 až 5,
- g znamená 0,1 až $(2f+1)$ a
- x znamená 0 nebo 1.

Velký význam mají sloučeniny podle vynálezu obecného vzorce I, ve kterém

- A znamená R^3 a B znamená $-XNR^6R^7$,
- X znamená skupinu $-CO-$,
- R^1 , R^2 a R^3 znamenají atom vodíku,
- R^6 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, alkanoylovou skupinu obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, alkenoylovou skupinu obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, benzoylovou skupinu nebo 1- nebo 2-mocný fyziologicky použitelný kationt, zejména Na^+ , K^+ , Mg^+ nebo Ca^+ nebo amoniový iont, případně jednou až třikrát substituovaný alkylovou skupinou obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinou obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinou, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, fenylovou skupinou, benzylovou skupinou nebo alkylovou skupinou obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, která může být případně jednou až třikrát substituována hydroxy-skupinou nebo alkoxylovou skupinou obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy,

- R⁷ znamená skupinu YR⁸ s výjimkou -SO₂H, ve které
- Y znamená skupinu -SO₂- a
- R⁸ znamená skupinu /C-U/_r-D-W, ve které
- C znamená vazbu nebo přímou alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy,
- U znamená vazbu, atom vodíku nebo -O-,
- r znamená 1,
- D znamená vazbu, atom vodíku nebo přímou alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy,
- W znamená atom vodíku nebo fenylovou skupinu, přičemž alespoň jeden z obecných substituentů C nebo D nebo W neznámá vazbu a U znamená -O- pouze tehdy, kdy C neznámá vazbu a

W je substituován substituenty zvolenými z množiny zahrnujícími atom vodíku, atom fluoru, atom chloru, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, fenyalkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, fenylovou skupinu, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, fenoxyskupinu, skupinu -O-/CH₂/_xC_fH^(ěf+1-g)F_g,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-fenylkarbamoylovou skupinu, N-fenylalkylkarbamoylovou skupinu, ve které fenyalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkyl-

N-fenylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-fenylalkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a fenyalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 3 uhlíkové atomy a alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, N-

(fenoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-(fenylalkyloxyalkyl)-karbamoylovou skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 1 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které první alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 3 uhlíkové atomy a druhý alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, N-alkyl-N-(fenoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které první alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a druhý alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, N-alkyl-N-(fenylalkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které první alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a druhý alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy,

alkanoylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, fenylaminovou skupinu, fenylalkanoylaminovou skupinu, ve které fenylalkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, fenylalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které fenylalkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,

alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 nebo 2 uhlíkové atomy, cykloalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje

3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 nebo 2 uhlíkové atomy, benzoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 nebo 2 uhlíkové atomy, fenylalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které fenylalkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 nebo 2 uhlíkové atomy,

příčemž skupiny, které obsahují arylový zbytek, mohou být samy o sobě substituovány na arylovém zbytku 1, 2, 3, 4 nebo 5 stejnými nebo odlišnými substituenty zvolenými z množiny zahrnující hydroxy-skupinu, karboxylovou skupinu, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, fenoxi-skupinu, benzyloxy-skupinu, atom fluoru, atom chlóru, trifluomethylovou skupinu,

alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 9 uhlíkových atomů, fenoxycarbonylovou skupinu, fenylalkoxykarbonylovou skupinu, ve které fenylalkoxylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, benzoyloxy-skupinu, fenylalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-fenylkarbamoylovou skupinu, N-fenylalkylkarbamoylovou skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, hydroxyalkylkar-

bamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, acyloxyalkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy,

karbamoyloxy-skupinu, N-alkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

R^4 znamená skupinu $-CH_2OR^5$, ve které

R^5 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, případně substituovanou benzylovou skupinu, alkanoylovou skupinu obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, alkenoylovou skupinu obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů nebo případně substituovanou benzoylovou skupinu,

n znamená 0,

f znamená 1 až 5,

g znamená 0, 1 až $(2f+1)$ a

x znamená 0 nebo 1.

Vynález se dále týká použití sloučenin obecného vzorce I a jejich fyziologicky přijatelných solí pro výrobu léčiva proti fibrosním chorobám.

Vynález se konečně týká sloučenin obecného vzorce I pro použití ve funkci léčiv.

Zejména se vynález týká sloučenin obecného vzorce I pro použití ve funkci fibrosupresiv.

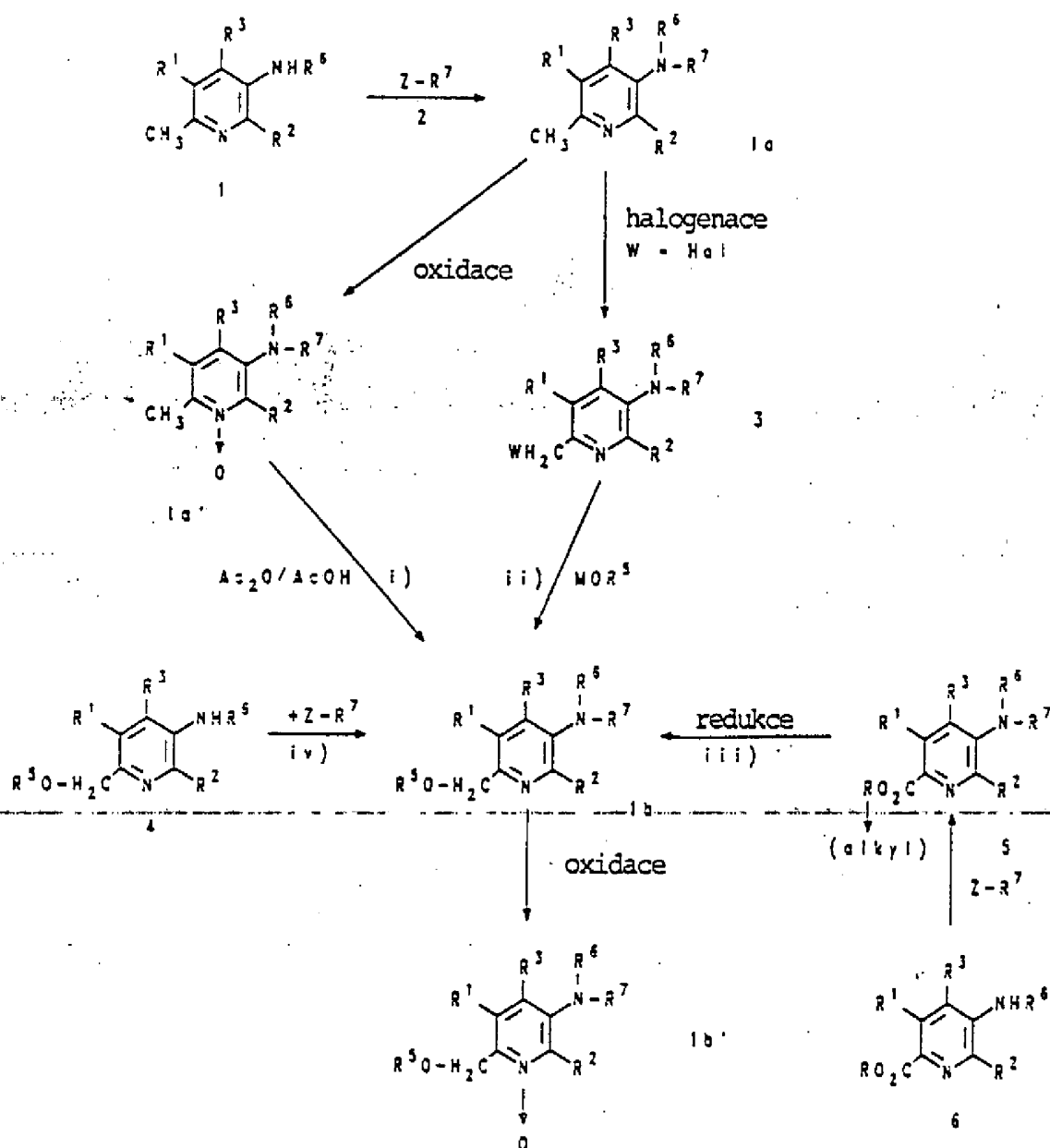
Vynález se rovněž týká způsobu přípravy sloučenin obecného vzorce I.

Sloučeniny obecného vzorce Ib, ve kterých X znamená jednoduchou vazbu a R^4 znamená CH_2OR^5 , se připraví tak, že se

- i) 2-methylpyridin-N-oxid obecného vzorce Ia' uveďte v reakci v kyselém prostředí s anhydridem nebo se
- ii) 2-halogenmethylpyridin obecného vzorce 3 uveďte v reakci se sloučeninou obecného vzorce MOR⁵ nebo se
- iii) redukuje derivát pyridin-2-karboxylové kyseliny obecného vzorce 5 nebo se
- iv) derivát 2-hydroxymethylpyridinu obecného vzorce 4 uveďte v reakci s derivátem sulfonové kyseliny obecného vzorce 2.

V následujícím reakčním schématu 1 je schematicky znázorněna příprava sloučenin obecných vzorců Ia, Ia', Ib a Ib', ve kterých X znamená jednoduchou vazbu.

Reakční schema 1



Sloučeniny obecného vzorce 1 se uvedou v reakci s deriváty sulfonových nebo karboxylových kyselin obecného vzorce 2, ve kterém Z znamená odlučitelnou skupinu, která je nukleofilně oddělitelná a která zejména znamená F, Cl, Br nebo J nebo tosylátovou skupinu, za vzniku sloučenin obecného vzorce Ia, ve kterých R_4 znamená methylovou skupinu. Tato reakce se provádí v dipolárním aprotickém organickém rozpouštědle nebo ve směsi rozpouštědel. Zejména lze uvést následující rozpouštědla: dichlormethan, tetrachlormethan, butylacetát, ethylacetát, toluen, tetrahydrofuran, dimethoxyethan, 1,4-dioxan, acetonitril, N,N-dimethylformamid, N,N-dimethylacetamid, dimethylsulfoxid, nitromethan a/nebo pyridin. Reakce se případně provádí v přítomnosti činidla vázajícího kyselinu, jakým je například amoniak, triethylamin, tributylamin, a při teplotě 0 až 180 °C, výhodně při teplotě 0 až 80 °C.

Potom se případně provede ještě oxidace na pyridin-N-oxidy obecného vzorce Ia'.

Obecné podmínky této oxidační reakce jsou například popsány také v "E.Klinsberg, Pyridine and its Derivatives, Interscience Publishers, New York, 1961, část 2,93". Oxidace za použití peroxidu vodíku je například popsána v "E.Ochiai, J.Org.Chem.18, 534 (1953)". Detailní reakční podmínky jsou popsány v německých patentových přihláškách P 38 26 471.4, 38 28 140.6, 39 24 093.2, 40 01 002.3, DE-A-37 03 959, 37 03 962 a 37 03 963.

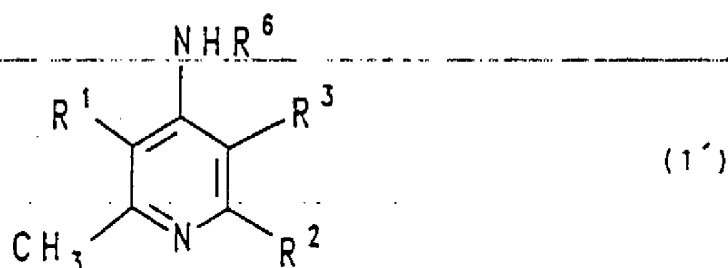
Pokud mají být připraveny sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých R^4 znamená $-CH_2OR^5$ (zde sloučeniny obecného vzorce Ib, popřípadě Ib'), potom se sloučeniny obecného vzorce Ia (2-pikoliny) halogenují N-halogenamidy, jakými jsou N-bromsukcinimid nebo N-chlorftalimid, nebo kyselinou trichlorisokyanurovou (Chem.Ber. 120, 649-651 (1987)).

Reakce 2-pikolilhalogenidů obecného vzorce 3 s bázemi obecného vzorce MOR^5 se provádí obvyklými postupy a vede ke sloučeninám obecného vzorce Ib. Tento způsob přípravy je popsán v patentovém spisu P 41 36 346.9. Potom může být provedena

oxidace na odpovídající pyridin-N-oxidy obecného vzorce Ib' (viz oxidace na sloučeniny obecného vzorce Ia').

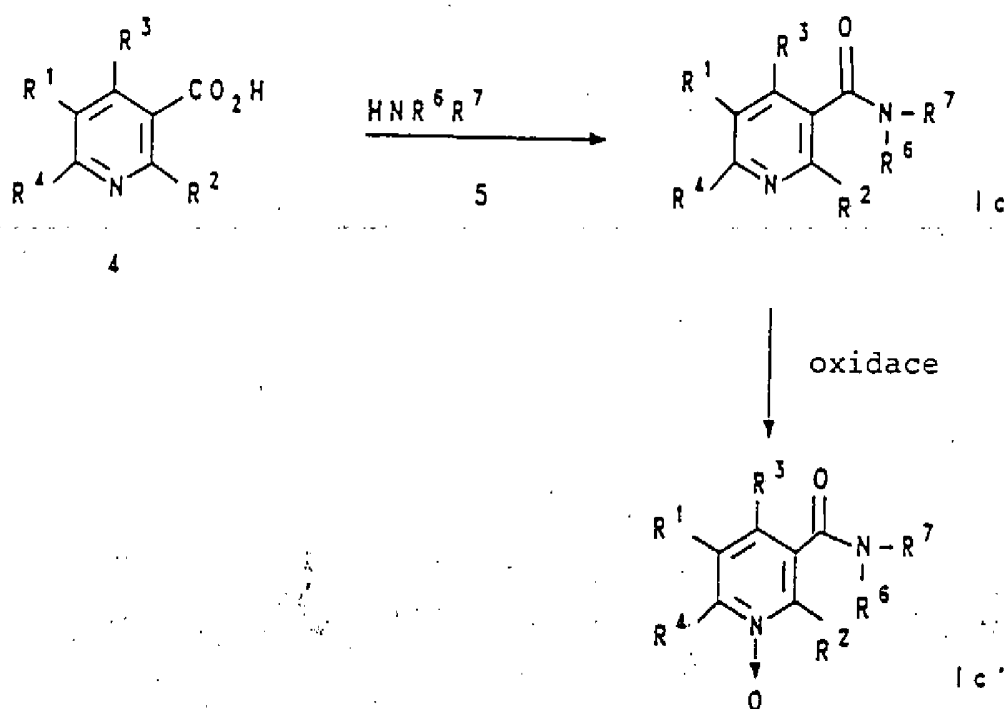
Sloučeniny obecného vzorce Ib mohou být také připraveny konverzí pyridin-N-oxidů obecného vzorce Ia' (postup i) v reakčním schematu 1). Tato konverze se provádí za použití trifluoracetanhydridu při teplotě 0 °C nebo za použití acetanhydridu, případně v přítomnosti kyseliny, jakou je kyselina octová, při teplotě 80 až 120 °C a získají se při ní acetáty (obecný vzorec Ib, ve kterém $R^5 = \text{Ac}$). Tato konverze je také popsána A.R.Katritzky-m a J.M.Lagowskim v Chemistry of the Heterocyclic N-Oxides, Academic Press, New York, 1972, IV.2, str.352-365. Následné zmýdelnění na sloučeniny obecného vzorce Ib, ve kterých $R^5 = \text{H}$ se provádí o sobě známým způsobem. K tomu se zejména použijí hydroxidy nebo uhličitany alkalických kovů v methanolu, ethanolu, vodě nebo podobných rozpouštědlech.

Výše popsaná reakční sekvence podle reakčního schematu 1 pro výrobu sloučenin obecných vzorců Ia, Ia', Ib a Ib', majících v poloze 5 skupinu NR^6YR^8 , může být také použita pro přípravu uvedených sloučenin, které mají tuto skupinu v poloze 4. Potom se vychází ze sloučenin obecného vzorce 1' :



Následující reakční schema 2 schematicky znázorňuje přípravu sloučenin obecného vzorce Ic nebo Ic', ve kterých X znamená skupinu -CO-.

Reakční schema 2



Sloučeniny obecného vzorce 4, ve kterých R^4 znamená me-⁵thylovou skupinu a skupinu $-\text{CH}_2-\text{OR}^5$, jsou popsány T.Sugiyama-ou a kol. v Chem.Lett.1982,917-920 a J.K.Seydel-em a kol. v J.Med.Chem. 1976,19,483-493.

Reakce sloučenin obecného vzorce 4 s amidy obecného vzorce 5 se provádí za podmínek, uvedených v "Houben-Weyl: Methoden der organischen Chemie, sv.IX,kap.19, str.636-637. Může být výhodné aktivovat obě reakční složky pomocnými činidly.

Jako pomocná činidla pro aktivaci karboxylových kyselin mohou být použity o sobě známé látky, jako například thionylchlorid, oxalylchlorid, pivaloylchlorid, N,N-karbonyldiimidazol nebo deriváty esterů kyseliny chlormravenčí. Není vždy nutné izolovat tyto aktivované deriváty sloučenin obecného vzorce 4. Většinou je účelné uvést je v reakci s amidy obecného vzorce 5 po přípravě in situ nebo ve formě surového produktu.

Výhodně se sloučeniny obecného vzorce 5 uvedou nejdříve v reakci s anorganickou nebo organickou bází, jakou je například hydroxid sodný, hydroxid draselný, terc.butoxid draselný, uhličitán draselný, alkoxid draselný, hydrid draselný, amid draselný, amoniak, triethylamin, tributylamin a pyridin, při teplotě -20 až 150 °C, výhodně 0 až 80 °C, a tato reakční směs se teprve uvede v reakci se sloučeninou obecného vzorce 4 nebo její aktivovanou formou. Tato reakce se provádí v inertním rozpouštědle, jakým je methylenchlorid, methanol, ethanol, aceton, ethylacetát, toluen, tetrahydrofuran, acetonitril, N,N-dimethylformamid, N,N-dimethylacetamid, nitromethan, dimethylsulfoxid nebo směs těchto rozpouštědel.

Jako další způsob přípravy sloučenin podle vynálezu obecného vzorce Ic může být použita kondenzace sloučenin obecného vzorce 4 s deriváty amidů sulfonových nebo karboxylových kyselin obecného vzorce 5 za použití N,N'-dicyklohexylkarbodiimidu a 4-N,N-dimethylaminopyridinu, jak je to popsáno v J.Med.Chem. 1992, 35, 800-804 pro přípravu 5-sulfonylimidů 2-methylesteru pyridin-2,5-dikarboxylové kyseliny.

Rovněž mohou být použity další kondenzační postupy a kondenzační činidla známé z chemie peptidů.

Sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých R^4 znamená $-CH_2OR^5$, X znamená skupinu $-CO-$ a Y znamená skupinu SO_2 , mohou být připraveny tak, že se

- i) 6-halogenmethypyridinové deriváty obecného vzorce 12 uvedou v reakci s reakčními činidly obecného vzorce MOR^5 nebo se
- ii) 6-hydroxymethypyridinové deriváty obecného vzorce 13 uvedou v reakci se sulfonamidovými deriváty obecného vzorce 9 nebo se
- iii) deriváty amidu 6-hydroxymethypyridin-3-karboxylové kyseliny obecného vzorce 15 uvedou v reakci s deriváty sulfonových kyselin obecného vzorce 2 nebo se

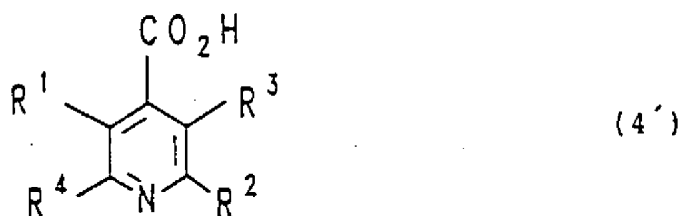
iv) pyridin-2-karbonové kyseliny nebo odpovídající estery obecného vzorce 14 podrobí redukci,

přičemž samotné sloučeniny obecného vzorce 13, popřípadě 15 mohou být připraveny o sobě známými postupy ze sloučenin obecného vzorce 6.

Následující reakční schema 3 schematicky znázorňuje přípravu sloučenin obecného vzorce Id nebo Id', ve kterých X znamená skupinu -CO- a Y znamená skupinu SO₂.

Další reakce vedoucí k pyridin-N-oxidům obecného vzorce Ia' již byla detailněji popsána v souvislosti s reakčním schématem 1.

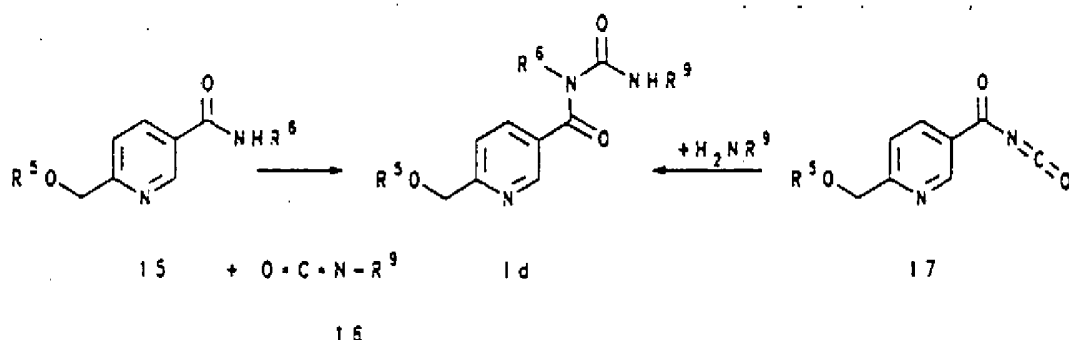
Výše popsaná reakční sekvence podle reakčního schématu 2 pro přípravu sloučenin obecného vzorce Ic, popřípadě Ic', které mají v poloze 5 skupinu $-CO-NR^6-YR^8$, může být použita také pro přípravu uvedených sloučenin, které tuto skupinu mají v poloze 4. Potom se vychází ze sloučenin obecného vzorce 4':



Při přípravě sloučenin podle vynálezu obecného vzorce I (Ia, Ia', Ib, Ib', Ic, Ic') podle reakčních schémat 1 a 2 se používají sloučeniny, ve kterých R^6 znamená atom vodíku. Potom se výhodně provede konverze na soli sloučenin obecného vzorce I, ve kterých R^6 znamená fyziologicky použitelný kationt. Jako látky použitelné pro tvorbu solí přichází výhodně v úvahu N-alkylaminy, (hydroxyalkyl)aminy a (alkoxyalkyl)aminy, jako například 2-ethanolamin, 3-propanolamin, 2-methoxyethylamin, 2-ethoxyethylamin a alfa, alfa, alfa-tris-(hydroxymethyl)methylamin (= Tris-pufr, tromethan), nebo také báze aminokyseliny, jako například histidin, arginin a lysin.

Následující reakční schema 4 schematicky znázorňuje přípravu sloučenin obecného vzorce Id, ve kterých X znamená skupinu CO a Y znamená skupinu $CONR^9$.

Reakční schema 4



Příprava uvedených sloučenin se provádí

i) reakcí amidů obecného vzorce 15 s odpovídajícími isokyanáty obecného vzorce 16 nebo

ii) reakcí karbonylisokyanátů obecného vzorce 17 s aminy obecného vzorce H₂NR⁹

a případnou následnou oxidací na N-oxid (Id').

Sloučeniny podle vynálezu obecného vzorce I mají cenné farmakologické vlastnosti a zejména vykazují antifibrosní účinnost.

Tato antifibrosní účinnost může být demonstrována na modelu fibrosy jater indukované tetrachlormethanem. Za tím účelem kryšám dvakrát týdně podává tetrachlormethan (1 ml/kg) rozpuštěný v olivovém oleji. Testovaná látka rozpuštěná ve vhodném fyziologicky přijatelném rozpouštědle se podává perorálně nebo intraperitoneálně jednou nebo případně dokonce dvakrát denně. Míra fibrosy jater se určí histologicky a podíl kolagenu v játru se analyzuje prostřednictvím hydroxyprolinového stanovení, popsaného Kivirikko-em a kol. (Anal. Biochem. 19,249 f (1967)). Aktivita fibrogenese může být stanovena radioimunologickým stanovením kolagenových fragmentů a prokolagenových peptidů v séru. Sloučeniny podle vynálezu jsou v tomto modelu účinné při koncentraci 1 až 100 mg/kg.

Aktivita fibrogeneze může být stanovena radioimunologickým stanovením N-terminálních propeptidů kolagenu typu III nebo N- popřípadě C-terminálních zesíťovaných domén kolagenu typu IV (7s-kolagen, popř. kolagen typu IV-NC₁) v séru.

Za tím účelem byla měřena koncentrace hydroxyprolinu, prokolagen-III-peptidu, 7s-kolagenu a kolagenu typu IV-NC v játrech (tato testovací metoda je popsána C-Rouiller-em v Experimental toxic injury of the liver, "The Liver", sv.2,5. 335-576, New York, Academic Press, 1964) u

- a) neošetřených krys (kontrolní skupina),
- b) krys, kterým byl podán tetrachlormethan (CCl₄-kontrola) a
- c) krys, kterým byl nejdříve podán tetrachlormethan a potom sloučenina podle vynálezu.

Sloučeniny obecného vzorce I mohou nalézt použití jako léčiva ve formě farmaceutických přípravků, které tyto sloučeniny případně obsahují společně s fyziologicky přijatelnými farmaceutickými nosiči. Tyto sloučeniny mohou nalézt použití jako léky, například ve formě farmaceutických přípravků, které obsahují tyto sloučeniny ve směsi s farmaceutickým organickým nebo anorganickým nosičem, vhodným pro enterální, perkutánní nebo parenterální aplikaci, jakým je například voda, arabská guma, želatina, mléčný cukr, škrob, stearát hořečnatý, talek rostlinný olej, polyalkylenglykol a vazelína.

Za tímto účelem mohou být uvedené sloučeniny aplikovány perorálně v dávce 0,1 až 25 mg/kg/den, výhodně v dávce 1 až 5 mg/kg/den, nebo parenterálně v dávce 0,01 až 5 mg/kg/den, výhodně v dávce 0,01 až 2,5 mg/kg/den, zejména v dávce 0,5 až 1,0 mg/kg/den. U těžších případů může být dávkování zvýšeno. V mnoha případech však postačují i nižší dávky. Údaje se vztahují na dospělého pacienta s hmotností asi 75 kg.

Vynález dále zahrnuje použití sloučenin podle vynálezu při výrobě léčiv, které se používají při léčení a profilaxi výše jmenovaných metabolických poruch.

Předmětem vynálezu jsou rovněž léčiva, která obsahují jednu nebo více sloučenin podle vynálezu obecného vzorce I a/nebo jejich fyziologicky přijatelné soli.

Tato léčiva se vyrábí o sobě známým, pro odborníka v daném odvětví běžným způsobem. Jakožto léčiva se používají farmakologicky účinné sloučeniny podle vynálezu (= účinná látka) buď samotné nebo výhodně v kombinaci s vhodnými farmaceutickými pomocnými nebo nosičovými látkami a to ve formě tablet, dražé, kapslí, čípků, emulzí, suspenzí nebo roztoků, přičemž obsah účinné látky se v těchto léčivových formách pohybuje až do asi 95 % a výhodně leží v rozmezí od 10 do 75 %.

Vhodnými pomocnými, popř. nosičovými látkami pro požadované léčivové formulace jsou vedle rozpouštědel například želatinační přísady, čípkové základy, tabletové pomocné látky, nosiče, antioxidanty, dispergační prostředky, emulgátory, odpěňovačla, chuť-korigující látky, konzervační prostředky, solubilizační činidla a barviva.

V následující části popisu bude vynález blíže objasněn pomocí konkrétních příkladů jeho provedení, které však mají pouze ilustrační charakter a nikterak neomezují rozsah vynálezu, který je jednoznačně vymezen formulací patentových nároků.

Příklady provedení vynálezu

Příklad 1

5-/(4-fluorfenylsulfonyl)amino/-2-hydroxymethylpyridin

a) Methylester kyseliny 5-/(4-fluorfenylsulfonyl)amino/pyridin-2-karboxylové

3,8 g (25 mmolu) methylesteru kyseliny 5-aminopyridin-2-karboxylové se rozpustí v 75 ml bezvodého pyridinu, načež se k získanému roztoku přidá po částech 5,8 g (30 mmolů) chloridu kyseliny fluorbenzensulfonové, přičemž se zvýší teplota reakční směsi na 35 °C. Po jedné hodině se reakční směs zahustí za vakua, zbytek se rozetře s vodou, odsaje, promyje vodou a vysuší. Získá se 7,3 g požadovaného produktu tajícího při teplotě 183-185 °C.

b) 2,6 g (8,4 mmolu) sloučeniny získané v předcházejícím stupni se rozpustí ve 100 ml bezvodého 1,4-dioxanu, načež se k tomuto roztoku za míchání a při teplotě 15 až 20 °C přidá 1 ml roztoku lithiualuminiumhydridu v tetrahydrofuranu. K reakční směsi se pomalu přidá ethylacetát a potom nasycený vodný roztok chloridu amonného a pH směsi se nastaví na hodnotu 3. Organická fáze se oddělí dekantací, zbytek se vícekrát promyje ethylacetátem, sloučené organické fáze se vysuší a zahustí a získaný olejovitý zbytek tvořící surový produkt se chromatografuje na silikagelu (70 až 200 µm) za použití eluční soustavy tvořené směsí ethylacetátu a methanolu v objemovém poměru 19:1. Z odpovídajících frakcí eluátu se získá 1,6 g požadované sloučeniny ve formě bezbarvých krystalů tajících při teplotě 88 až 90 °C.

Příklad 2

4-/((Fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

a) Hydrochlorid methylesteru kyseliny 6-chlormethylpyridin-4-karboxylové

K roztoku 16,7 g (0,01 molu) methylesteru kyseliny 2-hydroxymethylpyridin-4-karboxylové v 500 ml dichlormethanu se za míchání a chlazení ledem přikape 30 ml thionylchloridu rozpuštěného v 70 ml dichlormethanu. Po ohřátí na okolní teplotu se směs míchá po dobu jedné hodiny, načež se zahustí za vakua a zbytek se zpracuje diethylesterem, přičemž se získá 23 g požadovaného produktu ve formě bezbarvých krystalů tajících při teplotě 116 až 118 °C.

b) Kyselina 6-benzyloxymethylpyridin-4-karboxylová

K 60 ml (0,6 molu) benzylalkoholu v 500 ml N,N-dimethylacetamidu se po částech přidá 14,4 g (asi 0,5 molu) 80% hydridu

sodného. Získaná směs se míchá po dobu 30 minut při teplotě 60 °C, načež se ochladí na teplotu 20 °C a k takto ochlazené směsi se potom po částech přidá 23 g (0,1 molu) sloučeniny z příkladu 2a, načež se získaná směs míchá po dobu dvou hodin při teplotě 75 °C. Potom se přidá 300 ml vody, získaný tmavý roztok se zahustí za vakua, k zahuštěnému zbytku se přidá 100 ml vody, k získané směsi se přidává 2N roztok hydroxidu sodného až do okamžiku, kdy se získá čirý roztok, který se potom zfiltruje a pH získaného filtrátu se nastaví 2N kyselinou chlorovodíkovou na hodnotu 4, vyloučená sraženina se oddělí podtlakovou filtrací, promyje vodou a vysuší, přičemž se získá 10,8 g požadovaného produktu tajícího při teplotě 173-175 °C.

c) 2,4 g (10 mmolů) sloučeniny získané v předcházejícím stupni se suspenduje v 50 ml bezvodého tetrahydrofuranu o teplotě 0 °C, načež se k získané suspenzi přidá při teplotě 0 °C 1,5 ml (1,1 g, 11 mmolů) triethylaminu. Po 30 minutách se při teplotě 0 °C ke směsi přidá 1,35 ml (1,32 g, 11 mmolů) pivaloylchloridu a směs se míchá při teplotě 0 °C po dobu dvou hodin.

Ve druhé reakční nádobce se k 1,7 g (11 mmolů) amidu kyseliny benzensulfonové v 50 ml bezvodého tetrahydrofuranu přidá 1,4 g (11 mmolů) terc.butoxidu draselného. Tato směs se zahřeje na teplotu 50 °C a při této teplotě se míchá po dobu 30 minut, načež se ochladí na teplotu 20 °C. Tato suspence se potom přidá příkapávací nálevkou k výše uvedenému reakčnímu roztoku a získaná směs se míchá po dobu jedné hodiny při teplotě 20 °C, potom po dobu dvou hodin při teplotě 50 °C a nakonec po dobu 2 hodin při teplotě 70 °C. Rozpouštědlo se oddestiluje za vakua, ke zbytku se přidá nasycený vodný roztok hydrogenuhličitanu sodného a směs se extrahuje dichlormethanem. Z vodné fáze se po okyselení získá zpět 0,4 g extraktu. Organická fáze se zahustí a zbytek se chromatografuje na silikagelu za použití eluční soustavy tvořené směsí ethylacetátu a methanolu. Zbytek získaný z odpovídajících frakcí eluátu se přivede ke krystalizaci diethyletherem, přičemž

se získá 1,7 g požadované sloučeniny ve formě krystalické látky, tající při teplotě asi 80 °C.

Příklad 3

5-/4-(Chlorfenylsulfonyl)amino/-2-methylpyridin

Ke 4,5 g (41,7 mmolu) 5-amino-2-methylpyridinu ve 40 ml bezvodého pyridinu se za míchání přidá 11,4 g (54 mmolů) chloridu kyseliny 4-chlorbenzensulfonové rozpuštěné v 15 ml pyridinu, přičemž se tento přídavek provádí po kapkách a teplota se přitom zvýší na 35 až 40 °C. Po 30 minutách se směs zahustí za vakua, ke zbytku se přidá voda a krystalický produkt se oddělí podtlakovou filtrací a rekrystalizuje ze směsi ethanolu a vody v objemovém poměru 2:1. Tímto způsobem se získá 10,2 g požadované sloučeniny.

Teplota tání: 158-160 °C.

Příklad 4

5-/4-(Chlorfenylsulfonyl)amino/-2-hydroxymethylpyridin

K 9,9 g (35 mmolů) sloučeniny z příkladu 3 ve 400 ml dichlormethanu se za míchání po částech přidá 9,4 g (39 mmolů) kyseliny 3-chlorperbenzoové. Po 30 minutách se do směsi při teplotě 20 °C zavádí plynný amoniak, načež se získaný krystalický 5-/4-(chlorfenylsulfonyl)amino/-2-methylpyridin-N-oxid ve směsi s amonnou solí kyseliny 3-chlorbenzoové oddělí podtlakovou filtrací a vysuší.

Tento zbytek se potom rozpustí v 60 ml kyseliny octové o teplotě 80 °C, načež se k získanému roztoku po kapkách a za míchání přidá při teplotě 80 °C 70 ml acetanhydridu, načež se směs míchá po dobu jedné hodiny při teplotě 100 až 105 °C a po-

tom se ochladí na teplotu 80 °C. K takto ochlazené směsi se po kapkách přidá 100 ml methanolu, směs se zahustí za vakua a zbytek se rozpustí v malém množství methanolu, načež se k tomuto roztoku přidá 250 ml 1,5N methanolickeho roztoku hydroxidu sodného. Směs se potom zahustí za vakua, ke zbytku se přidá 200 ml vody, získaná směs se okyselí kyselinou chlorovodíkovou na hodnotu pH 6, oddělí se pryskyřičné vedlejší produkty a zbytek se extrahuje dichlormethanem. Zbytek organické fáze (asi 4 g) se chromatografuje na silikagelu za použití eluční soustavy tvořené směsí ethylacetátu a methanolu v objemovém poměru 10:1. Produkt se z odpovídajících frakcí eluátu přivede ke krystalizaci ethylacetátem. Získá se 2,2 g požadovaného produktu tajícího při teplotě 156-157 °C.

Příklad 5

5-/N-(4-Chlorfenylsulfonyl)-N-(2-methylbenzoyl)amino/-2-(2-methylbenzoyloxymethyl)pyridin

K 0,45 g (15 mmolů) sloučeniny z příkladu 4 ve 100 ml bezvodého dichlormethanu se za míchání přidá 0,22 ml (1,65 mmolu) triethylaminu a 0,1 g 4-N,N-dimethylaminopyridinu. Po 15 minutách se ke směsi po kapkách přidá 0,4 ml (465 mg, 3,0 mmoly) 2-methylbenzoylchloridu, načež se směs míchá po dobu 30 minut, přidá se k ní voda, vyjme se ethylacetátem, vysuší a zahustí a získaný zbytek se chromatografuje na silikagelu za použití elučního činidla tvořeného ethylacetátem. Zbytek odpovídajících frakcí eluátu se přivede ke krystalizaci směsí diisopropyletheru a petroletheru. Získá se 600 mg požadované sloučeniny, tající při teplotě 113 až 115 °C.

Příklad 6

5-/(4-Fluorfenylsulfonyl)amino/-2-methylpyridin

Tato sloučenina se získá postupem, který je analogický s postupem uvedeným v příkladu 3. Teplota tání: 176 až 180 °C (z vody).

Příklad 7

5-/(4-fluorfenylsulfonyl)amino/-2-methylpyridin-N-oxid

Tato sloučenina se získá ze sloučeniny z příkladu 6 a kyseliny m-chlorperbenzoové. Teplota tání: 123 až 124 °C (z diethyletheru).

Příklad 8

5-/(4-Methoxyfenylsulfonyl)amino/-2-methylpyridin

Tato sloučenina se získá postupem, který je analogický s postupem popsáním v příkladu 3. Teplota tání: 112 až 114 °C (z vody).

Příklad 9

5-/(4-Methoxyfenylsulfonyl)amino/-2-hydroxymethylpyridin

Tato sloučenina se získá postupem, který je analogický s postupem popsáním v příkladu 4, přičemž se vychází ze sloučeniny popsané v příkladu 8. Teplota tání: 119 až 121 °C.

Sloučeniny uvedené v následujících příkladech 10 až 15 se získají postupem, který je analogický s postupem popsáním v příkladu 3, z 5-amino-2-methylpyridinu a odpovídajících chlo-ridů sulfonových kyselin. Tyto produkty byly vždy izolovány z vody.

Příklad 10

5-/ (4-Trifluormethylfenylsulfonyl)amino/-2-methylpyridin

Teplota tání: 131 až 133 °C.

Příklad 11

5-/ (4-Trifluormethoxyfenylsulfonyl)amino/-2-methylpyridin

Teplota tání: 68 až 70 °C.

Příklad 12

5-/ (4-(2,2,2-Trifluorethoxy)fenylsulfonyl)amino/-2-methylpyridin

Teplota tání: 116 až 118 °C.

Příklad 13

5-/ (3-Fluorfenylsulfonyl)amino/-2-methylpyridin

Teplota tání: 146 až 148 °C.

Příklad 14

5-/ (3,5-Bis-/trifluormethyl/fenylsulfonyl)amino/-2-methylpyridin

Teplota tání: 194 až 197 °C.

Příklad 15

5-/ (3-Trifluormethylfenylsulfonyl)amino/-2-methylpyridin

Teplota tání: 95 až 97 °C.

Sloučeniny uvedené v následujících příkladech 16 až 20 se získají postupem, který je analogický s postupem popsáním v

příkladu 4, ze sloučenin z příkladů 10 až 12, 14 a 15.

Příklad 16

5-/ (4-Trifluormethylfenylsulfonyl)amino/-2-hydroxymethylpyridin
Teplota tání: 156 až 158 °C (z diethyletheru).

Příklad 17

5-/ (4-Trifluormethoxyfenylsulfonyl)amino/-2-hydroxymethylpyridin
Teplota tání: 115 až 117 °C (z diethyletheru).

Příklad 18

5-/ (4-(2,2,2-trifluorethyloxy)fenylsulfonyl)amino/-2-hydroxymethylpyridin
Teplota tání: 122 až 123 °C (z diethyletheru).

Příklad 19

5-/ (3,5-Bis/trifluormethyl/fenylsulfonyl)amino/-2-hydroxymethylpyridin
Teplota tání: 173 až 174 °C (z diethyletheru).

Příklad 20

5-/ (3-Trifluormethylfenylsulfonyl)amino/-2-hydroxymethylpyridin
Teplota tání: 115 až 116 °C (z diethyletheru).

Následující sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých X znamená skupinu -CO-, se připraví podle výše uvedených schemat 2 a 3 a postupy, které jsou analogické s postupy uvedenými ve

jmenovaných příkladech.

Příklad 21

3-/((Fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzoyloxymethylpyridin

a) Kyselina 6-benzoyloxymethylpyridin-3-karboxylová

0,93 g (40,5 mmolu) sodíku se pod dusíkovou atmosférou a při teplotě 50 °C rozpustí v 60 ml benzylalkoholu. Získaný roztok se ochladí na teplotu 0 °C, načež se k němu přidají 3,0 g (16,2 mmolu) methylesteru kyseliny 6-chlormethylpyridinkarboxylové (přípraveného chlorací methylesteru kyseliny 6-methylpyridin-3-karboxylové za použití kyseliny trichlorisokyanurové) rozpuštěného ve 20 ml benzylalkoholu a potom ještě 0,243 g (1,62 mmolu) jodidu sodného, načež se získaná směs zahřívá po dobu 8 hodin na teplotu 80 až 90 °C. Po ochlazení se směs nalije do vody a míchá po dobu 8 hodin při teplotě 50 °C, načež se přidá 200 ml ethylacetátu a organická fáze se dvakrát extrahuje zředěným roztokem hydroxidu sodného. Sloučená vodná fáze se okyselí při teplotě 0 °C koncentrovanou kyselinou chlorovodíkovou a produkt se oddělí podtlakovou filtrací, promyje vodou a vysuší za vakua při teplotě 60 °C. Získá se 1,4 g požadované sloučeniny, tající při teplotě 121 až 122 °C.

b) K 1,22 g (5 mmolů) sloučeniny získané v předcházejícím stupni ve 100 ml bezvodého dichlormethanu se přidá 0,79 g (5 mmolů) amidu kyseliny benzensulfonové, 1,03 g (5 mmolů) N,N'-dicyklohexylkarbodiimidu a 0,61 g (5 mmolů) 4-N,N-dimethylaminopyridinu a směs se míchá po dobu 20 hodin při teplotě 20 °C. Pevný podíl se potom oddělí a k filtrátu se přidá vodný roztok hydrogenuhličitanu sodného. Vodná fáze se dvakrát promyje diethyletherem a její pH se nastaví koncentrovanou kyselinou chlorovodíkovou na hodnotu 2 až 3. Po odsátí, promytí vodou a vysušení se získá 0,9 g požadované sloučeniny, tající při teplotě 178 až 179 °C.

Příklad 22

3-/((Fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 23

3-/((Fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylpropionyl)oxymethylpyridin

Příklad 24

3-/((Fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-cyklohexanoyloxymethylpyridin

Příklad 25

3-/((Fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzoyloxymethylpyridin

Příklad 26

3-/((Fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 27

3-/((Fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylbenzoyl)oxymethylpyridin

Příklad 28

3-/((Methylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 29

3-/((Methylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-methoxymethylpyridin

Příklad 30

3-/((Methylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 31

3-/((Methylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzoyloxymethylpyridin

Příklad 32

3-/((Methylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylbenzoyl)oxymethylpyridin

Příklad 33

3-/((n-Butylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylbenzoyl)oxymethylpyridin

Příklad 34

3-/((n-Butylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 35

3-/((4-/2,2,2-trifluorethyloxy/fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 36

3-/((4-/2,2,2-Trifluorethyloxy/fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-methoxymethylpyridin

Příklad 37

3-/((4-/2,2,2-Trifluorethyloxy/fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 38

3-/((4-/2,2,2-Trifluorethyloxy/fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Příklad 39

3-/((4-/2,2,2-Trifluorethyloxy/fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-isopropyloxymethylpyridin

Příklad 40

3-/((4-/2,2,2-Trifluorethyloxy/fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 41

3-/((4-/2,2,3,3,4,4,4-heptafluorbutyloxy/fenylsulfonyl)amino)-karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 42

3-/((4-/2,2,3,3,4,4,4-heptafluorbutyloxy/fenylsulfonyl)amino)-karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 43

3-/((4-Methoxyfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 44

3-/((4-Methoxyfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Příklad 45

3-/((4-Methoxyfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 46

3-/((4-Methoxyfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzoyloxymethylpyridin

Příklad 47

3-/((4-/2,2,3,3,4,4,4-Heptafluorbutyloxy/fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylbenzoyl)oxymethylpyridin

Příklad 48

3-/((4-/2,2,3,3,4,4,4-Heptafluorbutyloxy/fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-isopropyloxymethylpyridin

Příklad 49

3-/((4-Fenoxifenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

a) Kyselina 6-chlormethylpyridin-3-karboxylová

1,28 g (32 mmolů) pecičkového hydroxidu sodného se při teplotě 0 °C rozpustí ve 250 ml methanolu a k získanému roztoku se přidá 5,92 g (32 mmolů) methylesteru kyseliny 6-chlormethylpyridin-3-karboxylové (připraveného chlorací methylesteru kyseliny 6-methylpyridin-3-karboxylové za použití kyseliny trichlorkyanurové). Po 18 hodinovém míchání se směs zahustí, vyjme nasyceným vodným roztokem hydrogenuhlíčitanu sodného, extrahuje ethylacetátem a vodná fáze se okyselí koncentrovanou kyselinou chlorovodíkovou, načež se podtlakovou filtrací oddělí 2,43 pevného podílu tvořícího první frakci produktu, tajícího při teplotě 157 až 159 °C. Vodná fáze se třikrát extrahuje ethylacetátem a organická fáze se vysuší a zahustí, přičemž se izoluje další frakce produktu (0,9 g), tajícího při teplotě 159 až 161 °C.
Výtěžek: 3,33 g.

b) Požadovaná sloučenina se připraví postupem, který je analogický s postupem uvedeným v příkladu 92.

1,5 g (8,8 mmolu) sloučeniny získané v předcházejícím stupni ve 300 ml dichlormethanu se míchá pod atmosférou dusíku po dobu 24 hodin při teplotě 20 °C s 2,19 g (8,8 mmolu) amidu kyseliny 4-fenoxybenzensulfonové, 1,81 g (8,8 mmolu) N,N'-dicyklohexylkarbodiimidu a 1,07 g (8,8 mmolu) 4-N,N-dimethylaminopyridinu. Po zfiltrování směsi se filtrát promyje 2n vodným roztokem kyseliny chlorovodíkové, organická fáze se zahustí a zbytek se zahřívá za míchání ve směsi 200 ml 1,4-dioxanu a 200 ml 1n vodného roztoku hydroxidu sodného na teplotu 80 °C po dobu 5 hodin (kontrola pomocí chromatografie na tenké vrstvě). Směs se potom zahustí, zbytek se vyjme vodou, promyje diethyletherem a okyselí koncentrovanou vodnou kyselinou chlorovodíkovou. Získaný surový produkt se potom chromatografuje na silikagelu za použití eluční soustavy tvořené směsí ethylacetátu, n-heptanu a methanolu v objemovém poměru 5:3:2. Z odpovídajících

frakcí eluátu se potom získá 0,8 g požadované sloučeniny ve formě bezbarvých krystalů, tajících při teplotě 253 až 254 °C.

Příklad 50

3-/((n-Butylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 51

3-/((n-Butylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 52

3-/((n-Butylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Následující sloučeniny, ve kterých X znamená jednoduchou vazbu, se připraví postupem, který je analogický s postupem uvedeným v reakčním schématu 1.

Příklad 53

5-((Fenylsulfonyl)amino)-2-acetoxymethylpyridin

Příklad 54

5-((Fenylsulfonyl)amino)-2-(2-methylpropionyl)oxymethylpyridin

Příklad 55

5-((Fenylsulfonyl)amino)-2-cyklohexanoyloxymethylpyridin

Příklad 56

5-((Fenylsulfonyl)amino)-2-benzoyloxymethylpyridin

Příklad 57

5-((Fenylsulfonyl)amino)-2-benzoyloxymethylpyridin

Příklad 58

5-((Fenylsulfonyl)amino)-2-(2-methylbenzoyl)oxymethylpyridin

Příklad 59

5-((Methylsulfonyl)amino)-2-hydroxymethylpyridin

Příklad 60

5-((Methylsulfonyl)amino)-2-methoxymethylpyridin

Příklad 61

5-((Methylsulfonyl)amino)-2-ethyloxymethylpyridin

Příklad 62

5-((Methylsulfonyl)amino)-2-benzoyloxymethylpyridin

Příklad 63

5-((Methylsulfonyl)amino)-2-(2-methylbenzoyl)oxymethylpyridin

Příklad 64

5-((n-Butylsulfonyl)amino)-2-(2-methylbenzoyl)oxymethylpyridin

Příklad 65

5-((n-Butylsulfonyl)amino)-2-acetoxymethylpyridin

V následující části budou uvedeny sloučeniny, ve kterých X znamená skupinu -CO- a Y znamená skupinu -CONR⁹-. Tyto sloučeniny se připraví postupem, který je analogický s postupem popsaným v J.Agr.Food Chem., sv.21,č.3, 1973, str.348 a zde citované literatuře pro přípravu benzoyl-3-fenylmočoviny z odpovídajících 6-hydroxymethylových derivátů amidu kyseliny pyridin-4(5)-karboxylové.

Příklad 66

3-/(((N-Fenylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-methoxymethylpyridin

a) Methylester kyseliny 6-methoxymethylpyridin-3-karboxylové

K 52 g (0,28 molu) methylesteru kyseliny 6-chlormethylpyridin-3-karboxylové v 500 ml methanolu se přidá 54 ml (asi 0,3 molu) 30% roztoku methoxidu sodného a 4,5 g jodidu sodného a takto získaná směs se potom zahřívá po dobu 3 hodin na teplotu varu pod zpětným chladičem. Reakční směs se potom zahustí za vakua a zbytek se extrahuje teplým diisopropyletherem a chromatografuje na silikagelu za použití eluční soustavy tvořené směsí n-heptanu a ethylacetátu v objemovém poměru 2:1. Z odpovídajících frakcí eluátu se získá 42,8 g produktu, tajícího při teplotě 34 až 36 °C (z petroletheru).

b) Amid kyseliny 6-methoxymethylpyridin-3-karboxylové

13,6 g (75 mmolů) esteru získaného v předcházejícím stupni se míchá ve 100 ml koncentrovaného vodného roztoku amoniaku při teplotě 25 °C po dobu jedné hodiny. Směs se potom neutralizuje za chlazení ledem koncentrovaným vodným roztokem kyseliny chlorovodíkové, načež se zahušťuje až do okamžiku, kdy počíná krystalizovat. Získá se 6,7 g produktu tajícího při teplotě 150 až 152 °C (z vody).

c) 2,5 g (15 mmolů) amidu kyseliny 6-methoxymethylpyridin-3-karboxylové se suspenduje v 50 ml bezvodého xylenu, načež se k získané suspenzi přidají 2,0 g (1,85 ml, 17 mmolů) fenylisokyanátu a směs se míchá za míchání a při teplotě 130 °C po dobu 18 hodin. Reakční směs se potom ochladí, dekantací zbaví tmavého pryskyřičného podílu, přidá se k ní 10 ml methanolu, zahustí se a zbytek se přivede ke krystalizaci ethylacetátem. Takto získaný produkt se potom chromatografuje na silikagelu (70 až 200 μ m) za použití elučního činidla tvořeného dichlormethanem, ve kterém se v průběhu chromatografie zvyšuje obsah methanolu až na 10 %. Z odpovídajících frakcí eluátu získaná požadovaná sloučenina se potom rekrystalizuje z dichlormethanu. Získá se 2,3 g produktu, tajícího při teplotě 194 až 196 °C.

Příklad 67

3-/(((N-Fenylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 68

3-/(((N-n-Butylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-methoxymethylpyridin

3,3 g (20 mmolů) amidu kyseliny 6-methoxymethylpyridin-3-karboxylové (příprava viz příklad 66b) ve 100 ml bezvodého xy-

lenu a 2,5 g (2,8 ml, 25 mmolů) n-butyliisokyanátu se zahřívá analogicky jako v příkladu 66c) po dobu 8 hodin na teplotu 130 °C. Po kontrole chromatografií na tenké vrstvě se přidá 1 ml další podíl n-butyliisokyanátu a směs se na uvedenou teplotu zahřívá ještě po dobu 2 hodin. Nerozpuštěný podíl se odfiltruje za tepla, filtrát se zahustí a zbytek se ponechá vykrystalizovat z diisopropyletheru. Tento surový produkt se potom chromatografuje na silikagelu za použití diisopropyletheru jako elučního činidla. Odpovídající frakce eluátu se zahustí a zbytek se rekrystalizuje z diisopropyletheru. Získá se 2,3 g požadované sloučeniny, tající při teplotě 116 až 118 °C.

Příklad 69

3-/(((N-Propylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Příklad 70

3-/(((N-Fenyl-N-methylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-methoxymethylpyridin

Příklad 71

3-/(((N-Fenyl-N-ethylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 72

3-/(((N-Cyklohexylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-ethyoxymethylpyridin

Příklad 73

3-/(((N-Cyklohexyl-N-ethylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-ethoxymethylpyridin

Příklad 74

3-/(((N-n-Butylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 75

3-/(((N-n-Butylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 76

3-/(((N-Ethylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 77

3-/(((N-Ethylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 78

3-/(((N-/4-Fluorfenyl/amino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 79

3-/(((N-/4-Fluorfenyl/amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 80

3-/(((N-/4-Fluorfenyl/-N-methylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-
6-hydroxymethylpyridin

Příklad 81

3-/(((N-/4-Methoxyfenyl/amino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-ethyl-
oxymethylpyridin

Příklad 82

3-/(((N-/4-Fluorfenyl/amino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-benzyl-
oxymethylpyridin

Příklad 83

3-/(((N-Ethylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpy-
ridin

Příklad 84

3-/(((N-Fenylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyri-
din

příklad 85

3-/(((N-Fenylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpy-
ridin

Příklad 86

3-/(((N-Fenylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylbenzoyl)-
methylpyridin

Příklad 87

3-/(((N-Cyklohexylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 88

3-/(((N-Cyklohexylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 89

3-/(((N-4-Fluorfenylamino)karbonyl)amino)karbonyl/-6-methoxymethylpyridin

1,7 g (10 mmolů) amidu kyseliny 6-methoxymethylpyridin-3-karboxylové se analogicky jako v příkladech 66 a 68 uvede v reakci s 1,8 g (13 mmolů) 4-fluorfenylisokyanátu po dobu 8 hodin při teplotě 120 °C. Žluté krystaly vyloučené po ochlazení se oddělí podtlakovou filtrací, zahřívají s 50 ml methanolu a znovu oddělí podtlakovou filtrací při teplotě 20 °C, načež se promyjí a vysuší. Získá se 2,6 g požadovaného produktu, tajícího při 222 až 224 °C (z methanolu).

Příklad 90

3-/((Fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxyppyridin

a) Kyselina 6-ethyloxyethylpyridin-3-karboxylová

Tato sloučenina se získá analogicky jako v příkladu 21a) ze sodíku, ethanolu , 5 g (27 mmolů) methylesteru kyseliny 6-chlormethylpyridin-3-karboxylové a 0,4 g (2,7 mmolů) jodidu sodného. Získá se 4,8 g požadovaného produktu, tajícího při teplotě

95 až 96 °C (z ethylacetátu).

b) Analogicky jako v příkladu 49 se 1,09 g (6 mmolů) kyseliny 6-ethyloxymethylpyridin-3-karboxylové ve 100 ml bezvodého dichlormethanu zahřívá po dobu 20 hodin na teplotu 20 °C s 0,94 g (6 mmolů) amidu kyseliny benzensulfonové, 1,24 g (6 mmolů) N,N'-dicyklohexylkarbodiimidu a 0,73 g (6 mmolů) 4-N,N-dimethylaminopyridinu. Vzniklá N,N'-dicyklohexylmočovina se odfiltruje, směs se vyjme vodným roztokem hydrogenuhličitanu sodného, zbaví nerozpuštěného podílu filtrací a zbytek se okyselí koncentrovanou kyselinou solnou. Po odsátí, promytí vodou a vysušení se získá 1,51 g požadované sloučeniny, tající při teplotě 180 až 182 °C.

Příklad 91

3-/((4-n-Butyloxyfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-methoxymethylpyridin

0,9 g (5,26 mmolu) kyseliny 6-chlormethylpyridin-3-karboxylové (příprava viz příklad 49a)) se 200 ml dichlormethanu se míchá pod atmosférou dusíku při teplotě 20 °C s 1,2 g (5,25 mmolu) amidu kyseliny n-Butyloxybenzensulfonové, 1,09 g (5,26 mmolu) N,N'-dicyklohexylkarbodiimidu a 0,64 g (5,26 mmolu) 4-N,N-dimethylaminopyridinu. Tato směs se při uvedené teplotě míchá po dobu 20 hodin. N,N'-dicyklohexylmočovina se odfiltruje, filtrát se zahustí za vakua, ke zbytku se přidá methanol, směs se zahustí a zbytek se chromatografuje na silikagelu za použití eluční soustavy tvořené směsí ethylacetátu a methanolu v objemovém poměru 9:1. Z odpovídajících frakcí eluátu se získá 0,88 g krystalické požadované sloučeniny, tající při teplotě 218 až 220 °C.

Příklad 92

3-/((4-n-Butyloxyfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

0,9 g (5,26 mmolu) kyseliny 6-chlormethylpyridin-3-karboxylové (příprava viz příklad 49a)) se pod atmosférou dusíku suspenduje ve 200 ml dichlormethanu, načež se k této suspenzi přidá 1,2 g (5,26 mmolu) amidu kyseliny 4-n-butyloxybenzensulfonové, 1,09 g (5,25 mmolu) N,N'-dicyklohexylkarbodiimidu a 0,64 g (5,26 mmolu) 4-N,N-dimethylaminopyridinu. Po 10 minutách vznikne čirý roztok, který se po jedné hodině zakalí. Reakční směs se potom míchá při teplotě 20 °C po dobu dalších 19 hodin. Vyloučená dicyklohexylmočovina se odfiltruje, filtrát se zahustí a získaný zbytek se míchá ve 100 ml 1n vodného roztoku hydroxidu sodného po dobu 4 hodin při teplotě 50 °C a potom ještě po dobu 2 hodin při teplotě 80 °C. Směs se zahustí za vakua, přidá se voda a směs se dvakrát extrahuje diethyletherem. Vodná fáze se potom okyselí koncentrovanou kyselinou chlorovodíkovou a zahustí a ke zbytku se přidá toluen. Směs se opět vakuově zahustí a zbytek se chromatografuje na silikagelu za použití eluční soustavy tvořené směsí ethylacetátu a methanolu (1:1) obsahující v jednom litru 0,75 ml kyseliny octové. Z odpovídajících frakcí eluátu se potom získá 0,86 g požadované sloučeniny, která se rekrystalizuje z ethylacetátu. Získaná sloučenina taje při teplotě 178 až 179 °C.

Sloučeniny uvedené v následujících příkladech, se připraví postupy, které jsou analogické s postupy uvedenými v příkladech 49 a 92.

Příklad 93

3-/((4-Methoxyfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 94

3-/((4-Ethyloxyfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 95

3-/((4-i-Propyloxyfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethyl-pyridin

Příklad 96

3-/((4-n-Pentyloxyfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethyl-pyridin

Příklad 97

3-/((4-n-Hexyloxyfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethyl-pyridin

Příklad 98

3-/((4-n-Oktyloxyfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethyl-pyridin

Příklad 99

3-/((4-c-Hexyloxyfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethyl-pyridin

Příklad 100

3-/((4-(c-Hexylmethyloxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 101

3-/((4-Methylfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 102

3-/((4-Ethylfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 103

3-/((4-n-Propylfenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 104

3-/((4-Bifenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 105

3-/((2-Bifenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 106

3-/((4-(4-fluorfenoxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 107

3-/((4-(3-Fluorfenoxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 108

3-/((4-(4-Chlorfenoxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 109

3-/((4-(3,5-Dichlorfenoxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydro-

xymethylpyridin

Příklad 110

3-/((4-(3-Trifluormethylfenoxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-
6-hydroxymethylpyridin

Příklad 111

3-/((4-(4-Trifluormethylfenyloxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-
6-hydroxymethylpyridin

Příklad 112

3-/((3-(4-Fluorfenoxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxyme-
thylpyridin

Příklad 113

3-/((3-(3-Fluorfenoxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxyme-
thylpyridin

Příklad 114

3-/((3-(4-Chlorfenoxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxyme-
thylpyridin

Příklad 115

3-/((3-(3,5-Dichlorfenoxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydro-
xymethylpyridin

Příklad 116

3-/((4-(2-(Fenyloxy)ethyloxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 117

3-/((4-(2-(n-Butyloxy)ethyloxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 118

3-/((4-((4-Fenyl-n-butyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 119

3-/((4-(Ethylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 120

3-/((4-(n-Propylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 121

3-/((4-(n-Hexylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 122

3-/((4-(N,N-Di-n-butylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 123

3-/((4-(Cyklohexylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 124

3-/((4-(Benzylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 125

Amonná sůl 3-/((4-((2-Fenylethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridinu

Ke 3,42 g (20 mmolů) kyseliny 6-chlormethylpyridin-3-karboxylové ve 200 ml dichlormethanu se pod atmosférou dusíku přidá 6,1 g (20 mmolů) amidu kyseliny 4-((2-fenylethyl)aminokarbonyl)benzensulfonové, 2,45 g (20 mmolů) 4-N,N-dimethylaminopyridinu a 4,12 g (20 mmolů) N,N'-dicyklohexylkarbodiimidu a tato směs se míchá při teplotě 20 °C po dobu 20 hodin. Potom se odfiltruje N,N'-dicyklohexylmočovina, promyje dichlormethanem a filtrát se zahustí. Ke zbytku se potom přidá 200 ml 1n HCl a vyloučený produkt se oddělí podtlakovou filtrací a promyje vodou. Takto získaný meziprodukt (13 g) se potom míchá po dobu 5 hodin při teplotě 80 °C ve 200 ml 1,4-dioxanu a 300 ml 1n vodného roztoku hydroxidu sodného. Reakční směs se potom zahustí, vyjme vodou a extrahuje diethyletherem, načež se vodná fáze okyselí koncentrovaným vodným roztokem kyseliny chlorovodíkové. Vyloučený produkt se oddělí podtlakovou filtrací a rozpustí v methanolu a k získanému roztoku se přidá methanolvý roztok amoniaku. Po přidá-

ní diethyletheru se krystalický produkt oddělí podtlakovou filtrací a promyje etherem. Takto se získá 350 mg požadované sloučeniny, tající při teplotě 188 až 190 °C. Z matečného louhu (7 g) může být po chromatografickém zpracování izolován další podíl produktu.

Příklad 126

3-/((4-((3-Fenylpropyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 127

3-/((4-((2-Methoxyethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 128

3-/((4-((2-Ethoxyethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 129

3-/((4-((3-Ethoxypropyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 130

3-/((3-(4-Fenyl-n-butyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 131

3-/((3-(Ethylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 132

3-/((3-(n-Propylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 133

3-/((3-(n-Hexylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 134

3-/((3-(N,N-Di-n-butylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 135

3-/((3-(Cyklohexylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 136

3-/((3-(Benzylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 137

3-/((3-(2-Fenylethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 138

3-/((3-(3-Fenylpropyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 139

3-/((3-(2-Methoxyethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 140

3-/((3-(2-Ethoxyethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 141

3-/((3-(3-Ethoxypropyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 142

3-/((4-(4-Fenyl-n-butanoylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 143

3-/((4-(Acetylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 144

3-/((4-(n-Propionylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Č. J.	11 2 5 5 0 2
DOŠLO	
29. IV 93	
URAD PRŮMYSLOVÉHO VLASTNICTVÍ	
Příl.	

Příklad 145

3-/((4-(n-Hexanoylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 146

3-/((4-(Benzoylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 147

3-/((4-(3-(Fenylpropionylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 148

3-/((4-(2-Fenylacetylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 149

3-/((4-(2-(Acetylamino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 150

3-/((4-(2-(Butanoylamino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 151

3-/((4-(2-(Benzoylamino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 152

3-/((4-(2-((2-Chlor-5-methoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)-amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin ve formě sodné soli

a) Sodná sůl 3-/((4-(2-((2-chlor-5-methoxybenzoyl)aminoethyl)-fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-chlormethylpyridinu

K 5,5 g (15 mmolů) 4-(2-((2-chlor-5-methoxybenzoyl)amino)-ethyl)benzensulfonamidu ve 300 ml tetrahydrofuranu se za míchání a při teplotě 20 °C přidá 1,85 g (16,5 mmolu) terc.butoxidu draselného a tato směs se potom míchá po dobu 30 minut při teplotě 50 °C. Po ochlazení se k tomuto roztoku po kapkách přidá roztok 2,57 g kyseliny 6-chlormethylpyridin-3-karboxylové a 2,7 g (16,6 mmolu) N,N'-karbonyldiimidazolu v 70 ml bezvodého tetrahydrofuranu, který byl předtím rovněž míchán po dobu 30 minut při teplotě 50 °C. Reakční směs se míchá po dobu dvou hodin při teplotě 40 až 50 °C, načež se po ochlazení zahustí za vakua a ke zbytku se přidá voda, potom 200 ml nasyceného vodného roztoku hydrogenuhličitanu sodného a 200 ml dichlormethanu, přičemž se získá 7,3 g požadovaného produktu tajícího při teplotě 192 až 193 °C.

b) 2,7 g (4 mmolů) sloučeniny získané v předcházejícím stupni se suspenduje v 60 ml 1n roztoku hydroxidu sodného a k této suspenzi se za míchání a při teplotě 80 °C přidá 30 ml 1,4-dioxanu, přičemž se získá čirý roztok. Po jednohodinovém míchání při teplotě 80 °C (kontrola chromatografií na tenké vrstvě) se roztok ochladí a zahustí za vakua. Ke zbytku se přidá 30 ml vody a směs se jednou extrahuje 100 ml dichlormethanu. pH vodné fáze se nastaví koncentrovaným vodným roztokem kyseliny chlorovodíkové na hodnotu 1. Takto získaný polokrystalický produkt se rozpustí v methanolu a k získanému roztoku se přidá vodný roztok hydrogenuhličitanu sodného, směs se zahustí a zbytek se chromatografuje na silikagelu za použití eluční soustavy tvořené směsí ethylacetátu a methanolu v objemovém poměru 5:1. Z odpovídajících

frakcí eluátu se po rekrystalizaci z ethylacetátu získá 0,44 g bezbarvých krystalů požadované sloučeniny. Produkt je při teplotě 120 °C (za kypění).

Příklad 153

3-/((3-(4-Fenyl-n-butanoylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 154

3-/((3-(Acetylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 155

3-/((3-(Propionylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 156

3-/((3-(n-Hexanoylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 157

3-/((3-(Benzoylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 158

3-/((3-(3-Fenylpropionylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 159

3-/((2-(2-Fenylacetylamo)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 160

3-/((3-(2-Acetylamo)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 161

3-/((3-(2-Butanoylamino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 162

3-/((3-(2-Benzoylamino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 163

3-/((3-(2-((2-Chlor-5-methoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)-amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 164

3-/((((4-Fluorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 165

3-/((((3-Fluorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 166

3-/((((2,4-Difluorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 167

3-/((((4-Chlorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 168

3-/((((3,5-Dichlorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethyl

Příklad 169

3-/((((3-Trifluormethylfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 170

3-/((((4-Trifluormethylfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 171

3-/((((4-n-Butyloxyfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 172

3-/(((2-Ethyloxyfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 173

3-/(((2-Methoxyethylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 174

3-/(((2-Ethyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 175

3-/(((2-Isopropyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 176

3-/(((2-n-Butyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 177

3-/(((2-Benzyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 178

3-/(((2-Fenylethyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 179

3-/((1-Naftylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 180

3-/(((4-Methoxy-1-naftyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 181

3-/(((5-Ethoxy-1-naftyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 182

3-/((2-Bifenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 183

3-/(((4-Methoxy-2-bifenyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 184

3-/((((4-Fluorfenyl)-3-oxopropyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 185

3-/((((3-Fluorfenyl)-3-oxopropyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 186

3-/((((2,4-Difluorfenyl)-3-oxypropyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 187

3-/((((4-Chlorfenyl)-3-oxypropyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 188

3-/((((3,5-Dichlorfenyl)-3-oxypropyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 189

3-/((((3-Trifluormethylfenyl)-3-oxypropyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 190

3-/((((4-Trifluormethylfenyl)-3-oxypropyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 191

3-/(((2-Fenylethyl)-2-oxypropyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 192

3-/((((4-Fluorfenyl)-4-oxy-n-butyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylsulfonyl

Příklad 193

3-/((((3-Fluorfenyl)-4-oxy-n-butyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 194

3-/((((2,4-Difluorfenyl)-4-oxy-n-butyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 195

3-/((((4-Chlorfenyl)-4-oxy-n-butyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 196

3-/((((3,5-Dichlorfenyl)-4-oxy-n-butyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 197

3-/((((3-Trifluormethylfenyl)-4-oxy-n-butyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 198

3-/((((4-Trifluormethylfenyl)-4-oxy-n-butyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 199

3-/((((4-n-Butyloxyfenyl)-4-oxy-n-butyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 200

3-/((((2-Ethyloxyfenyl)-4-oxy-n-butyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 201

3-/(((4-Methoxy-n-butylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 202

3-/(((4-Ethyloxy-n-butyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 203

3-/(((4-Isopropyloxy-n-butyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 204

3-/(((4-n-Butyloxy-n-butyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 205

3-/(((4-Benzyloxy-n-butyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 206

3-/(((2-Fenylethyl)-4-oxy-n-butyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 207

3-/((2-Naftylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 208

3-/(((4-Methoxy-2-naftyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 209

3-/(((4-Fluorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 210

3-/(((3-Fluorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 211

3-/(((2,4-Difluorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 213

3-/(((4-Chlorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 214

3-/((((3,5-Dichlorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 215

Příklad 215

3-/((((3-Trifluormethylfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 216

3-/((((4-Trifluormethylfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 217

3-/((((4-n-Butyloxyfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 218

3-/((((2-Ethyloxyfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 219

3-/((((2-Methoxyethylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 220

3-/(((2-Ethyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 221

3-/(((2-Isopropyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 222

3-/(((2-n-Butyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 223

3-/(((2-Benzyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 224

3-/(((2-Fenylethyl)-2-oxoethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 225

3-/(((1-Naftylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 226

3-/(((4-Methoxy-1-naftyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 227

3-/(((5-Ethoxy-1-nyftyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 228

3-/((2-Biofenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 229

3-/(((4-Methoxy-2-bifenyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 230

3-/((4-(4-Fluorfenoxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 231

3-/((4-(3-Fluorfenoxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 232

3-/((4-(4-Chlorfenoxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 233

3-/((4-(3,5-Dichlorfenoxy)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 234

3-/(((4-Fluorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 235

3-/(((3-Fluorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 236

3-/(((2,4-Difluorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 237

3-/(((4-Chlorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 238

3-/(((3,5-Dichlorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 239

3-/(((3-Trifluormethylfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 240

3-/(((4-Trifluormethylfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-

6-acetoxymethylpyridin

Příklad 241

3-/((((4-n-Butyloxyfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 242

3-/((((2-Ethyloxyfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 243

3-/(((2-Methoxyethylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 244

3-/(((2-Ethyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 245

3-/(((2-Isopropyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 246

3-/(((2-n-Butyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 247

3-/(((2-Benzoyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 248

3-/(((2-Fenylethyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 249

3-/(((1-Naftylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 250

3-/(((4-Methoxy-1-naftyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 251

3-/(((5-Ethoxy-1-naftyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 252

3-/((2-Bifenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 253

3-/(((4-Methoxy-2-bifenyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 253

3-/(((4-Methoxy-2-bifeny)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 254

3-/((4-(4-Fenyl-n-butylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 255

3-/((4-(2-Fenylethylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 256

3-/((4-(3-Fenylpropylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 257

3-/((4-(2-Methoxyethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 258

3-/((4-(2-Ethoxyethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 259

3-/((4-(3-Ethoxypropyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 260

3-/((4-Ethylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ben-
zyloxymethylpyridin

Příklad 261

3-/((4-(n-Propylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-
benzyloxymethylpyridin

Příklad 262

3-/((4-(n-Hexylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-n-
butanoyloxymethylpyridin

Příklad 263

3-/((4-(N,N-Di-n-butylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-
6-benzoyloxymethylpyridin

Příklad 264

3-/((4-(Cyklohexylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-
acetoxymethylpyridin

Příklad 265

3-/((4-(Benzylaminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ace-
toxymethylpyridin

Příklad 266

3-/(((4-(4-Fenylbutanoylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-
acetoxymethylpyridin

Příklad 267

3-/((4-/2-Acetylamo/ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ben-
zyloxymethylpyridin

Příklad 268

3-/((4-/2-Butanoylamino/ethyl)fenyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylpropionyl)oxymethylpyridin

Příklad 269

3-/((4-/2-Benzoylamino/ethyl)fenyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzoyloxymethylpyridin

Příklad 270

3-/((4-/2-(2-Chlor-5-methoxybenzoyl)amino/ethyl)fenylsulfonyl)-amino)karbonyl/-6-n-butanoyloxymethylpyridin

Příklad 271

3-/((4-Acetylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 272

3-/(((4-Propionylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 273

3-/(((4-n-Hexanoylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 274

3-/(((4-Benzoylamino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 275

3-/(((4-/3-Fenylpropionylamino/fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 276

3-/(((4-(2-Fenylacetyl)amino)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Příklad 277

3-/(((4-Fluorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Příklad 278

3-/(((3-Fluorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylbenzoyl)oxymethylpyridin

Příklad 279

3-/(((2,4-Difluorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylpropionyl)oxymethylpyridin

Příklad 280

3-/(((4-Chlorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Příklad 281

3-/(((3,5-Dichlorfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Příklad 282

3-/(((3-Trifluormethylfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Příklad 283

3-/((((4-Trifluormethylfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Příklad 284

3-/((((4-n-Butyloxyfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylpropionyl)oxymethylpyridin

Příklad 285

3-/((((2-Ethoxyfenyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-propionyloxymethylpyridin

Příklad 286

3-/(((2-Methoxyethylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Příklad 287

3-/(((2-Ethyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Příklad 288

3-/(((2-Isopropyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzoyloxy-methylpyridin

Příklad 289

3-/(((2-n-Butyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylpropionyl)oxymethylpyridin

Příklad 290

3-/(((2-Benzyloxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-n-butanoyloxy-methylpyridin

Příklad 291

3-/(((2-Fenylethyl)-2-oxyethyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Příklad 292

3-/(((1-Naftylysulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylpropionyl)oxymethylpyridin

Příklad 293

3-/(((4-Methoxy-1-naftyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzoyloxy-methylpyridin

Příklad 294

3-/(((5-Ethoxy-1-naftyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylpropionyl)oxymethylpyridin

Příklad 295

3-/((2-Bifenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-methoxymethylpyridin

Příklad 296

3-/(((4-Methoxy-2-bifenyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-methoxymethylpyridin

Příklad 297

3-/(((4-n-Butyloxyfenyl)-3-oxypropyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 298

3-/(((2-Ethyloxyfenyl)-3-oxypropyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 299

3-/(((3-Methoxypropylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 300

3-/(((3-Ethyloxypropyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 301

3-/(((3-Isopropyloxypropyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Příklad 302

3-/(((3-n-Butyloxypropyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylpropionyl)oxymethylpyridin

Příklad 303

3-/(((3-Benzyloxypropyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 304

3-/((1-Naftylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-methoxymethylpyridin

Příklad 305

3-/(((4-Methoxy-1-naftyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-methoxymethylpyridin

Příklad 306

3-/(((5-Ethoxy-1-naftyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-methoxymethylpyridin

Příklad 307

3-/((2-Bifenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-methylpropionyl)oxymethylpyridin

Příklad 308

3-/(((4-Methoxy-2-bifenyl)sulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Sloučeniny uvedené v následujících příkladech 309 až 318 byly připraveny z kyseliny 6-benzyloxymethylpyridin-3-karboxylové (viz příklad 21a), popřípadě z kyseliny 6-ethyloxymethylpyridin-3-karboxylové (viz příklad 90a) a z odpovídajících sulfonamidových derivátů způsobem, popsáným v příkladech 21b a 90b).

Příklad 309

3-/((4-((n-Butylamino)karbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Teplota tání: 189 až 191 °C (z methanolu)

Příklad 310

3-/((4-(2-((2-Methylpropionylamino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Teplota tání: 156 až 158 °C (po chromatografii na silikagelu za použití eluční soustavy tvořené směsí ethylacetátu, n-heptanu a methanolu v objemovém poměru 5:3:2).

Příklad 311

3-/((4-(2-((4-Methylpentanoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Teplota tání: 109 až 111 °C (po chromatografii na silikagelu za
použití eluční soustavy tvořené směsí ethylacetátu, n-heptanu a
methanolu v objemovém poměru 5:3:2.

Příklad 312

3-/((4-(2-(Fenylethyl)amino)karbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbo-
nyl/-6-benzyloxymethylpyridin

Teplota tání: 175 až 176 °C (z methanolu)

Příklad 313

3-/((4-(2-(fenylethyl)amino)karbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbo-
nyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Teplota tání: 190 až 191 °C (z methanolu)

Příklad 314

3-/((4-(2-((Cyklohexylacetyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-ethoxymethylpyridin

Teplota tání: 201 až 202 °C (ze směsi methanol/diisopropylether)

Příklad 315

3-/((4-(2-(Hexanoylamino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-
ethyloxymethylpyridin

Teplota tání: 175 až 177 °C (z vodného roztoku kyseliny chloro-
vodíkové)

Příklad 316

3-/((4-(2-((4-Methylpentanoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Teplota tání: 156 až 158 °C (z vodného roztoku kyseliny chloro-
vodíkové)

Příklad 317

3-/((4-((n-Butylamino)karbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Teplota tání: 206 až 208 °C (z vodného roztoku kyseliny chlorovodíkové)

Příklad 318

3-/((3-((n-Butylamino)karbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin

Teplota tání: 214 až 216 °C (po chromatografii na silikagelu za použití eluční soustavy tvořené směsí ethylacetátu, n-heptanu a methanolu v objemovém poměru 5:3:2)

Příklad 319

3-/((2-Chlor-5-(((2-(4-fluorfenyl)ethyl)amino)karbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin ve formě amonné soli

Tato sloučenina se získá po chromatografii za použití eluční soustavy tvořené směsí dichlormethanu, methanolu a vodného amoniaku v objemovém poměru 10:4:0,25 jako světlehnědý amorf-
ní produkt. Připraví se postupem, který je analogický s postupem
popsaným v příkladu 125.

Příklad 320

3-/((4-((2-(4-Methoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 321

3-/((4-((2-(3,4-Dimethoxyfenyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 322

3-/((4-((2-(2-Methoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-
amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 323

3-/((4-((2-(4-Fluorfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)ami-
no)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 324

3-/((4-((2-(4-Chlorfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 325

3-/((4-(2-((5-Chlor-2-methoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)-
amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 326

3-/((4-(2-((3,4-Dimethoxyfenylpropionyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)-
amino-karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 327

3-/((4-(2((2-Fenylacetyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-
6-hydroxymethylpyridin

Příklad 328

3-/((4-(2-((Fenoxyacetyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-
6-hydroxymethylpyridin

Příklad 329

3-/((4-(2-((4-Fluorbenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 330

3-/((4-(2-((4-Methylpentanoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 331

3-/((4-(2-((Cyklohexanoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 332

3-/((4-(2-((Cyklohexylacetyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin ve formě amonné soli

Tato sloučenina se připraví z 2,46 g (14,4 mmolu) kyseliny 6-chlormethylpyridin-3-karboxylové postupem, který je analogický s postupem popsáním v příkladu 125. Získá se 1,73 g požadované sloučeniny.

Teplota tání: 140 až 142 °C (po chromatografii na silikagelu za použití eluční soustavy tvořené směsí dichlormethanu, methanolu a vodného amoniaku v objemovém poměru 10:4:0,2)

Příklad 333

3-/((4-(2-((2-Methylpropionyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin ve formě amonné soli

Tato sloučenina se připraví z 2,46 g (14,4 mmolu) kyseliny 6-chlormethylpyridin-3-karboxylové postupem, který je analogický s postupem popsáním v příkladu 125. Získá se 2,48 g požadované sloučeniny

Teplota tání: 178 až 180 °C (po chromatografii provede analogicky jako v příkladu 332.

Příklad 334

3-/((4-(2-((3,4-Dimethoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 335

3-/((4-(2-((3,4-Diethoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 336

3-/((4-(2-((4-n-Butyloxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 337

3-/((4-((5-Chlor-2-methoxybenzoyl)amino)methyl)fenylsulfonyl)ami-
no)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 338

3-/((4-((3,4-Dimethoxyfenylpropionyl)amino)methyl)fenylsulfonyl)-
amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 339

3-/((4-((2-Fenylacetyl)amino)methyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-
hydroxymethylpyridin

Příklad 340

3-/((4-((Fenoxiacetyl)amino)methyl)fenylsulfonyl)karbonyl/-6-hy-
droxymethylpyridin

Příklad 341

3-/((4-((4-Fluorbenzoyl)amino)methyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-
6-hydroxymethylpyridin

Příklad 342

3-/((4-((4-Methylpentanoyl)amino)methyl)fenylsulfonyl)amino)kar-
bonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 343

3-/((4-((Cyklohexanoyl)amino)methyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-
6-hydroxymethylpyridin

Příklad 344

3-/((4-((Cyklohexylacetyl)amino)methyl)fenylsulfonyl)amino)kar-
bonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 345

3-/((4-((2-Methylpropionyl)amino)methyl)fenylsulfonyl)amino)karbo-
nyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 346

3-/((4-((3,4-Dimethoxybenzoyl)amino)methyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 347

3-/((4-((3,4-Diethoxybenzoyl)amino)methyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 348

3-/((4-((4-n-Butyloxybenzoyl)amino)methyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 349

3-/((4-((2-Fenylethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-
6-kaproyloxymethylpyridin

Příklad 350

3-/((4-((2-(4-Methoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-
amino)karbonyl/-6-kaproyloxymethylpyridin

Příklad 351

3-/((4-((2-(3,4-Dimethoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-
amino)karbonyl/-6-kaproyloxymethylpyridin

Příklad 352

3-/((4-((2-(2-Methoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-
amino)karbonyl/-6-kaproyloxymethylpyridin

Příklad 353

3-/((4-((2-(4-Fluorfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)ami-
no)karbonyl/-6-kaproyloxymethylpyridin

Příklad 354

3-/((4-((2-(4-Chlorfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)ami-
no)karbonyl/-6-kaproyloxymethylpyridin

Příklad 355

3-/((4-((2-(4-Methoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-
amino)karbonyl/-6-lauroyloxymethylpyridin

Příklad 356

3-/((4-((2-(3,4-Dimethoxyfenylpropionyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-lauroyloxymethylpyridin

Příklad 357

3-/((4-((2-(2-Methoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-lauroyloxymethylpyridin

Příklad 358

3-/((4-((2-(4-Fluorfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-lauroyloxymethylpyridin

Příklad 359

3-/((4-((2-(4-Chlorfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-lauroyloxymethylpyridin

Příklad 360

3-/((4-((2-(Cyklohexylacetyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-lauroyloxymethylpyridin

Příklad 361

3-/((4-(2-((2-Methylpropionyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-lauroyloxymethylpyridin

Příklad 362

3-/((4-(2-((3,4-Dimethoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-lauroyloxymethylpyridin

Příklad 363

3-/((4-(2-((3,4-Diethoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-lauroyloxymethylpyridin

Příklad 364

3-/((4-(2-((4-n-Butyloxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-lauroyloxymethylpyridin

Příklad 365

3-/((4-((2-(4-Methoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-
amino)karbonyl/-6-palmitoyloxymethylpyridin

Příklad 366

3-/((4-((2-(3,4-Dimethoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-
amino)karbonyl/-6-palmitoyloxymethylpyridin

Příklad 367

3-/((4-((2-(2-Methoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)ami-
no)karbonyl/-6-palmitoyloxymethylpyridin

Příklad 368

3-/((4-((2-(4-Fluorfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)ami-
no)karbonyl/-6-palmitoyloxymethylpyridin

Příklad 369

3-/((4-((2-(4-Chlorfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)ami-
no)karbonyl/-6-palmitoyloxymethylpyridin

Příklad 370

3-/((4-(2-((Cyklohexylacetyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl-6-palmitoyloxymethylpyridin

Příklad 371

3-/((4-(2-((2-Methylpropionyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-palmitoyloxymethylpyridin

Příklad 372

3-/((4-(2-((3,4-Dimethoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-palmitoyloxymethylpyridin

Příklad 373

3-/((4-(2-((3,4-Diethoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-palmitoyloxymethylpyridin

Příklad 374

3-/((4-(2-((4-n-Butyloxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-palmitoyloxymethylpyridin

Příklad 375

3-/((4-((2-(4-Methoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-
amino)karbonyl/-6-stearoyloxymethylpyridin

Příklad 376

3-/((4-((2-(3,4-Dimethoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-
amino)karbonyl/-6-stearoyloxymethylpyridin

Příklad 377

3-/((4-((2-Fenylethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-
6-stearoyloxymethylpyridin

Příklad 378

3-/((4-((2-(4-Fluorfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-stearoyloxymethylpyridin

Příklad 379

3-/((4-((2-(4-Chlorfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-stearoyloxymethylpyridin

Příklad 380

3-/((4-(2-((Cyklohexylacetyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-stearoyloxymethylpyridin

Příklad 381

3-/((4-(2-((2-Methylpropionyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-stearoyloxymethylpyridin

Příklad 382

3-/((4-(2-((3,4-Dimethoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)ami-
no)karbonyl/-6-stearoyloxymethylpyridin

Příklad 383

3-/((4-(2-((3,4-Diethoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-stearoyloxymethylpyridin

Příklad 384

3-/((4-(2-((4-n-Butyloxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-stearoyloxymethylpyridin

Příklad 385

3-/((4-(2-((2-Chlor-5-methoxybenzoyl)amino)methyl)fenylsulfonyl)-
amino)karbonyl/-6-linoyloxymethylpyridin

Příklad 386

3-/((4-(2-((3,4-Dimethoxyfenylpropionyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-linoyloxymethylpyridin

Příklad 387

3-/((4-(2-((2-Fenylacetyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-linoyloxymethylpyridin

Příklad 388

3-/((4-(2-((Fenoxiacetyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-linoyloxymethylpyridin

Příklad 389

3-/((4-(2-((4-Fluorbenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-linoyloxymethylpyridin

Příklad 390

3-/((4-((2-Fenylethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-ethylbutyryl)oxymethylpyridin

Příklad 391

3-/((4-((2-(4-Methoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-ethylbutyryl)oxymethylpyridin

Příklad 392

3-/((4-((2-(3,4-Dimethoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)karbonyl/-6-(2-ethylbutyryl)oxymethylpyridin

Příklad 393

3-/((4-((2-(2-Methoxyfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-

amino)karbonyl/-6-(2-ethylbutyryl)oxymethylpyridin

Příklad 394

3-/((4-((2-(4-Fluorfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-(2-ethylbutyryl)oxymethylpyridin

Příklad 395

3-/((4-((2-(4-Chlorfenyl)ethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-(2-ethylbutyryl)oxymethylpyridin

Příklad 396

3-/((4-(2-((Cyklohexylacetyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)kar-
bonyl/-6-(2-methylbenzoyl)oxymethylpyridin

Příklad 397

3-/((4-(2-((2-Methylpropionyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-(2-methylbenzoyl)oxymethylpyridin

Příklad 398

3-/((4-(2-((3,4-Dimethoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-(2-methylbenzoyl)oxymethylpyridin

Příklad 399

3-/((4-(2-((3,4-diethoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-(2-methylbenzoyl)oxymethylpyridin

Příklad 400

3-/((4-(2-((4-n-Butyloxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)amino)-
karbonyl/-6-(2-methylbenzoyl)oxymethylpyridin

Příklad 401

3-/((4-((n-Butylamino)karbonyl)fenylsulfonyl)-N-acetylamino)-karbonyl/-6-ethyloxymethylpyridin, připravený reakcí z příkladu 317 za použití hydridu sodného v tetrahydrofuranu a acetylchloridu.

Příklad 402

3-/((4-(2-((2-Chlor-5-methoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)-N-acetylamino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin
Teplota tání: 235 °C (za rozkladu) (z diethyletheru)

Příklad 403

3-/((4-(2-((Cyklohexylacetyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)-N-lauroylamino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 404

3-/((4-(2-((Cyklohexylacetyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)-N-kaproylamino)karbonyl/-6-kaproyloxymethylpyridin

Příklad 405

3-/((4-(2-((2-Chlor-5-methoxybenzoyl)amino)ethyl)fenylsulfonyl)-N-stearoylamino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 406

3-/((4-((2-Fenylethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-N-lauroylamino)-karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 407

3-/((4-((2-Fenylethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-N-palmitoyl-

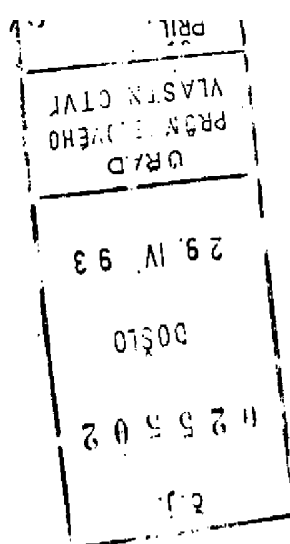
amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin

Příklad 408

3-/((4-((2-Fenylethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-N-lauroyl-
amino)karbonyl/-6-acetoxymethylpyridin

Příklad 409

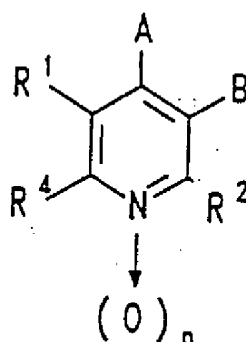
3-/((4-((2-Fenylethyl)aminokarbonyl)fenylsulfonyl)-N-stearoyl-
amino)karbonyl/-6-hydroxymethylpyridin



P A T E N T O V É

N Á R O K Y

1. 4- nebo 5-(Sulf)imido- a (sulfon)amidopyridiny a analogické sloučeniny jakož i jejich pyridin-N-oxidy obecného vzorce I



(I)

ve kterém

A = R^3 a B = $-XNR^6R^7$ nebo
B = R^3 a A = $-XNR^6R^7$ přičemž

X znamená jednoduchou vazbu nebo skupinu $-CO-$ a

R^1 , R^2 a R^3 , které jsou stejné nebo odlišné, znamenají atom vodí-

ku, nesubstituovanou nebo substituovanou alkylovou skupi-

nu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupi-

nu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, atom halogenu,

zejména atom fluoru, atom chloru nebo atom bromu, nitrí-

lovou skupinu, hydroxy-skupinu nebo aminovou skupinu,

R^6 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až

20 uhlíkových atomů nebo N-ochrannou skupinu, jakou je

acylová skupina, alkanoylová skupina obsahující 1 až 20

uhlíkových atomů, alkenoylová skupina obsahující 1 až 20

uhlíkových atomů, alkinoylová skupina obsahující 1 až 20

uhlíkových atomů, aralkanoylová skupina obsahující 7 až 20

uhlíkových atomů, aroylová skupina obsahující 6 až 18 uhlíkových atomů, alkylkarbamoylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxykarbonylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxykarbonylová skupina, acyloxyalkylová skupina, ve které acylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, výhodně alkanoyloxyalkylová skupina, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxykarbonyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů nebo alkoxykarbonyloxyalkylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, fyziologicky použitelný kationt, jako Na^+ , K^+ , Mg^{2+} , Ca^{2+} , Al^{3+} nebo amoniový iont, případně jednou až třikrát substituovaný alkylovou skupinou obsahující 1 až 16 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinou, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 16 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinou, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 16 uhlíkových atomů, fenylovou skupinou, benzylovou skupinou nebo $\text{C}_1\text{-C}_{16}$ -alkylovou skupinou, která může být jednou až třikrát substituována hydroxy skupinou nebo alkoxylovou skupinou obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, nebo kationt báze derivátu aminokyseliny, přičemž aroylový zbytek může být případně substituován,

R^7 znamená skupinu YR^8 , ve které

Y znamená skupinu $-\text{SO}_2-$, $-\text{CO}-$, $-\text{CONR}^9$ nebo $-\text{SO}_2\text{NR}^9$ a

R^8 a R^9 znamenají skupinu $/\text{C-U}/_r\text{-D-W}$, ve které

C znamená vazbu nebo

rozvětvenou nebo nerozvětvenou alifatickou alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 16 uhlíkových atomů nebo cyklalifatickou alkandiylovou skupinu obsa-

hující 3 až 10 uhlíkových atomů nebo rozvětvenou nebo nerozvětvenou alkendiylovou skupinu obsahující 2 až 16 uhlíkových atomů nebo cykloalkendiylovou skupinu nebo alkindiylovou skupinu obsahující 2 až 16 uhlíkových atomů nebo alkenindiylovou skupinu obsahující 2 až 16 uhlíkových atomů, které mohou vždy obsahovat jednu nebo více vícenásobných vazeb uhlík-uhlík,

U znamená vazbu nebo atom vodíku nebo heteroatomovou skupinu zvolenou z množiny zahrnující skupinu -CO-, skupinu -O(CO)-, skupinu -(CO)-O-, skupinu -(CO)NR-, skupinu -NR(CO)-, skupinu -O-, skupinu -SO-, skupinu -SO₂- a skupinu -NR, kde R znamená alkylovou skupinu obsahující 1 až 3 uhlíkové atomy, alkanoylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, aralkanoylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, aroylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů nebo atom vodíku,

r znamená 1, 2, 3 nebo 4,

D znamená vazbu nebo atom vodíku nebo rozvětvenou nebo nerozvětvenou alifatickou alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 10 uhlíkových atomů nebo

rozvětvenou nebo nerozvětvenou alkendiylovou skupinu obsahující 1 až 10 uhlíkových atomů, alkindiylovou skupinu obsahující 2 až 10 uhlíkových atomů nebo alkenindiylovou skupinu obsahující 2 až 10 uhlíkových atomů, které mohou vždy obsahovat jednu nebo více vícenásobných vazeb uhlík-uhlík,

W znamená atom vodíku nebo cykloalifatickou alkylovou, alkenylovou, alkinylovou nebo alkeninylovou skupinu obsahující 3 až 10 uhlíkových atomů nebo aroylovou skupinu obsahující 6 až 16 uhlíkových atomů nebo 5- nebo 6-člennou heteroarylovou skupinu,

příčemž alespoň jeden z obecných substituentů C nebo D nebo W neznamená vazbu a U znamená heteroatomovou skupinu pouze tehdy, kdy C neznamená vazbu, a C, D a/nebo W, pokud neznamenají vazbu nebo atom vodíku, jsou výhodně samy o sobě substituovány,

nebo

R^8 a R^9 jsou také spojeny přes 3 až 6 uhlíkových atomů, přičemž $-NR^8R^9$ tvoří heterocyklický kruh s dusíkem jako heteroatomem,

nebo

R^9 znamená R^6

a

pro skupinu $/C-U/_{r-D-W}$ je vyloučen význam $-SO_2H$,

R^4 znamená skupinu, která může být fyziologicky, zejména v játrech, převedena na karboxylátovou skupinu nebo její soli, přičemž jsou vyloučeny estery a amidy,

n znamená 0 nebo 1,

f znamená 1 až 8, výhodně 1 až 5,

g znamená 0,1 až $(2f+1)$ a

x znamená 0 až 8, výhodně 0 nebo 1.

2. Sloučeniny podle nároku 1 obecného vzorce I, ve kterém

X znamená jednoduchou vazbu nebo skupinu $-CO-$,

R^1 , R^2 a R^3 , které jsou stejné nebo odlišné, znamenají atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, atom halogenu, zejména atom fluoru, atom chloru nebo atom bromu, nitrilovou skupinu, hydroxy-skupinu, aminovou skupinu, případně mono- nebo disubstituovanou alkylovou skupinou obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy, hydroxyalkylovou skupinou, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy nebo alkylkarbonyloxy-skupinou, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,

R^6 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů nebo N-ochrannou skupinu, jakou je acylová

skupina, alkanoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, alkenoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, alkinoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, aralkanoylová skupina obsahující 7 až 20 uhlíkových atomů, aroylová skupina obsahující 6 až 18 uhlíkových atomů, alkylkarbamoylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxykarbonylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxykarbonylová skupina, acyloxyalkylová skupina, ve které acylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, výhodně alkanoyloxyalkylová skupina, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzoyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxykarbonyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů nebo alkoxykarbonyloxyalkylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, fyziologicky použitelný kationt, jako Na^+ , K^+ , Mg^{2+} , Ca^{2+} , Al^{3+} nebo amoniový iont, případně jednou až třikrát substituovaný alkylovou skupinou obsahující 1 až 16 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinou, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 16 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinou, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 16 uhlíkových atomů, fenyllovou skupinou, benzylovou skupinou nebo alkylovou skupinou obsahující 1 až 16 uhlíkových atomů, která může být jednou až třikrát substituována hydroxy-skupinou nebo alkoxy-skupinou obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, nebo kationt báze derivátu aminokyseliny, přičemž arylový zbytek může být případně substituován,

R^7 znamená skupinu YR^8 , ve které

Y znamená skupinu $-\text{SO}_2-$, $-\text{CO}-$, $-\text{CONR}^9$ nebo skupinu $-\text{SO}_2\text{NR}^9$

a

R⁸ a R⁹ znamenají skupinu /C-U/_r-D-W, ve které

C znamená vazbu nebo

rozvětvenou nebo nerozvětvenou alifatickou alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 16 uhlíkových atomů nebo cyklalifatickou alkandiylovou skupinu obsahující 3 až 10 uhlíkových atomů nebo rozvětvenou nebo nerozvětvenou alkendiylovou skupinu obsahující 2 až 16 uhlíkových atomů nebo cykloalkendiylovou skupinu nebo alkindiylovou skupinu obsahující 2 až 16 uhlíkových atomů nebo alkenindiylovou skupinu obsahující 2 až 16 uhlíkových atomů, které mohou vždy obsahovat jednu nebo více vícenásobných vazeb uhlík-uhlík,

U znamená vazbu nebo

atom vodíku nebo

heteroatomovou skupinu zvolenou z množiny zahrnující skupinu -CO-, skupinu -O(CO)-, skupinu -(CO)-O-, skupinu -(CO)NR-, skupinu -NR(CO)-, skupinu -O-, skupinu -SO-, skupinu -SO₂- a skupinu -NR, kde R znamená alkylovou skupinu obsahující 1 až 3 uhlíkové atomy, alkanoylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, aralkanoylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, aroylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů nebo atom vodíku,

r znamená 1, 2, 3 nebo 4,

D znamená vazbu nebo atom vodíku nebo

rozvětvenou nebo nerozvětvenou alifatickou alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 10 uhlíkových atomů nebo

rozvětvenou nebo nerozvětvenou alkendiylovou skupinu obsahující 1 až 10 uhlíkových atomů, alkindiylovou skupinu obsahující 2 až 10 uhlíkových atomů nebo alkenindiylovou skupinu obsahující 2 až 10 uhlíkových atomů, které mohou vždy obsahovat jednu nebo více vícenásobných vazeb uhlík-uhlík,

W znamená

atom vodíku nebo cykloalifatickou alkylovou, alkeny-

lovou, alkinylovou nebo alkeninylovou skupinu obsahující 3 až 10 uhlíkových atomů nebo arylovou skupinu obsahující 6 až 16 uhlíkových atomů nebo 5- nebo 6-člennou heteroarylovou skupinu, přičemž alespoň jeden z obecných substituentů C nebo D nebo W neznamená vazbu a U znamená heteroatomovou skupinu pouze tehdy, kdy C neznamená vazbu, a C, D a/nebo W, pokud neznamenají vazbu nebo atom vodíku, jsou výhodně samy o sobě substituovány kombinací až 5³ stejných nebo odlišných substituentů z množiny zahrnující hydroxylovou skupinu, atom halogenu, kyano-skupinu, trifluormethylovou skupinu, nitro-skupinu, karboxylovou skupinu, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, alkenylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 12 uhlíkových atomech, alkoxyalkoxylóvou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxyskupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, skupinu $-O-CH_2/xC_fH_{(2f+1-g)}F_g$, skupinu $-OCF_2Cl$, skupinu $-OCF_2-CHFCl$,

alkylkarbonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

cinnamoylovou skupinu, alkenylkarbonylovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylkarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkoxykarbonylovou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxykarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkoxykarbonylovou skupinu, ve které aralkoxylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoyloxy-skupinu, alkenylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxykarbonyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxykarbonyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

alkenyloxykarbonyloxy-skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinyloxykarbonyloxy-skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 10 uhlíkových atomech, N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10

uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

karbamoyloxy-skupinu, N-alkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12, N-cykloalkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylkarbamoyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylkarbamoyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aryloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

aminovou skupinu, alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, dialkylaminovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylaminovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenylaminovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylaminovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, N-arylamínovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-aralkylaminovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkylaralkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylamínovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkylaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylamínovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkanoylamínovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, aroylamínovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkanoylamínovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aroyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje

6 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-aminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminoalkylovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aralkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aminoalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkylmerkpto-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfinylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, arylmerkpto-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfinylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, aralkylmerkpto-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje

7 až 16 uhlíkových atomů, aralkylsulfinylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, aralkylsulfonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

sulfamoylovou skupinu, N-alkylsulfamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylsulfamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkylsulfamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylsulfamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylsulfamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylsulfamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylsulfamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, alkylsulfonamidovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(alkyl)-alkylsulfonamidovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkylsulfonamidovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkyl)-aralkylsulfonamidovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

příčemž skupiny, které obsahují arylový zbytek, mohou být samy o sobě na arylovém zbytku substituovány 1, 2, 3, 4 nebo 5 stejnými nebo odlišnými substituenty z množiny zahrnující hydroxylovou skupinu, atom halogenu, kyano-skupinu, trifluormethylovou skupinu, nitro-skupinu, karboxylovou skupinu, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu

obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, alkenylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 12 uhlíkových atomech, alkoxyalkoxylovou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxyskupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, skupinu $-O-CH_2/C_xF_{2f+1-g}H$, skupinu $-OCF_2Cl$, skupinu $-OCF_2-CHFCI$,

alkylkarbonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoylovou skupinu, alkenylkarbonylovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylkarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkoxykarbonylovou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxykarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkoxykarbonylovou skupinu, ve které aralkoxylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu,

ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoyloxy-skupinu, alkenylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxykarbonyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxykarbonyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenyloxykarbonyloxy-skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinyloxykarbonyloxy-skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které arylový

zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 10 uhlíkových atomech, N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

karbamoyloxy-skupinu, N-alkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylkarbamoyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylkarbamoyloxy-skupinu, ve které

alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aryloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

aminovou skupinu, alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, dialkylaminovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylaminovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenylaminovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylaminovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, N-arylaminovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-aralkylaminovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkylaralkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových

atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylamínovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxy-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkanoylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aroyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminoalkylovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aralkanoylaminoalkylovou sku-

pinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aminoalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkylmerkpto-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfinylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, arylmerkpto-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfinylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, aralkylmerkpto-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, aralkylsulfinylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, aralkylsulfonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

sulfamoylovou skupinu, N-alkylsulfamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylsulfamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkylsulfamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylsulfamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylsulfamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylsul-

famoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylsulfa-moylovou skupinu,

alkylsulfonamidovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(alkyl)-alkyl-sulfonamidovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkylsulfonamidovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkyl)-aralkylsulfonamidovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

nebo

R^8 a R^9 jsou také spojeny přes 3 až 6 uhlíkových atomů, přičemž $-NR^8R^9$ tvoří heterocyklický kruh s dusíkem jako hetero-atomem,

nebo

R^9 znamená R^6 a

pro skupinu $/C-U/_{r-D-W}$ je vyloučen význam $-SO_2H$,

R^4 znamená alkylovou skupinu obsahující 1 až 10 uhlíkových atomů, která může být případně substituována hydroxy-skupinou nebo alkoxylovou skupinou obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, aldehydovou skupinu, imino-skupinu, N-alkyliminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, acetalovou skupinu, thioacetalovou skupinu, cyklickou acetalovou skupinu, cyklickou thioacetalovou skupinu nebo jinou skupinu ekvivalentní aldehydové skupině nebo skupinu $-CH_2OR^5$, ve které

R^5 znamená atom vodíku nebo zbytek fyziologicky snesitelné, výhodně v játrech za fyziologických podmínek odštěpitelné, ochranné skupiny alkoholové funkce,

n znamená 0 nebo 1,

f znamená 1 až 8, výhodně 1 až 5,

g znamená 0, 1 až $(2f+1)$ a

x znamená 0 až 8, výhodně 0 nebo 1.

3. Sloučeniny podle nároků 1 nebo 2 obecného vzorce I, ve kterém

X znamená jednoduchou vazbu a Y znamená skupinu $-\text{SO}_2-$ nebo $-\text{CO}-$ nebo

X znamená skupinu $-\text{CO}-$ a Y znamená skupinu $-\text{SO}_2-$, $-\text{CO}-$ nebo $-\text{CONR}^9$, přičemž

R^1 , R^2 a R^3 , které jsou stejné nebo odlišné, znamenají atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, atom halogenu, zejména atom fluoru a atom chloru, hydroxy-skupinu, aminovou skupinu nebo hydroxyalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy,

R^6 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů nebo N-ochrannou skupinu, jakou je acylová skupina, alkanoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, alkenoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, alkinoylová skupina obsahující 1 až 20 uhlíkových atomů, aralkanoylová skupina obsahující 7 až 20 uhlíkových atomů, aroylová skupina obsahující 6 až 18 uhlíkových atomů, alkylkarbamoylová skupina, ve kterém alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxykarbonylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxykarbonylová skupina, acyloxyalkylová skupina, ve které acylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, výhodně alkanoyloxyalkylová skupina, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzoyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzyloxykarbonyloxyalkylová skupina, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů nebo alkoxykarbonyloxyalkylová skupina, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, fyziologicky použitelný kationt, jako Na^+ , K^+ , Mg^{2+} , Ca^{2+} , Al^{3+} nebo amoniový iont, případně jednou až třikrát substituovaný alkylovou skupinou obsahující 1 až 16 uhlíkových atomů, hydroxy-

alkylovou skupinou, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 16 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinou, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 16 uhlíkových atomů, fenylovou skupinou, benzylovou skupinou nebo alkylovou skupinou, která může být jednou až třikrát substituována hydroxyskupinou nebo alkoxylovou skupinou obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, nebo kationt báze derivátu aminokyseliny, přičemž arylový zbytek může být případně substituován,

R^7 znamená skupinu YR^8 ,
ve které

Y má výše uvedený význam a

R^8 a R^9 znamenají skupinu $/C-U/_{r}-D-W$, ve které

C znamená vazbu nebo
rozvětvenou nebo nerozvětvenou alifatickou alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, rozvětvenou nebo nerozvětvenou alkendiylovou skupinu obsahující 2 až 12 uhlíkových atomů, alkindiylovou skupinu obsahující 2 až 12 uhlíkových atomů nebo alkenindiylovou skupinu obsahující 2 až 12 uhlíkových atomů, která může obsahovat jednu nebo více vícenásobných vazeb uhlík-uhlík,

Z znamená vazbu nebo
atom vodíku nebo heteroatomovou skupinu z množiny zahrnující skupinu $-(CO)NR-$, skupinu $-NR(CO)-$, skupinu $-O-$, skupinu $-SO-$ a skupinu $-SO_2-$, kde R znamená alkylovou skupinu obsahující 1 až 3 uhlíkové atomy, alkanoylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, aralkanoylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, aroylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů nebo atom vodíku,

r znamená 1 nebo 2,

D znamená vazbu nebo
atom vodíku nebo
rozvětvenou nebo nerozvětvenou alifatickou alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů
nebo

rozvětvenou nebo nerozvětvenou alkendiylovou skupinu obsahující 2 až 6 uhlíkových atomů nebo alkendiylovou skupinu obsahující 2 až 8 uhlíkových atomů a

W znamená atom vodíku nebo cykloalifatickou alkylovou, alkenylovou, alkinylovou nebo alkeninylovou skupinu obsahující 3 až 10 uhlíkových atomů nebo arylovou skupinu obsahující 6 až 16 uhlíkových atomů nebo 5- nebo 6-člennou heteroarylovou skupinu, přičemž alespoň jeden z obecných substituentů C nebo D nebo W neznamená vazbu a U znamená heteroatomovou skupinu pouze tehdy, kdy C neznamená vazbu, a C, D a/nebo W, pokud neznamenají vazbu nebo atom vodíku, jsou samy o sobě výhodně substituovány kombinací až 5 stejných nebo odlišných substituentů z množiny zahrnující hydroxylovou skupinu, atom halogenu, kyano-skupinu, trifluormethylovou skupinu, nitro-skupinu, karboxylovou skupinu, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, alkenylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 12 uhlíkových atomech, alkoxyalkoxylovou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxyskupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, skupinu $-O-CH_2/xC_fH_{(2f+1-g)}F_g$, skupinu $-OCF_2Cl$, skupinu $-OCF_2-CHFCl$,

alkylkarbonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoylovou skupinu, alkenylkarbonylovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylkarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkoxykarbonylovou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxykarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkoxykarbonylovou skupinu, ve které aralkoxylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoyloxy-skupinu, alkenylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 10 uhlíkových atomech, N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

aminovou skupinu, alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů,

dialkylaminovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylaminovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenylaminovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylaminovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, N-arylaminovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-aralkylaminovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkylaralkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxy-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkanoylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aroyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkanoyl-N-alkylaminovou

skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminoalkylovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aralkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aminoalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkylmerkpto-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfinylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, arylmerkpto-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfinylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, aralkylmerkpto-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, aralkylsulfinylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16

uhlíkových atomů, aralkylsulfonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

příčemž skupiny, které obsahují arylový zbytek, mohou být samy o sobě a arylovém zbytku substituovány 1, 2, 3, 4 nebo 5 stejnými nebo odlišnými substituenty z množiny zahrnující atom vodíku, hydroxylovou skupinu, atom halogenu, kyano-skupinu, tri-fluormethyllovou skupinu, nitro-skupinu, karboxylovou skupinu, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, alkenylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 12 uhlíkových atomech, alkoxyalkoxylovou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxyskupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, skupinu $-O-/CH_2/_x C_f H_{(2f+1-g)} F_g$, skupinu $-OCF_2 Cl$, skupinu $-OCF_2 -CH_2 Cl$,

alkylkarbonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoylovou skupinu, alkenylkarbonylovou skupinu,

ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylkarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkoxykarbonylovou skupinu, ve které každý alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, aryloxykarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkoxykarbonylovou skupinu, ve které aralkoxylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinyloxykarbonylovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoyloxy-skupinu, alkenylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkynylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které arylový

zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový i alkylový zbytek obsahuje po 1 až 10 uhlíkových atomech, N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

aminovou skupinu, alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, dialkylaminovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylaminovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, alkenylaminovou skupinu, ve které alkenylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylaminovou skupinu, ve které alkinylový zbytek obsahuje 3 až 12 uhlíkových atomů, N-arylaminovou skupinu, ve které arylový zbytek obsa-

huje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-aralkylaminovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkylaralkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 5 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl - aarylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 5 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxy-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkanoylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aroyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový

zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminoalkylovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aralkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aminoalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylaminoalkylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkylmerkpto-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfinylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, alkylsulfonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, arylmerkpto-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfinylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, arylsulfonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, aralkylmerkpto-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, aralkylsulfinylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, aralkylsulfonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

nebo

R^8 a R^9 jsou také spojeny přes 3 až 6 uhlíkových atomů, přičemž $-NR^8R^9$ tvoří heterocyklický kruh s dusíkem jako hetero-

- atmem,
- nebo
- R^9 znamená R^6
- a pro skupinu $/C-U/_{r-D-W}$ je vyloučen význam $-SO_2H$,
- R^4 znamená methylovou skupinu nebo skupinu $-CH_2OR^5$, ve které
- R^5 znamená atom vodíku nebo zbytek fyziologicky nesitelné, výhodně v játrech za fyziologických podmínek odštěpitelné, ochranné skupiny alkoholové funkce,
- n znamená 0 nebo 1,
- f znamená 1 až 8, výhodně 1 až 5,
- g znamená 0, 1 až $(2f+1)$ a
- x znamená 0 až 8, výhodně 0 nebo 1.

4. Sloučeniny podle jednoho nebo několika z nároků 1 až 3 obecného vzorce I, ve kterém

- A znamená R^3 a B znamená skupinu $-XNR^6R^7$,
- X znamená jednoduchou vazbu a Y znamená skupinu $-SO_2-$ nebo CO nebo
- X znamená skupinu CO a Y znamená skupinu $-SO_2$ nebo $-CONR^9$ a R^1 , R^2 a R^3 , které jsou stejné nebo odlišné, znamenají atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 3 uhlíkové atomy, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 3 uhlíkové atomy, hydroxy-skupinu, atom fluoru nebo atom chloru,
- R^6 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů nebo N-ochrannou skupinu, jakou je acylová skupina, alkanoylová skupina obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, alkenoylovou skupinu obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, případně substituovanou benzoylovou skupinu, 1-, 2-, 3- nebo 4-mocný fyziologicky použitelný kationt, zejména Na^+ , K^+ , Ca^{2+} , Mg^{2+} , Al^{3+} nebo amoniový aniont, případně jednou až třikrát substituovaný alkylovou skupinou obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinou obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinou, ve které alkoxylový zbytek obsahuje

1 až 4 uhlíkové atomy a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, fenylovou skupinou, benzylovou skupinou nebo alkylovou skupinou obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, která může být jednou až třikrát substituována hydroxy-skupinou nebo alkoxylovou skupinou obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, přičemž arylový zbytek může být případně substituován, nebo kationt báze derivátu aminokyseliny,

R⁷

znamená skupinu YR⁸, ve které

Y má výše uvedený význam a

R⁸ znamená skupinu /C-U/_r-D-W, ve které

C znamená vazbu nebo alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů,

U znamená vazbu nebo atom vodíku nebo -O-,

r znamená 1,

D znamená vazbu nebo atom vodíku nebo nerozvětvenou alifatickou alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů a

W znamená atom vodíku, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů nebo 5- nebo 6-člennou heteroarylovou skupinu, přičemž alespoň jeden z obecných substituentů C nebo D nebo W neznámá vazbu a U znamená heteroatomovou skupinu pouze tehdy, když C neznámá vazbu nebo když D a/nebo W neznámají vazbu, a W, pokud W neznámá atom vodíku, je výhodně sám o sobě substituován až 3 stejnými nebo různými substituenty zvolenými z množiny zahrnující hydroxylovou skupinu, atom halogenu, kyano-skupinu, trifluormethylovou skupinu, nitro-skupinu, karboxylovou skupinu, alkylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, alkenylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, alkinylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aryloxy-skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aral-

kyloxy-skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, skupinu $-O-CH_2/C_xF_{2f+1}H_{2f+1-G}F_g$, alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aryloxykarbonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkoxykarbonylovou skupinu, ve které aralkoxylový zbytek obsahuje 7 až 14 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, arylkarbonyloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylkarbonyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, cinnamoyloxy-skupinu,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkylarylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkylaralkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)-karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)-

karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

aminovou skupinu, alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, dialkylaminovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkylaminovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylamínovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-aralkylaminovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-aralkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 3 uhlíkové atomy a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů,

alkanoylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkanoylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aroyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů,

alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminoalkylovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, aralkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,

alkylmerkpto-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, alkylsulfinylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, alkylsulfonylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, arylmerkpto-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, arylsulfinylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, arylsulfonylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylmerkpto-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 14 uhlíkových atomů, aralkylsulfinylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 14 uhlíkových atomů, aralkylsulfonylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 14 uhlíkových atomů,

přičemž skupiny, které obsahují arylový zbytek, mohou být samy o sobě na arylovém zbytku substituovány 1, 2, 3, 4 nebo 5 stejnými nebo odlišnými substituenty zvolenými z množiny zahrnující atom vodíku, hydroxylovou skupinu, atom halogenu, kyano-skupinu, trifluormethylovou skupinu, nitro-skupinu, karboxylovou skupinu, alkylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, alkenylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, alkinylovou skupinu obsahující

3 až 12 uhlíkových atomů, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, aryloxy-skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkyloxy-skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, skupinu $-O-CH_2/C_xH_{2f+1-g}F_g$, alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylkarbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-aralkylkarbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-alkylarylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů, N-alkylaralkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)-karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)-

karbamoylovou skupinu, ve které první alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a druhý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aryloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které první alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, arylový zbytek obsahuje 6 až 16 uhlíkových atomů a druhý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(aralkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které první alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, aralkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a druhý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,

aminovou skupinu, alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, dialkylaminovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, cykloalkylaminovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-arylaminovou skupinu, ve které arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, N-aralkylaminovou skupinu, ve které aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkylaralkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 3 uhlíkové atomy a aralkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkylarylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 3 uhlíkové atomy a arylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyaminovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů,

alkanoylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, aroylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkanoylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 12 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,

cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, aroyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, aralkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,

alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, cykloalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, aroylaminoalkylovou skupinu, ve které aroylový zbytek obsahuje 6 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, aralkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které aralkanoylový zbytek obsahuje 7 až 12 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy,

R^9 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, fenylovou skupinu, která je případně jednou substituována, nebo

R^8 a R^9 jsou spojeny přes skupinu $(-CH_2-)_i$, přičemž $-NR^8R^9$ tvoří kruh a i může znamenat 3, 4, 5 nebo 6, a

pro skupinu $/C-U/_r-D-W$ je vyloučen význam $-SO_2H$,

R^4 znamená methylovou skupinu nebo skupinu $-CH_2OR^5$, ve které

R^5 znamená atom vodíku nebo zbytek fyziologicky snesitelné, výhodně v játrech za fyziologických podmínek odštěpitelné, ochranné skupiny alkoholové funkce,

n znamená 0 nebo 1,

f znamená 1 až 8, výhodně 1 až 5,

g znamená 0, 1 až $(2f+1)$ a

x znamená 0 až 8, výhodně 0 nebo 1.

5. Sloučeniny podle jednoho nebo několika z nároků 1 až 4 obecného vzorce I, ve kterém

A znamená R^3 a B znamená skupinu $-XNR^6R^7$,

X znamená jednoduchou vazbu a Y znamená skupinu $-SO_2-$ nebo

X znamená skupinu $-CO-$ a Y znamená skupinu $-SO_2-$ nebo $-CONR^9$,

R^1 , R^2 a R^3 znamenají atom vodíku,

R^6 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů nebo acylovou skupinu, jakou je alkanoylová skupina obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, alkenoylová skupina obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů nebo případně substituovaná benzoylová skupina, nebo 1-, 2- nebo 3-mocný fyziologicky použitelný kationt, zejména Na^+ , K^+ , Mg^+ , Ca^+ nebo amoniový iont, případně jednou až třikrát substituovaný alkylovou skupinou obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinou obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinou, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, fenylovou skupinou, benzylovou skupinou nebo alkylovou skupinou obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, která může být jednou až třikrát substituována hydroxy-skupinou nebo alkoxylovou skupinou obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy, jako například $NH_3^+C(CH_2OH)_3$ nebo kationt báze derivátu aminokyseliny,

R^7 znamená skupinu YR^8 s výjimkou $-SO_2H$, ve které

Y má výše uvedený význam a

R^8 znamená skupinu $/C-U/_r-D-W$, ve které

C znamená vazbu nebo alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy,

U znamená vazbu, atom vodíku nebo $-O-$,

r znamená 1,

D znamená vazbu, atom vodíku nebo alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkové atomy,

W znamená atom vodíku nebo fenylovou skupinu, přičemž alespoň jeden z obecných substituentů C nebo D nebo

W neznámá vazbu a U znamená $-O-$ pouze tehdy, kdy C nezná-

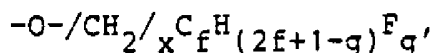
mená vazbu a W je substituován substituenty zvolenými z množiny zahrnující atom vodíku, atom fluoru, atom chlóru, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 uhlíkových atomů, aralkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, alkenylovou skupinu obsahující 3 až 12 uhlíkových atomů, fenylovou skupinu, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, fenoxyskupinu, $-O-CH_2/xC_fH_{(2f+1-g)}F_g$, karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-fenylkarbamoylovou skupinu, N-fenylalkylkarbamoylovou skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-fenylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů,

N-alkyl-N-fenylalkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-(fenoxalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-(fenylalkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(fenoxalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které každá alkylová skupina obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-(fenylalkyloxyalkyl)karbamoylová skupina, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových

atomů a fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů,

alkanoylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, fenylaminovou skupinu, fenylalkanoylaminovou skupinu, ve které fenylalkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, fenylalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které fenylalkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, fenylaminoalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, fenylalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které fenylalkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů,

příčemž skupiny, které obsahují arylový zbytek, mohou být samy o sobě substituovány na arylovém zbytku 1, 2, 3, 4 nebo 5 stejnými nebo odlišnými substituenty zvolenými z množiny zahrnující hydroxylovou skupinu, karboxylovou skupinu, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy, fenoxyskupinu, benzyloxy-skupinu, atom fluoru, atom chloru, trifluormethylovou skupinu, skupinu



alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 9 uhlíkových atomů, fenoxycarbonylovou skupinu, fenylalkoxykarbonylovou skupinu, ve které fenylalkoxylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, benzyloxy-skupinu, fenylalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů,

alkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, fenoxycarbonyloxy-skupinu, fenylalkyloxykarbonyloxy-skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-fenylkarbamoylovou skupinu, N-fenylalkylkarbamoylovou skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, hydroxyalkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, acyloxyalkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy,

karbamoyloxy-skupinu, N-alkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylový zbytek, ve kterém cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

- R^9 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy nebo fenylovou skupinu,
 R^4 znamená skupinu $-CH_2OR^5$, ve které
 R^5 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, případně substituovanou benzylovou skupinu, alkanoylovou skupinu obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, alkenoylovou skupinu obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů nebo případně substituovanou benzoylovou skupinu,
 n znamená 0,
 f znamená 1 až 5,
 g znamená 0,1 až $(2f+1)$ a
 x znamená 0 nebo 1.

6. Sloučeniny podle jednoho nebo několika z nároků 1 až 5 obecného vzorce I, ve kterém

A znamená R^3 a B znamená $-XNR^6R^7$,

X znamená skupinu $-CO-$,

R^1 , R^2 a R^3 znamenají atom vodíku,

R^6 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, alkanoylovou skupinu obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, alkenoylovou skupinu obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, benzoylovou skupinu nebo 1- nebo 2-mocný fyziologicky použitelný kationt, zejména Na^+ , K^+ , Mg^+ nebo Ca^+ nebo amoniový iont, případně jednou až třikrát substituovaný alkylovou skupinou obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, hydroxyalkylovou skupinou obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinou, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy a alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, fenylovou skupinou, benzylovou skupinou nebo alkylovou skupinou obsahující 1 až 8 uhlíkových atomů, která může být případně jednou až třikrát substituována hydroxy-skupinou nebo alkoxylovou skupinou obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy,

R⁷

znamená skupinu YR⁸ s výjimkou -SO₂H, ve které

Y znamená skupinu -SO₂- a

R⁸ znamená skupinu /C-U/_r-D-W, ve které

C znamená vazbu nebo přímou alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy,

U znamená vazbu, atom vodíku nebo -O-,

r znamená 1,

D znamená vazbu, atom vodíku nebo přímou alkandiylovou skupinu obsahující 1 až 4 uhlíkové atomy,

W znamená atom vodíku nebo fenylovou skupinu, přičemž alespoň jeden z obecných substituentů C nebo D nebo W neznámá vazbu a U znamená -O- pouze tehdy, kdy C neznámá vazbu a

W je substituován substituenty zvolenými z množiny zahrnujícími atom vodíku, atom fluoru, atom chloru, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, fenyalkylovou skupinu obsahující 7 až 16 uhlíkových atomů, fenylovou skupinu, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, fenoxyskupinu, skupinu -O-/CH₂/_xC_fH_(2f+1-g)F_g'

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-fenylkarbamoylovou skupinu, N-fenylalkylkarbamoylovou skupinu, ve které fenyalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-alkyl-

N-fenylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-alkyl-N-fenylalkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a fenyalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 3 uhlíkové atomy a alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, N-

(fenoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, N-(fenylalkyloxyalkyl)-karbamoylovou skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, N-alkyl-N-(alkoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které první alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 3 uhlíkové atomy a druhý alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, N-alkyl-N-(fenoxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které první alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a druhý alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, N-alkyl-N-(fenylalkyloxyalkyl)karbamoylovou skupinu, ve které první alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 16 uhlíkových atomů a druhý alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy,

alkanoylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů, cykloalkanoylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, fenylaminovou skupinu, fenylalkanoylaminovou skupinu, ve které fenylalkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, alkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, cykloalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, benzoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, fenylalkanoyl-N-alkylaminovou skupinu, ve které fenylalkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,

alkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkanoylový zbytek obsahuje 1 až 10 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 nebo 2 uhlíkové atomy, cykloalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které cykloalkanoylový zbytek obsahuje

3 až 8 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 nebo 2 uhlíkové atomy, benzoylaminoalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 nebo 2 uhlíkové atomy, fenylalkanoylaminoalkylovou skupinu, ve které fenylalkanoylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů a alkylový zbytek obsahuje 1 nebo 2 uhlíkové atomy,

příčemž skupiny, které obsahují arylový zbytek, mohou být samy o sobě substituovány na arylovém zbytku 1, 2, 3, 4 nebo 5 stejnými nebo odlišnými substituenty zvolenými z množiny zahrnující hydroxy-skupinu, karboxylovou skupinu, alkoxylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, fenoxyskupinu, benzyloxy-skupinu, atom fluoru, atom chlóru, trifluomethylovou skupinu,

alkoxykarbonylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 9 uhlíkových atomů, fenoxycarbonylovou skupinu, fenylalkoxykarbonylovou skupinu, ve které fenylalkoxylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, cykloalkoxykarbonylovou skupinu, ve které cykloalkoxylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

alkylkarbonyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, benzoyloxy-skupinu, fenylalkylkarbonyloxy-skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů,

karbamoylovou skupinu, N-alkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoylovou skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů, N-fenylkarbamoylovou skupinu, N-fenylalkylkarbamoylovou skupinu, ve které fenylalkylový zbytek obsahuje 7 až 11 uhlíkových atomů, hydroxyalkylkar-

bamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy, acyloxyalkylkarbamoylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy,

karbamoyloxy-skupinu, N-alkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, N,N-dialkylkarbamoyloxy-skupinu, ve které každý alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů a N-cykloalkylkarbamoylovou skupinu, ve které cykloalkylový zbytek obsahuje 3 až 8 uhlíkových atomů,

R^4 znamená skupinu $-CH_2OR^5$, ve které

R^5 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, případně substituovanou benzylovou skupinu, alkanoylovou skupinu obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů, alkenoylovou skupinu obsahující 1 až 18 uhlíkových atomů nebo případně substituovanou benzoylovou skupinu,

n znamená 0,

f znamená 1 až 5,

g znamená 0, 1 až $(2f+1)$ a

x znamená 0 nebo 1.

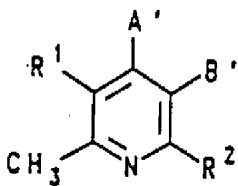
7. Sloučeniny podle nároků 1 až 6 ve formě fyziologicky využitelných solí, přičemž k vytvoření těchto solí dochází na obecném substituentu R^6 .

8. Sloučeniny podle nároků 1 až 7 proti fibrosním chorobám.

9. Sloučeniny podle nároků 1 až 7 pro použití jako fibro-supresiva.

10. Léčivo, v y z n á č e n é t í m , že obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I podle nároků 1 až 7 a případně farmaceuticky přijatelný nosič.

15. Způsob přípravy sloučenin podle jednoho nebo několika z nároků 1 až 7 obecného vzorce I, ve kterém X znamená jednoduchou vazbu a R^1 až R^9 mají významy uvedené v nárocích 1 až 6, v y - z n a č e n ý t í m , že se sloučenina obecného vzorce I


$$\begin{array}{l} A' = R^3 \quad \text{a} \quad B' = NHR^6 \quad \text{nebo} \\ A' = NHR^6 \quad \text{a} \quad B' = R^3, \end{array}$$

uvede v reakci s derivátem sulfonové kyseliny obecného vzorce 2

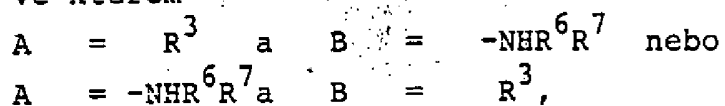
050811
D05LO
07 IX 93
(1)



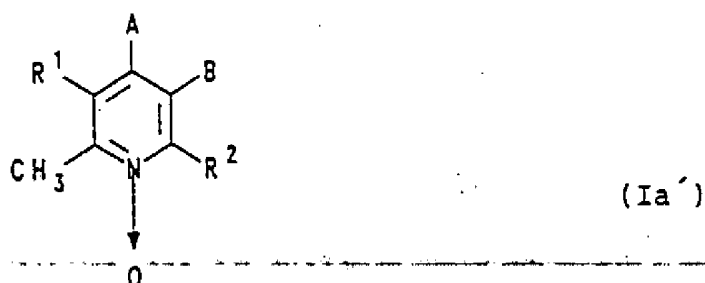
ve kterém Z znamená odlučitelnou skupinu, za vzniku sloučeniny obecného vzorce Ia



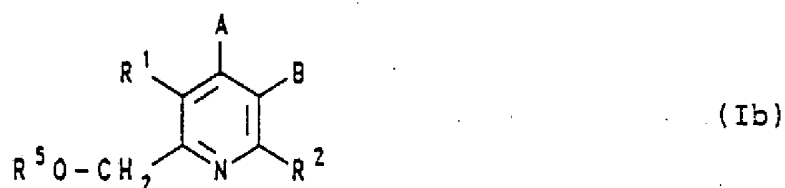
ve kterém



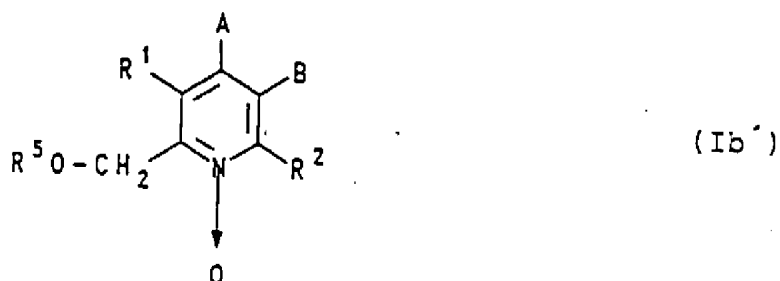
načež se tato sloučenina případně oxiduje na sloučeninu obecného vzorce Ia'



nebo se sloučenina obecného vzorce Ia monohalogenuje na methylové skupině a potom uvede v reakci s HOR^5 za vzniku sloučeniny obecného vzorce Ib



přičemž se tato sloučenina potom případně oxiduje na odpovídající pyridin-N-oxid obecného vzorce Ib'



nebo se sloučenina obecného vzorce Ia' uvede v reakci s anhydridem v kyselé oblasti pH za vzniku sloučeniny obecného vzorce Ib.

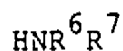
16. Způsob přípravy sloučenin podle jednoho nebo několika z nároků 1 až 7 obecného vzorce I, ve kterém X znamená skupinu -CO- a R¹ až R⁷ mají významy podle nároků 1 až 3, v y z n a č e n ý t í m , že se sloučenina obecného vzorce 4



ve kterém

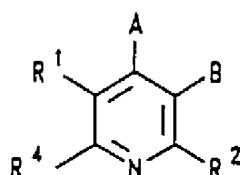
A'' = R³ a B'' = -CO₂H nebo
A'' = -CO₂H a B'' = R³,

uvede v reakci se sloučeninou obecného vzorce 5



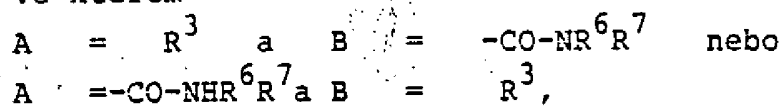
(5)

za vzniku sloučeniny Ic

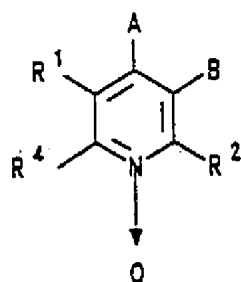


(Ic)

ve kterém

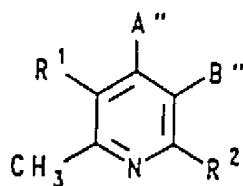


a tato sloučenina se případně oxiduje na odpovídající pyridin-N-oxid obecného vzorce Ic'



(Ic')

17. Způsob přípravy sloučenin podle jednoho nebo několika z nároků 1 až 7 obecného vzorce I, ve kterém X znamená skupinu -CO, Y znamená skupinu SO₂ a R¹ až R⁹ mají významy uvedené v nárocích 1 až 6, v y z n a č e n ý t í m, že se sloučenina obecného vzorce 6



(6)

ve kterém

$A'' = R^3$ a $B'' = -CO_2R$ nebo

$A'' = -CO_2R$ a $B'' = R^3$ a

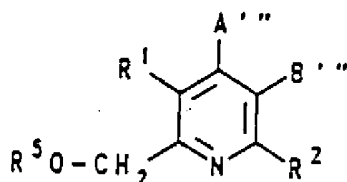
R znamená atom vodíku nebo alkylovou skupinu obsahující 1 až 5 uhlíkových atomů,

uvede v reakci s halogenačním činidlem 7 pro methylovou skupinu, načež se halogenovaná sloučenina uvede v reakci s aminem obecného vzorce H_2NR^6 , potom s derivátem sulfonové kyseliny obecného vzorce 2



(2)

ve kterém Z znamená odlučitelnou skupinu, a potom se sloučeninou obecného vzorce MOR^5 za vzniku sloučeniny obecného vzorce Id

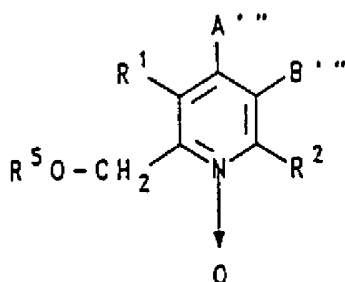


(Id)

ve kterém

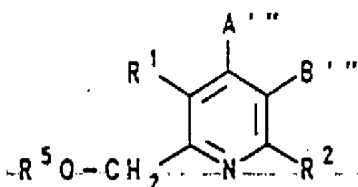
$A''' = R^3$ a $B''' = -CONHR^6R^7$ nebo
 $A''' = -CONHR^6R^7$ a $B''' = R^3$,

a tato sloučenina se případně oxiduje na sloučeninu obecného vzorce Id'



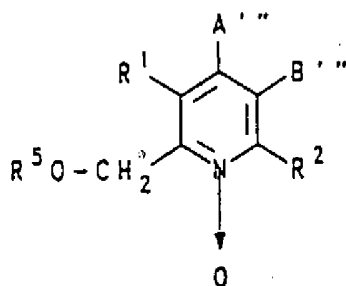
(Id')

nebo se sloučenina obecného vzorce 6 po předcházející halogenaci uvede v reakci nejdříve se sloučeninou obecného vzorce MOR^5 , potom s aminem obecného vzorce R^6NH_2 nebo HNR^6R^7 a potom se sloučeninou obecného vzorce 2 za vzniku sloučeniny obecného vzorce Id



(Id)

načež se tato sloučenina případně oxiduje na odpovídající pyridin-N-oxid obecného vzorce Id'



(Id')

Zastupuje: