(19) **Bundesrepublik Deutschland**
Deutsches Patent- und Markenamt

(10) **DE 698 21 898 T2** 2004.08.19

(12) # Übersetzung der europäischen Patentschrift

(97) **EP 0 927 718 B1**
(21) Deutsches Aktenzeichen: **698 21 898.1**
(96) Europäisches Aktenzeichen: **98 122 554.3**
(96) Europäischer Anmeldetag: **02.12.1998**
(97) Erstveröffentlichung durch das EPA: **07.07.1999**
(97) Veröffentlichungstag der Patenterteilung beim EPA: **25.02.2004**
(47) Veröffentlichungstag im Patentblatt: **19.08.2004**

(51) Int Cl.[7]: **C07D 215/38**
C07D 215/22, C07D 215/48, C07D 215/40, C07D 401/12, C07D 405/04, C07C 235/16, A61K 31/47

(30) Unionspriorität:
33289497 03.12.1997 JP

(84) Benannte Vertragsstaaten:
AT, CH, DE, FR, GB, IT, LI

(73) Patentinhaber:
Dainippon Ink and Chemicals, Inc., Tokio/Tokyo, JP

(74) Vertreter:
Patent- und Rechtsanwälte Kraus & Weisert, 80539 München

(72) Erfinder:
Takagaki, Hidetsugu, Sakura-shi, Chiba-ken, JP; Yamaguchi, Shinobu, Katsushika-ku, Tokyo, JP; Abe, Masayoshi, Chiba-shi, Chiba-ken, JP; Sakai, Mitsuru, Sakura-shi, Chiba-ken, JP; Misumi, Osamu, Sakura-shi, Chiba-ken, JP

(54) Bezeichnung: **Quinolinon Derivate, Verfahren zu ihrer Herstellung und anti-allergisches Wirkstoff**

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzureichen und zu begründen. Er gilt erst als eingelegt, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99 (1) Europäisches Patentübereinkommen).

Die Übersetzung ist gemäß Artikel II § 3 Abs. 1 IntPatÜG 1991 vom Patentinhaber eingereicht worden. Sie wurde vom Deutschen Patent- und Markenamt inhaltlich nicht geprüft.

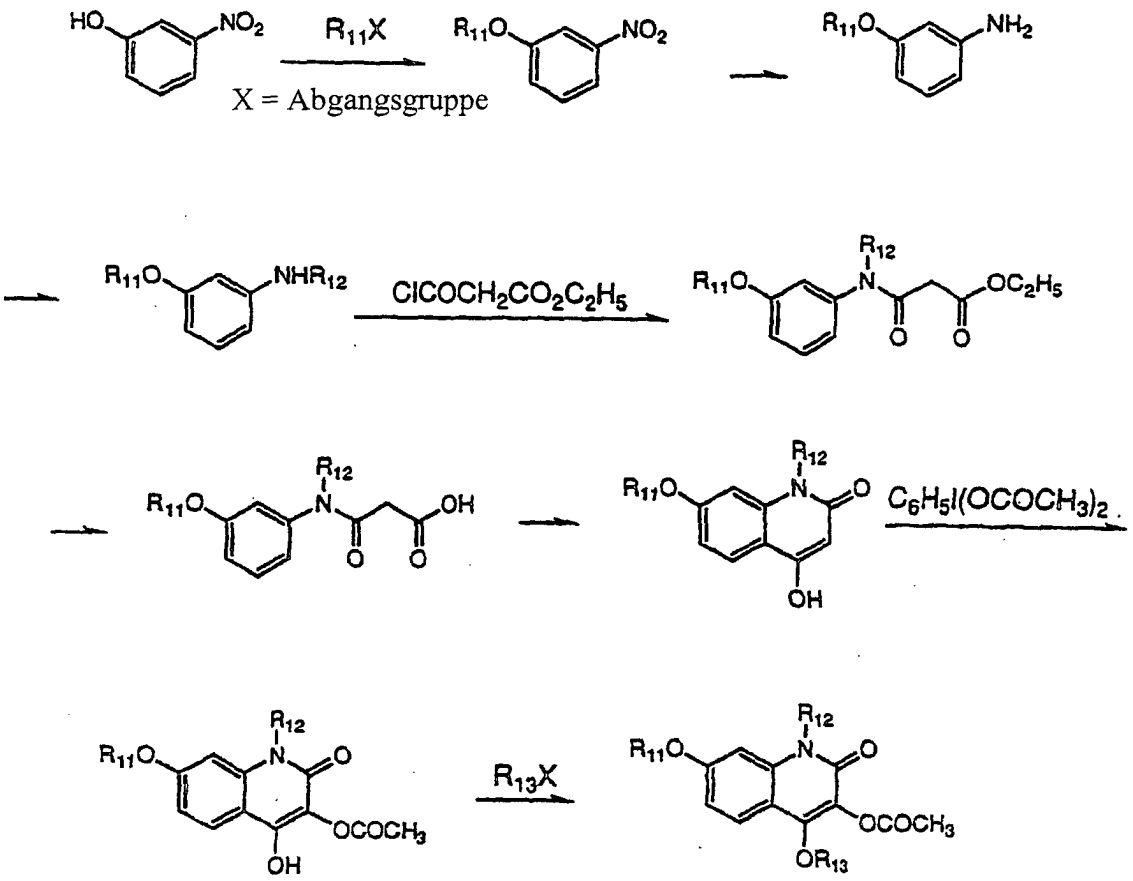
Beschreibung

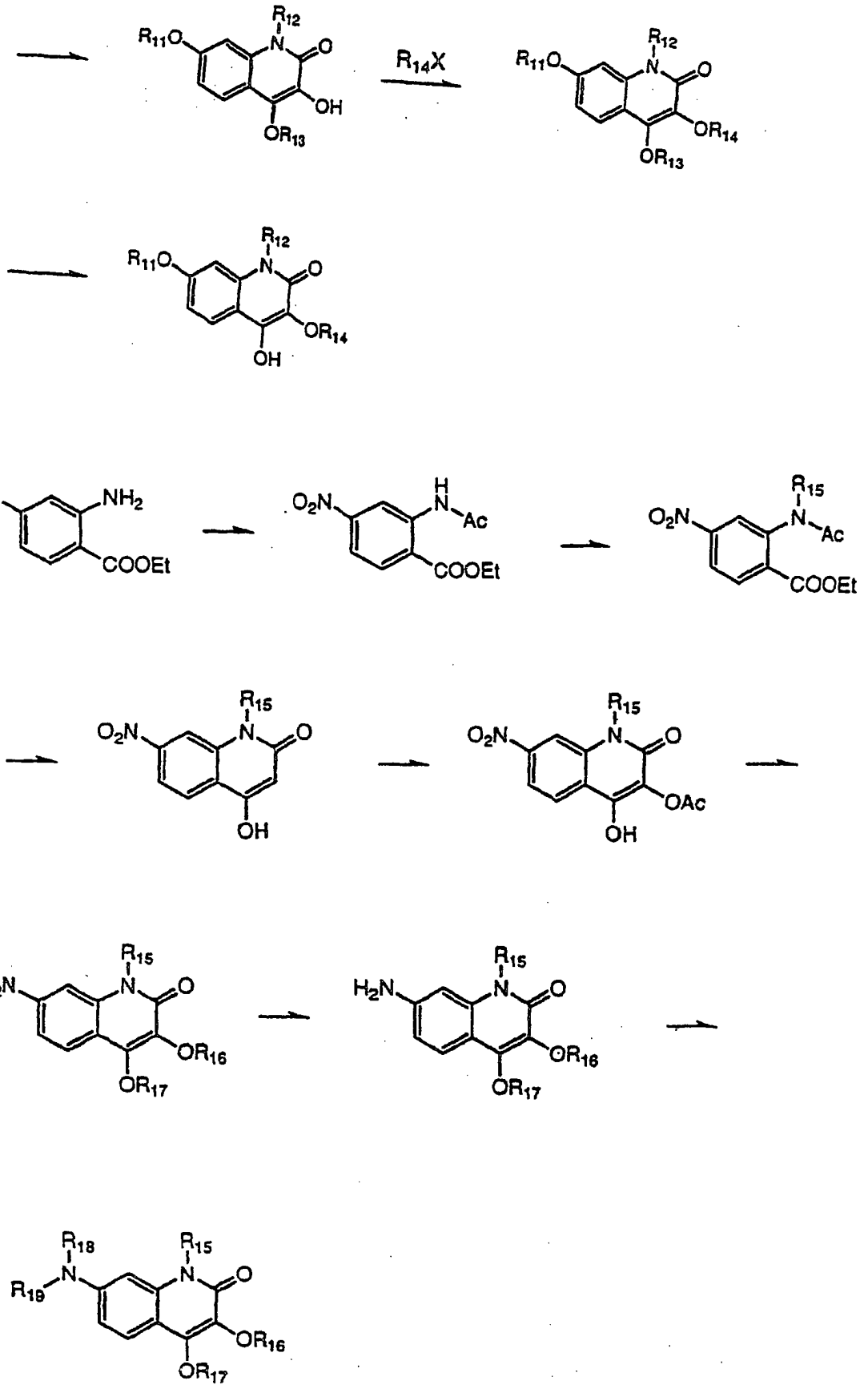
Gebiet der Erfindung

[0001] Die vorliegende Erfindung betrifft ein einfaches Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats, das als eine Arznei wirksam ist, z. B. als ein Mittel zur Behandlung allergischer Erkrankungen und dergleichen; und ein neues Amidderivat, das als eine Zwischenstufe in dem Verfahren wirksam ist.

Stand der Technik

[0002] Die Erfinder der vorliegenden Erfindung haben gefunden, dass ein Chinolinonderivat mit einem Substituenten in der 7-Position und physiologische Salze davon sowohl gegen Überempfindlichkeitsreaktionen vom Sofort-Typ als auch gegen Überempfindlichkeitsreaktionen vom verzögerten Typ wirksam sind, wobei sie äußerst nützlich als ein Wirkstoff mit wenigen Nebenwirkungen sind, wie in der japanischen Patentanmeldung, Erste Anmeldung Nr. Hei 09-100267 und der japanischen Patentanmeldung, Erste Anmeldung Nr. Hei 09-255659 offenbart ist. Ein Verfahren zur Herstellung eines derartigen Chinolinonderivats wurde sowohl in der japanischen Patentanmeldung, Erste Anmeldung Nr. Hei 09-100267 als auch in der japanischen Patentanmeldung, Erste Anmeldung Nr. Hei 09-255659, wie unten gezeigt, offenbart.





[0003] Jedoch war es in dem Herstellungsverfahren, das in diesen Druckschriften offenbart ist, besonders dann, wenn eine Verbindung mit einem Substituenten in der 3-Stellung hergestellt wird, notwendig, einen komplexen Reaktionsweg zu durchlaufen, der die Schritte des Einführens einer Schutzgruppe, Entschützen, Einführen eines Substituenten und dann wiederum Entschützen enthält. Somit war das Verfahren nicht notwendi-

gerweise ausreichend für eine industrielle Anwendung.

[0004] Beispiele anderer Chinolinonderivate und Verfahren zur Herstellung derselben enthalten Monatsh. Chem. 98 (1), S. 100–104, 1967, das Daten der Infrarotabsorptionsspektren für 3-Methoxy-4-hydroxy-2(1H)-chinolinon, 3-Ethoxy-4-hydroxy-2(1H)-chinolinon und 3,4-Dimethoxy-2(1H)-chinolinon als Chinolinonverbindungen mit Substituenten in den 3- und 4-Positionen des Stickstoff enthaltenden Rings von Chinolinon offenbart, während Substituenten am Ring der aromatischen Gruppe fehlen.

[0005] Monatsh. Chem., 99(6), S. 2157–2166, 1968 offenbart ebenfalls ein Verfahren zur Herstellung von 3,4-Dihydroxy-2(1H)-chinolinon und 3,4-Dihydroxy-1-phenyl-2(1H)-chinolinon.

[0006] Zusätzlich offenbart Liebigs Ann. Chem., 9, S. 1545–1551, 1973 ein Verfahren zur Herstellung von 3,4-Dihydroxy-1-phenyl-2(1H)-chinolinon und 3,4-Diacetoxy-1-phenyl-2(1H)-chinolinon.

[0007] Darüber hinaus offenbart Chem. Ber. 106, S. 1537–1548, 1973 ein Verfahren zur Herstellung von 3,4-Dihydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon und Z. Naturforsch. B; Anorg. Chem, Org. Chem, 33B (4), S. 429–1432, 1978, umfasst ein Verfahren zur Herstellung von 3,4-Dihydroxy-1-phenyl-2(1H)-chinolinon.

[0008] Monatsh. Chem, 115(2), S. 231–242, 1984, umfasst ein Verfahren zur Herstellung von 3,4-Dihydroxy-2(1H)-chinolinon, 3-Methoxy-4-hydroxy-2(1H)-chinolinon, 3-Ethoxy-4-hydroxy-2(1H)-chinolinon, 3-Propoxy-4-hydroxy-2(1H)-chinolinon, 3-Trifluoracetoxy-4-hydroxy-2(1H)-chinolinon, 3-Acetoxy-4-hydroxy-2(1H)-chinolinon, 3-Acetoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon und 3-Methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon.

[0009] Phosphorus and Sulfur, 21(1), S. 47–52, 1984 offenbart 3,4-Dihydroxy-2(1H)-chinolinon-3-dimethylphosphat, 3-Hydroxy-4-methoxy-2(1H)-chinolinon-3-dimethylphosphat, 3,4-Dihydroxy-2(1H)-chinolinon-3-diethylphosphat, 3,4-Dihydroxy-2(1H)-chinolinon-3-diisopropylphosphat und N-Methylderivate dieser Verbindungen.

[0010] FEBS Lett., 246(1–2), S. 113–116, 1989, offenbart ein Verfahren zur Herstellung von 3,4-Dihydroxy-2(1H)-chinolinon. Phytochemistry, 28(5), S. 1517–1519, 1989 offenbart 3,4-Dimethoxy-2(1H)-chinolinon und 3,4-Dimethoxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon als Extrakte aus Clausena anisata.

[0011] Als Verbindungen mit Substituenten am aromatischen Ring eines Chinolinons offenbart Indian J. Chem., Sect. B, 15B(5), S. 440–444, 1977 3,4-Dimethoxy-2(1H)-chinolinon, 8-Methoxy-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon und einen Methylether davon, 8-Methoxy-3,4-dimethoxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon als Verbindungen, die aus der Rinde von Chloroxylon swietenia DC erhalten wurden.

[0012] Zusätzlich offenbart Indian J. Chem., Sect. B, 22B(12), S. 1254–11256, 1983 ein Verfahren zur Herstellung von 8-Methoxy-3-methoxy-4-hydroxy-2(1H)-chinolinon und 8-Methoxy-3,4-dimethoxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, Zusätzlich offenbart J. Heterocyclic Chem., 22, S. 1087–1088, 1985 ein Verfahren zur Herstellung von 3-Methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon und 8-Methoxy-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon.

[0013] Journal of Natural Products, 58(4), S. 574–1576, 1995 offenbart 8-Methoxy-3,4-dihydroxy-2(1H)-chinolinon als eine Komponente, die aus Eriostemon gardneri erhalten wurde. Jedoch sind, wie oben beschrieben, nur Methoxygruppen als Substituenten für die Ringe der aromatischen Gruppen von Chinolinonderivaten bekannt.

[0014] Außerdem beschreibt U.S.-PS Nr. 5378694 (entsprechend der WO 92/04328 und der japanischen Patentanmeldung, Zweite Veröffentlichung Nr. Hei 6-502845) Chinolinonderivate mit einer Carbonylgruppe als Substituent in 3-Stellung und einer Hydroxylgruppe oder einer Alkoxygruppe als Substituent in 4-Stellung; die antiviralen Aktivitäten und blutdrucksenkenden Aktivitäten dieser Verbindungen sind ebenfalls darin beschrieben.

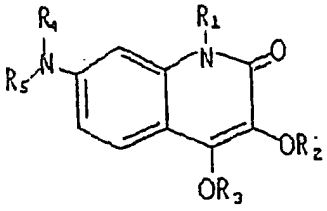
[0015] Darüber hinaus beschreibt U.S.-PS Nr. 5412104 (entsprechend der WO 92/04327 und der japanischen Patentanmeldung, Zweite Veröffentlichung Nr. Hei 7-110853) Chinolinonderivate mit einem Substituenten, der eine Carbonylgruppe als Substituent in 3-Stellung und eine Al-koxygruppe, eine Carbonyloxygruppe oder eine Aminogruppe als Substituent in 4-Stellung enthält, neben den antiviralen Aktivitäten dieser Verbindungen; das europäische Patent Nr. 0459561 A2 offenbart 2,4-Dioxotetrahydrochinolinderivate, in denen der Substituent in 3-Stellung ein Substituent ist, der eine Carbonylgruppe enthält, und die Gruppe in 4-Stellung ein 4-Ketontautomer ist.

[0016] Die europäische Patentanmeldung, Veröffentlichungsnr. 0481676 A1 offenbart ein Chinolinonderivat mit einer aromatischen Gruppe mit einem Substituenten als Substituent in der 3-Stellung und einer Hydroxylgruppe als Substituent in der 4-Stellung; die U.S. -Patentschrift Nr. 4 124 587 offenbart ein Chinolinonderivat mit einer Sulfinylgruppe als Substituent in der 3-Stellung und einer Hydroxylgruppe als Substituent in der 4-Stellung; und die U.S.-Patentschrift Nr. 4 127 574 offenbart ein Chinolinonderivat mit einer Sulfonylgruppe als Substituent in der 3-Position und einer Hydroxylgruppe als Substituent in der 4-Position.

[0017] Die Patentschrift WO 96/04288 offenbart 5,7-Dimethyl-4-hydroxy-2(1H)-chinolinon und 5,7-Dichlor-4-hydroxy-2(1H)-chinolinon. Darüber hinaus beschreiben die U.S.-PS Nr. 5 179 107 und die U.S.-PS Nr. 5 190 956 abstrakt eine äußerst breite Spanne von Chinolinonderivaten mit Substituenten am Ring der aromatischen Gruppe und mit Sauerstoff, der direkt in der 3- und 4-Stellung gebunden ist.

[0018] Diese U.S.-Patentveröffentlichungen offenbaren Chinolinondervate mit der Eigenschaft, dass die Substituenten in den 3- und 4-Stellungen identische Substituenten sind und dass diese Derivate antivirale Aktivität besitzen.

[0019] Das Dokument EP 0 785 190 offenbart ein 7-Aminochinolinonderivat, das durch die folgende allgemeine Formel (I) ausgedrückt wird:



..... (I)

worin

R_1 ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe ist;

R_2 und R_3 voneinander verschiedene Gruppen sind, von denen jede ausgewählt ist unter Wasserstoffatomen, Acylgruppen, Alkylgruppen oder Alkenylgruppen; und

R_4 und R_5 voneinander verschiedene oder identische Gruppen sind, von denen jede ausgewählt ist unter Wasserstoffatomen, Acylgruppen, Alkylgruppen, Alkenylgruppen oder Aralkylgruppen;

und physiologisch annehmbare Salze davon.

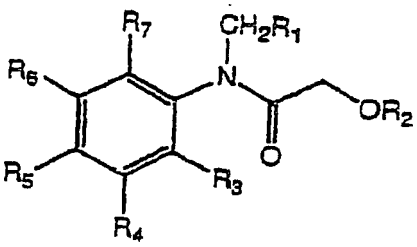
ZUSAMMENFASSUNG DER ERFINDUNG

[0020] Unter Berücksichtigung des oben Erwähnten stellt die vorliegende Erfindung ein einfaches Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats, das als eine Arznei wirksam ist, z. B. als ein antiallergisches Mittel, und neurartige Amiddertvate, die als Zwischenstufen in dem Verfahren wirksam sind, bereit.

[0021] Die Erfinder der vorliegenden Erfindung haben gefunden, dass verschiedene wünschenswerte Chinolinonderivate mittels Verwendung eines Amidderivats, das durch die allgemeine Formel (I) ausgedrückt wird, als eine Zwischenstufe und Fördern der intramolekularen Ringbildung des Amidderivats unter Verwendung einer Alkaliverbindung erhalten werden. Darüber hinaus sind diese oben erwähnten Chinolinonderivate äußerst nützlich als antiallergische Mittel.

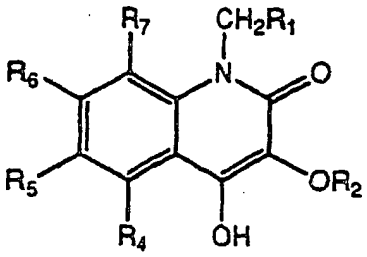
[0022] Mit anderen Worten umfasst die vorliegende Erfindung:

(1) ein Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats, das durch die folgende allgemeine Formel (II) ausgedrückt wird, dadurch charakterisiert, dass ein Amidderivat, das durch die folgende allgemeine Formel (I) ausgedrückt wird, mit einer Base umgesetzt wird, gefolgt von intramolekularer Ringbildung;



(I)

[worin R_1 ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe, eine Alkenylgruppe oder eine Arylgruppe darstellt; R_2 eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Arylgruppe oder eine Aralkylgruppe darstellt; R_3 eine reaktive Carboxylgruppe darstellt; und R_4 bis R_7 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Hydroxylgruppe, eine Alkylgruppe, eine Alkoxygruppe, eine Alkenylgruppe, eine Alkenyloxygruppe, eine Arylgruppe, eine Aryloxygruppe, eine Aralkyloxygruppe, eine R_8R_9N-Gruppe (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Aralkylgruppe oder eine Acylgruppe darstellen), eine Nitrogruppe oder eine $R_{10}OOC$-Gruppe (worin R_{10} ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Arylgruppe oder eine Aralkylgruppe darstellt) darstellen]



(II)

[worin R_1, R_2 und R_4 bis R_7 jeweils dieselben Bestandteile wie in der allgemeinen Formel (I) beschrieben darstellen].

(2) Ein Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats nach (1), worin R_1 ein Wasserstoffatom, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 9 Kohlenstoff atomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe und besitzend 1 bis 5 Kohlenstoffatome, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen darstellt; R_2 eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen darstellt; R_4, R_5 und R_7 jeweils ein Wasserstoffatom darstellen; und R_6 eine R_8R_9N-Gruppe darstellt (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Acylgruppe mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen darstellen);

(3) ein Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats nach (1), worin R_1 ein Wasserstoffatom darstellt; R_2 eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen darstellt; R_4, R_5 und R_7 jeweils ein Wasserstoffatom darstellen; und R_6 eine R_8R_9N-Gruppe darstellt (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoff atom, eine Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Acylgruppe mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen darstellen);

(4) ein Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats nach (1), worin R_1 ein Wasserstoffatom, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 9 Kohlenstoff atomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe und besitzend 1 bis 5 Kohlenstoffatome, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen darstellt; R_2 eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen darstellt; R_4, R_5 und R_7 jeweils ein Wasserstoffatom darstellen; und R_6 eine Nitrogruppe darstellt;

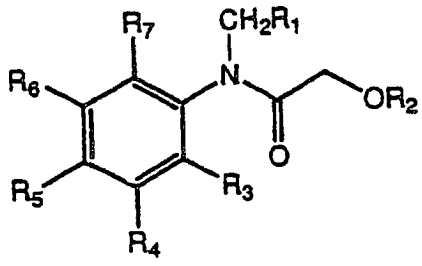
(5) ein Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats nach (1), worin R_1 ein Wasserstoffatom darstellt; R_2 eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen darstellt; R_4, R_5 und R_7 jeweils ein Wasserstoffatom darstellen; und R_6 eine Nitrogruppe darstellt;

(6) ein Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats nach (1), worin R_1 ein Wasserstoffatom, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 9 Kohlenstoff atomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe und besitzend 1 bis 5 Kohlenstoffatome, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen darstellt; R_2 eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen darstellt; R_4, R_5 und R_7 jeweils ein Wasserstoffatom darstellen; und R_6 eine Hydroxylgruppe, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkyloxygruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenyloxygruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkyloxygruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen darstellt.

(7) Ein Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats nach einem der Punkte (1) bis (6), dadurch charakterisiert, dass die Base ein Alkalimetallalkoxid ist.

(8) Ein Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats nach einem der Punkte (1) bis (6), dadurch charakterisiert, dass die Base ein Akalimetallamid ist;

(9) ein Amidderivat, das durch die folgende allgemeine Formel (I) dargestellt wird;



(I)

[worin R_1 ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe, eine Alkenylgruppe oder eine Arylgruppe darstellt; R_2 eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Arylgruppe oder eine Aralkylgruppe darstellt; R_3 eine reaktive Carboxylgruppe darstellt; R_4, R_5 und R_7 jeweils ein Wasserstoffatom darstellen; und R_6 entweder eine R_8R_9N-Gruppe (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Aralkylgruppe oder eine Acylgruppe darstellen) oder eine Nitrogruppe darstellt].

(10) Ein Amidderivat nach (9), worin R_1 ein Wasserstoffatom, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe und besitzend 1 bis 5 Kohlenstoffatome, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Arylgruppe mit 5 bis 6 Kohlenstoffatomen darstellt; R_2 eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen darstellt; und R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander eine Hydroxylgruppe, eine Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Acylgruppe mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen darstellen;

(11) ein Amidderivat nach (10), worin R_1 ein Wasserstoffatom darstellt; R_2 eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen darstellt; und R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander eine Hydroxylgruppe, eine Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Acylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen darstellen;

(12) ein Amidderivat nach (10), worin R_1 entweder ein Wasserstoffatom oder eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen darstellt; und R_2 eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen darstellt.

BESCHREIBUNG DER BEVORZUGEN AUSFÜHRUNGSFORMEN

[0023] Im Folgenden werden die bevorzugten Ausführungsformen der vorliegenden Erfindung im Detail beschrieben.

[0024] In der allgemeinen Formel (I) der vorliegenden Erfindung stellt R_1 ein Wasserstoff atom, eine Alkylgruppe, eine Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe, eine Alkenylgruppe oder eine Arylgruppe, und R_2 eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Arylgruppe oder eine Aralkylgruppe dar.

[0025] Was R_1 betrifft, so kann die Alkylgruppe entweder eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe sein. Beispiele dafür umfassen eine Methylgruppe, eine Ethylgruppe, eine Propylgruppe, eine Isopropylgruppe, eine n-Butylgruppe, eine s-Butylgruppe, eine n-Pentylgruppe, eine Hexylgruppe, eine n-Heptylgruppe, eine Octylgruppe und dergleichen. Die Alkylgruppe sollte vorzugsweise 1 bis 9 Kohlenstoffatome besitzen, bevorzugter 1 bis 7 Kohlenstoffatome.

[0026] Die Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe, kann entweder eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe sein. Beispiele davon können eine Verbindung enthalten, die eine Hydroxylgruppe enthält, wie z. B. eine Hydroxymethylgruppe, eine 2-Hydroxyethylgruppe, eine 3-Hydroxypropylgruppe, eine 4-Hydroxybutylgruppe, eine 6-Hydroxypentylgruppe, eine 1-Hydroxyethylgruppe, und dergleichen und eine Verbindung enthalten, die zwei Hydroxylgruppen, wie z. B. eine 1,2-Dihydroxyethylgruppe, eine 2,3-Dihydroxypropylgruppe und dergleichen, enthält.

[0027] Die Alkenylgruppe kann entweder eine geradkettige oder eine verzweigtkettige Alkenylgruppe sein. Beispiele davon enthalten eine Vinylgruppe, eine Propenylgruppe, eine Hexenylgruppe, eine Octenylgruppe, eine Propenylgruppe und dergleichen. Die Alkenylgruppe sollte vorzugsweise 2 bis 9 Kohlenstoffatome besit-

zen und bevorzugter 3 bis 7 Kohlenstoffatome. Beispiele der Arylgruppe können eine Furylgruppe, eine Pyridylgruppe, eine Phenylgruppe, und eine substituierte Phenylgruppe enthalten. Beispiele der substituierten Phenylgruppe können eine p-Methylphenylgruppe, eine p-Methoxyphenylgruppe, eine p-Hydroxyphenylgruppe, eine 3,4-Dimethoxyphenylgruppe und dergleichen enthalten. Unter den oben Erwähnten ist jedoch eine Phenylgruppe bevorzugt.

[0028] Beispiele der Aralkylgruppe können eine Benzylgruppe und eine substituierte Benzylgruppe (wie z. B. eine p-Methoxybenzylgruppe, eine p-Hydroxybenzylgruppe, eine 3,5-Dimethylbenzylgruppe und dergleichen) enthalten; aber von den oben Erwähnten ist eine Benzylgruppe bevorzugt.

[0029] Was R_2 betrifft, kann die Alkylgruppe entweder eine geradkettige oder eine verzweigtkettige Alkylgruppe sein. Beispiele davon enthalten eine Methylgruppe, eine Ethylgruppe, eine Propylgruppe, eine Isopropylgruppe, eine n-Butylgruppe, eine s-Butylgruppe, eine n-Pentylgruppe, eine Hexylgruppe, eine n-Heptylgruppe, eine Octylgruppe, eine n-Decylgruppe und dergleichen. Die Alkylgruppe sollte vorzugsweise 1 bis 10 Kohlenstoffatome besitzen und bevorzugter 1 bis 8 Kohlenstoffatome besitzen.

[0030] Die Alkenylgruppe kann entweder eine geradkettige oder eine verzweigtkettige Alkenylgruppe sein. Beispiele davon enthalten eine Vinylgruppe, eine Propenylgruppe, eine Hexenylgruppe, eine Octenylgruppe, eine Geranylgruppe und dergleichen. Die Alkenylgruppe sollte vorzugsweise 2 bis 10 Kohlenstoffatome besitzen und bevorzugter 3 bis 8 Kohlenstoffatome besitzen. Beispiele der Arylgruppe können eine Furylgruppe, eine Pyridylgruppe, eine Phenylgruppe und eine substituierte Phenylgruppe enthalten. Beispiele der substituierten Phenylgruppe enthalten eine p-Methylphenylgruppe, eine p-Methoxyphenylgruppe, eine p-Hydroxyphenylgruppe, eine 3,4-Dimethoxyphenylgruppe und dergleichen. Jedoch ist unter den oben Erwähnten eine Phenylgruppe bevorzugt.

[0031] Beispiele der Aralkylgruppe können eine Benzylgruppe und eine substituierte Benzylgruppe (wie z. B. eine p-Methoxybenzylgruppe, eine p-Hydroxybenzylgruppe, eine 3,5-Dimethylbenzylgruppe und dergleichen) enthalten. Jedoch ist unter den oben Erwähnten eine Benzylgruppe bevorzugt.

[0032] In der allgemeinen Formel (I) der vorliegenden Erfindung stellt R_3 eine reaktive Carboxylgruppe dar, spezieller eine Carboxylgruppe, die mit einem Kohlenstoffanion reaktionsfähig ist. Beispiele können eine Carboxylgruppe, eine Carbonsäureestergruppe, eine Carbonsäurethioestergruppe, ein Carbonsäurehalogenid und dergleichen enthalten; jedoch ist unter den oben Erwähnten eine Carbonsäureestergruppe bevorzugt.

[0033] In der allgemeinen Formel (I) der vorliegenden Erfindung stellen R_4 bis R_7 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Hydroxylgruppe, eine Alkylgruppe, eine Alkoxygruppe, eine Alkenylgruppe, eine Alkenyloxygruppe, eine Arylgruppe, eine Aryloxygruppe, eine Aralkyloxygruppe, eine R_8R_9N-Gruppe (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Aralkylgruppe oder eine Acylgruppe darstellen), eine Nitrogruppe oder eine $R_{10}COO$-Gruppe darstellen (worin R_{10} ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Arylgruppe oder eine Aralkylgruppe darstellt).

[0034] Die Alkylgruppe, die Alkenylgruppe, die Arylgruppe und die Aralkylgruppe stellen dieselben Bestandteile wie oben beschrieben dar. Zusätzlich stellen die Alkylgruppe, die Alkenylgruppe und die Aralkylgruppe, die jeweils in der Alkyloxygruppe, der Alkenyloxygruppe und der Aralkyloxygruppe enthalten sind, in ähnlicher Weise dieselben Bestandteile wie oben beschrieben dar.

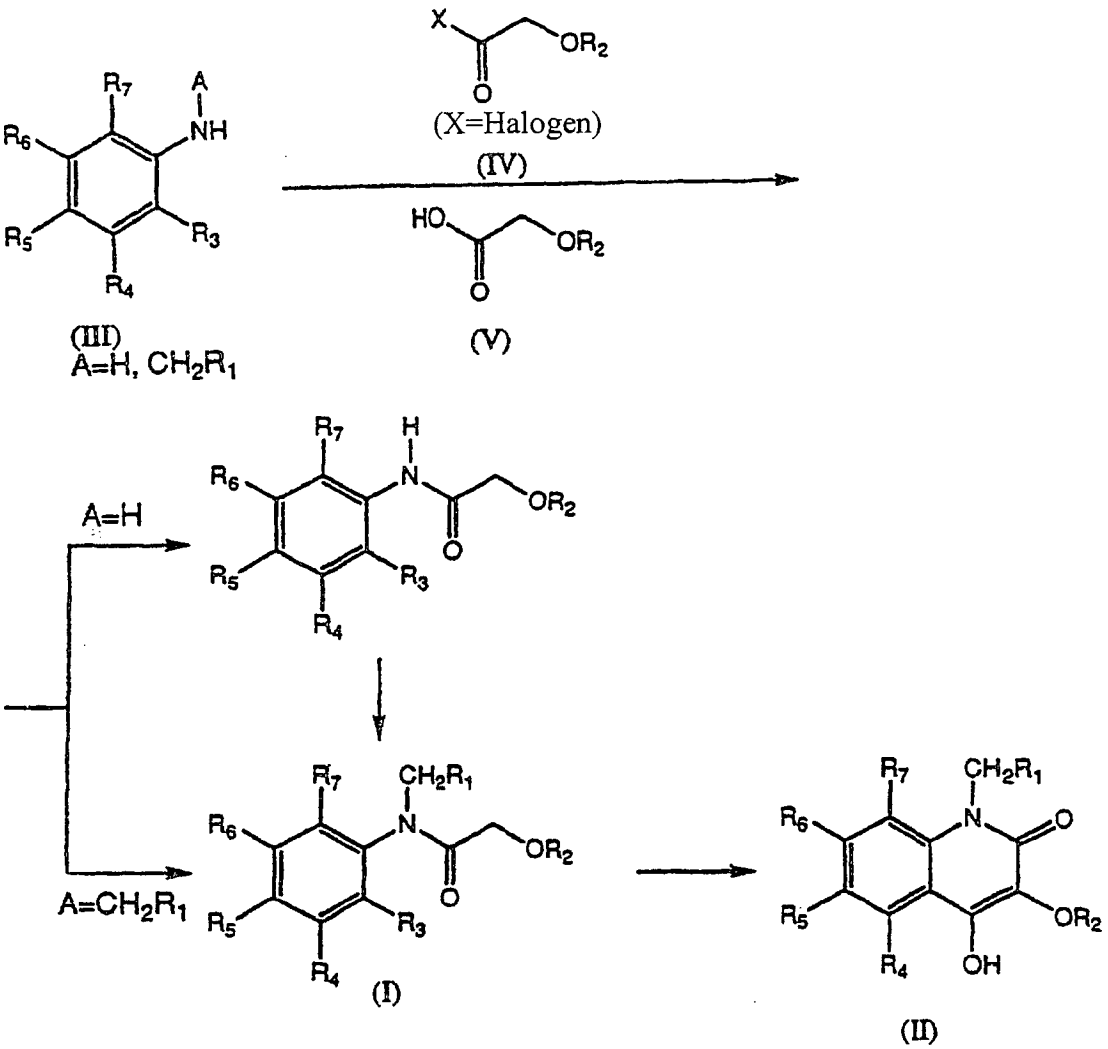
[0035] In der allgemeinen Formel (I) der vorliegenden Erfindung kann die Acylgruppe in R_8 und R_9 sowohl eine Alkenoylgruppe, die durch eine Acetylgruppe, eine Propionylgruppe, eine Butyrylgruppe und dergleichen dargestellt ist, und eine Benzoylgruppe enthalten. Die Benzoylgruppe kann einen Substituenten besitzen. Beispiele eines derartigen Substituenten enthalten eine p-Hydroxybenzoylgruppe, eine p-Methoxybenzoylgruppe, eine 2,4-Dihydroxybenzoylgruppe, eine 2,4-Dimethoxybenzoylgruppe und dergleichen.

[0036] Zusätzlich kann auch eine Cinnamoylgruppe und eine substituierte Cinnamoylgruppe enthalten sein. Beispiele der substituierten Cinnamoylgruppe enthalten eine 2-Hydroxycinnamoylgruppe, eine 3-Hydroxycinnamoylgruppe, eine 4-Hydroxycinnamoylgruppe, eine 3,4-Dihydroxycinnamoylgruppe, eine 4-Hydroxy-3-methoxycinnamoylgruppe, eine 3-Hydroxy-4-methoxycinnamoylgruppe, eine 3,5-Dimethoxy-4-hydroxycinnamoylgruppe, eine 3,4,5-Trimethoxycinnamoylgruppe und dergleichen.

[0037] In der allgemeinen Formel (I) der vorliegenden Erfindung stellt R_{10} eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Arylgruppe oder eine Aralkylgruppe dar, von denen jede dieselben Bestandteile darstellt wie oben beschrieben.

[0038] Im Folgenden wird ein Verfahren zur Herstellung der Chinolinonderivate gemäß der vorliegenden Erfindung erläutert.

[0039] Die Chinolinonderivate, die durch die allgemeine Formel (II) in der vorliegenden Erfindung ausgedrückt werden, können mittels des unten beschriebenen Reaktionspfads hergestellt werden.



[0040] R_1 bis R_7 in der chemischen Formel des Reaktionspfads sind auf die gleiche Weise wie oben beschrieben definiert. Das Herstellungsverfahren gemäß der vorliegenden Erfindung ist dadurch charakterisiert, dass ein Amidderivat, das durch die allgemeine Formel (I) ausgedrückt wird, und eine Base miteinander umgesetzt werden, gefolgt von einer intramolekularen Ringbildung. Die verwendete Base in der vorliegenden Erfindung kann verschiedene Verbindungen, wie z. B. Alkalimetalle, Alkalimetallalkoxide, Erdalkalimetallalkoxide, Alkalimetallhydride, Erdalkalimetallhydride, Alkalimetallamide und dergleichen enthalten.

[0041] Beispiele der Alkalimetalle können Natrium, Kalium und dergleichen enthalten; Beispiele der Alkalimetallalkoxide können Basen, wie z. B. Natriummethanolat, Natriumethanolat, Natrium-t-butanolat, Kalium-t-butanolat und dergleichen, enthalten; und Beispiele der Erdalkalimetalle können Magnesiummethanolat, Magnesiumethanolat, Magnesium-t-butanolat, Calciummethanolat, Calciumethanolat, Calcium-t-butanolat, Bariummethanolat, Bariumethanolat, Barium-t-butanolat und dergleichen enthalten.

[0042] Beispiele der Alkalimetallhydride können Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und dergleichen enthalten; und Beispiele der Erdalkalimetallhydride können Calciumhydrid und dergleichen enthalten. Zusätzlich können Beispiele der Alkalimetallamide Lithiumamid, Natriumamid, Kaliumamid, Lithiumdiisopropylamid, Lithiumbis(trimethylsilyl)amid, Natriumbis(trimethylsilyl)amid, Kaliumbis(trimethylsilyl)amid und dergleichen enthalten.

[0043] Unter diesen sind Alkalimetallalkoxide und Alkalimetallamide als eine Base besonders bevorzugt.

[0044] Zusätzlich ist die zur Ringbildung notwendige Menge der Base stöchiometrisch 1- bis 5mal, vorzugsweise 2- bis 3mal, größer als die eines Amidderivats, mit dem die Base umgesetzt wird. Wenn beispielsweise Natriumhydrid, Kalium-t-butanolat oder Lithiumdiisopropylamid als Base verwendet wird, ist eine stöchiometrisch 2mal größere Menge als die des Amidderivats im Allgemeinen ausreichend.

[0045] Sogar wenn eine Verbindung, in der ein Wasserstoffatom durch ein Stickstoffatom ersetzt ist, in einer stöchiometrisch 4mal größeren Menge als das Amidderivat eingesetzt wird, tritt die Ringbildung jedoch nicht wie beabsichtigt auf. Daher ist es kritisch, dass R_1 den Substituenten gemäß der oben beschriebenen vorliegenden Erfindung umfasst. Wenn beispielsweise 2-[(Methoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureether mit der 4Fachen stöchiometrischen Menge Natriumhydrid in THF umgesetzt wird, tritt keine Ringbildung auf.

[0046] Wenn andererseits R_1 eine Methylgruppe ist, d. h, eine Verbindung, in der eine Ethylgruppe an der

Stelle eines Stickstoffatoms 2-[N-ethyl(methoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester substituiert ist, kann das gewünschte Chinolinonderivat effizient mittels Verwendung der 2fachen stöchiometrischen Menge Natriumhydrid unter denselben Bedingungen erhalten werden. Wenn R_2 ein Wasserstoffatom ist, tritt die Ringbildung nicht wie beabsichtigt auf.

[0047] Reaktionen in dem Herstellungsverfahren gemäß der vorliegenden Erfindung können in einem organischen Lösungsmittel erfolgen, das derartige Reaktionen nicht behindert. Beispiele der organischen Lösungsmittel können Kohlenwasserstoff Lösungsmittel, wie z. B. Benzol, Toluol und dergleichen; Alkohol-Lösungsmittel, wie z. B. Methanol, Ethanol, Propanol, Isopropanol, t-Butanol und dergleichen; Ether-Lösungsmittel, wie z. B. Diethylether, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan und dergleichen; und Amid-Lösungsmittel, wie z. B. N,N-Dimethylformamid, 1-Methyl-2-pyrrolidin und dergleichen, umfassen.

[0048] Das bevorzugte organische Lösungsmittel differiert in Abhängigkeit von der Art der verwendeten Base. Beispielsweise werden im Allgemeinen Alkohol-Lösungsmittel bevorzugt, wenn Alkalimetallalkoholate verwendet werden, während Ammoniak als ein Lösungsmittel im Falle von Alkalimetallamiden, wie z. B. Lithiumamid, Natriumamid und Kaliumamid, verwendet werden kann.

[0049] Die Reaktionstemperatur weicht in Abhängigkeit von der Art der verwendeten Base und des verwendeten Reaktions-Lösungsmittels ab, ist aber im Allgemeinen zwischen –80°C und 100°C, und vorzugsweise –50°C bis 50°C. Die Reaktionszeit beträgt gewöhnlicherweise 1 bis 5 Stunden.

[0050] Das Amidderivat der vorliegenden Erfindung kann durch Amidierung eines Aminderivats, das durch die allgemeine Formel (III) ausgedrückt wird, hergestellt werden. Mit der Maßgabe, dass A ein Wasserstoffatom in dem Amidderivat, das durch die allgemeine Formel (III) dargestellt wird, darstellt, wird das Amidderivat, das durch die allgemeine Formel (I) ausgedrückt wird, durch Amidierung und nachfolgender Alkylierung hergestellt. Substituenten von R_4 bis R_7 des Amidderivats, das durch die allgemeine Formel (I) ausgedrückt wird, können vorher in das Aminderivat eingeführt werden oder sie können nach der Amidierung des Aminderivats, das durch die allgemeine Formel (III) ausgedrückt wird, eingeführt werden. Beispielsweise kann 2-[N-Methyl(octyloxyacetyl)amino]-4]-(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)aminobenzoesäureethylester durch Umsetzung von 2-[N-Methyl-(octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester mit 3,5-Dimethoxy-4-hydroxyzimtsäure hergestellt werden.

[0051] Amidierungsreagentien für Aminderivate können entweder ein Carbonsäurehalogenid, das durch die allgemeine Formel (IV) ausgedrückt wird, oder eine Carbonsäure, die durch die allgemeine Formel (V) ausgedrückt wird, enthalten.

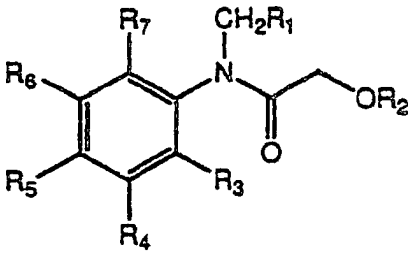
[0052] Reaktionen sind vorzugsweise in einem organischen Lösungsmittel im Falle der Verwendung des Carbonsäurehalogenids, das durch die allgemeine Formel (IV) ausgedrückt wird, günstig. Beispiele des verwendeten organischen Lösungsmittels können Kohlenwasserstoff Lösungsmittel, wie z. B. Benzol, Toluol, Xylol und dergleichen; Ether-Lösungsmittel, wie z. B, Diethylether, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan und dergleichen; und Amid-Lösungsmittel, wie z. B. N,N-Dimethylformamid, 1-Methyl-2-pyrrolidin und dergleichen, enthalten.

[0053] Obwohl es zusätzlich nicht speziell notwendig ist, ein Reagens zuzugeben, das die obige Reaktion fördert, ist es möglich, ein Amin als einen Katalysator zuzugeben, z. B. eine Base, wie z. B. Triethylamin, Pyridin und dergleichen. Die Reaktionszeit differier in Abhängigkeit von der Art der verwendeten Reagentien und der Reaktionstemperatur, beträgt aber gewöhnlicherweise 30 Minuten bis 3 Stunden. Die Reaktionstemperatur beträgt –10°C bis 10°C und vorzugsweise 0°C bis 50°C. Beispiele des verwendeten Carbonsäurehalogenids können Chlorid, Bromid und Iodid enthalten; jedoch ist unter den oben Erwähnten Chlorid bevorzugt.

[0054] Darüber hinaus kann das gewünschte Amidderivat, das durch die allgemeine Formel (I) ausgedrückt wird, durch Umsetzung mit einem Carbonsäurederivat, das durch die allgemeine Formel (V) ausgedrückt wird, erhalten werden. In einem derartigen Fall kann das gewünschte Amidderivat durch Fördern der Reaktionen in einem organischen Lösungsmittel in der Anwesenheit eines Säurekatalysators erhalten werden. Bevorzugte organische Lösungsmittel enthalten Kohlenwasserstoff Lösungsmittel, wie z. B. Benzol, Toluol, Xylol und dergleichen.

[0055] Beispiele des Säurekatalysators enthalten vorzugsweise Säuren, die in gewöhnlichen Amidsynthesen via Dehydratisierung verwendet werden. Diese enthalten Mineralsäuren, wie z. B. Salzsäure, Schwefelsäure und dergleichen, und organische Säuren, wie z. B. p-Toluolsulfonat, Methansulfonat, Trifluoromethansulfonat und dergleichen. Es ist wünschenswert, diese Reaktion ablaufen zu lassen, während Wasser, das während der Reaktion aus den Gruppen gebildet wird, entfernt wird. Die Reaktionszeit differiert in Abhängigkeit von der Art der verwendeten Reagentien und der Reaktionstemperatur, beträgt aber gewöhnlicherweise 1 bis 10 Stunden. Die Reaktionstemperatur beträgt 50°C bis 140°C und vorzugsweise 90°C bis 120°C.

[0056] Das neue Amidderivat gemäß der vorliegenden Erfindung wird durch die allgemeine Formel (I) ausgedrückt.



(I)

[worin R_1 ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe, eine Alkenylgruppe oder eine Arylgruppe darstellt; R_2 eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Arylgruppe oder eine Aralkylgruppe darstellt; R_3 eine Oxycarboxylgruppe darstellt; R_4, R_5 und R_7 jeweils ein Wasserstoffatom darstellen; und R_6 entweder eine R_8R_9N-Gruppe (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Aralkylgruppe oder eine Acylgruppe darstellen) oder eine Nitrogruppe darstellt].

[0057] Es wird speziell ein Amidderivat, das durch die obige Formel ausgedrückt wird, bereitgestellt, worin R_1 ein Wasserstoffatom, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe und besitzend 1 bis 5 Kohlenstoffatome, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen ist; R_2 eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoff atomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen ist; und R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoff atomen, eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Acylgruppe mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen sind.

[0058] Alternativ dazu wird ein Amidderivat, das durch die obige Formel ausgedrückt wird, bereitgestellt, worin R_1 ein Wasserstoffatom ist; R_2 eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen ist; und R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Acylgruppe mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen sind.

[0059] Spezieller wird ein Amidderivat, das durch die obige Formel ausgedrückt wird, bereitgestellt, worin R_1 entweder ein Wasserstoffatom oder eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen ist; und R_2 eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen ist.

[0060] Die folgenden Verbindungen sind veranschaulichende Beispiele der auf diese Weise erhaltenen Amidderivate der vorliegenden Erfindung, die durch die Formel (I) dargestellt werden:

2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(propoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(hexyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(decyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(2-propenyloxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoesäure-ethylester, 2-[N-Methyl-N-[(3-butenyloxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(5-hexenyloxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(geranyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(phenoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(4-methoxyphenoxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(4-hydroxyphenoxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(3,4-dimethoxyphenoxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(benzyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(4-hydroxybenzyloxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Ethyl-N-[(3,4-dimethyl-benzyloxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäuremethylester, 2-[N-Ethyl-N-(etoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäuremethylester, 2-[N-Ethyl-N-(propoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Ethyl-N-(butoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Propyl-N-(hexyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäure, 2-[N-Propyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Propyl-N-[(2-propenyloxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Buty1-N-[(3-butenyloxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Butyl-N-[(5-hexenyloxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoeethylester, 2-[N-Butyl-N-(geranyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Butyl-N-(phenoxyace-

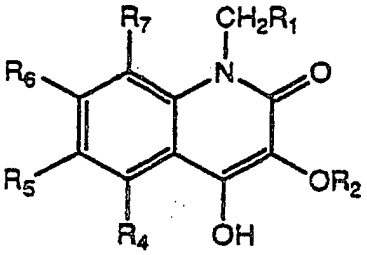
tyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Butyl-N-[(4-methoxyphenoxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Butyl-N-[(4-hydroxyphenoxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Hexyl-N-(benzyloxy-acetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Octyl-N-[(4-hydroxybenzyloxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Decyl-N-(butoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-(2-Propenyl)-N-(euoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäuremethylester, 2-[N-(3-Butenyl)-N-(propoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-(5-Hexenyl)-N-(butoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-(2-Propenyl)-N-(hexyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Geranyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Prenyl-N-[(5-hexenyloxy)acetyl]amino-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Benzyl-N-(benzyl-oxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Benzyl-N-[(4-hydroxybenzyloxy)acetyl]-amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-(2-Propenyl)-N-(methoxyacetyl)amino]-4-nitro-benzoesäure-ethylester, 2-[N-Methyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(propoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(hexyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(2-propenyloxy)acetyl]amino-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(3-butenyloxy)acetyl]amino-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(5-hexenyloxy)acetyl]amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(geranyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(phenoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(4-methoxyphenoxy)acetyl]amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(4-hydroxyphenoxy)acetyl]amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(benzyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(benzylacetyl)amino]-4-(2-propenyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(4-hydroxybenzyloxy)acetyl]amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Ethyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Ethyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Ethyl-N-(propoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Ethyl-N-(butoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Propyl-N-(hexyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Propyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Propyl-N-[(2-propenyloxy)acetyl]amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Butyl-N-[(3-butenyloxy)acetyl]amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Butyl-N-[(5-hexenyloxy)acetyl]amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Butyl-N-(geranyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Butyl-N-(phenoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Butyl-N-[(4-methoxyphenoxy)acetyl]amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Butyl-N-[(4-hydroxyphenoxy)acetyl]amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Hexyl-N-(benzyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Octyl-N-[(4-hydroxybenzyloxy)acetyl]amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-(2-Propenyl)-(ethoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-(3-Butenyl)-N-(propoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-(5-Hexenyl)-N-(butoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-(2-Propenyl)-N-(hexyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Geranyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoe-säureethylester, 2-[N-Phenyl-N-[(5-hexenyloxy)acetyl]amino]-4-aminobenzoe-säureethylester, 2-[N-Benzyl-N-[(4-hydroxybenzyloxy)acetyl]amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-(2-Hydroxyethyl)-N-(methoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-hexylaminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-hexylaminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(propoxyacetyl)amino]-4-hexylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-4-hexylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(hexyloxyacetyl)amino]-4-hexylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-hexylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(2-propenyloxy)acetyl]amino]-4-hexylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(3-butenyl-oxy)acetyl]amino]-4-octylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-decylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(5-hexenyloxy)acetyl]amino]-4-octylami-nobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(geranyloxyacetyl)amino]-4-octylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(phenoxyacetyl)amino]-4-octylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(4-methoxyphenoxy)acetyl]amino-4-octylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(hydroxyphenoxy)acetyl]amino]-4-octylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-vinylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(benzyloxyacetyl)amino]-4-(2-propenyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(4-hydroxybenzyloxy)acetyl]amino]-4-(2-propenyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Ethyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-(5-hexenyl)aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Ethyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-(5-hexenyl)aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Ethyl-N-(propoxyacetyl)amino]-4-(5-hexenyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Ethyl-N-(butoxyacetyl)amino]-4-(5-hexenyl)aminobenzoe-säureethylester, 2-[N-Propyl-N-(hexyloxyacetyl)amino]-4-(5-hexenyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Propyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-(5-hexenyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Propyl-N-[(2-propenyloxy)acetyl]amino]-4-(5-hexenyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Butyl-N-[(3-butenyloxy)acetyl]amino]-4-(5-hexenyl)aminobenzoe-säureethylester, 2-[N-Butenyl-N-[(5-hexenyloxy)-acetyl]amino]-4-(5-hexenyl)aminobenzoe-säureethylester, 2-[N-Butyl-N-(geranyloxyacetyl)amino]-4-(5-hexenyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Butyl-N-(phenoxyacetyl)amino]-4-(5-hexenyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Butyl-N-[(4-methoxyphenoxy)acetyl]amino-4-(5-hexenyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Butyl-N-[(4-hydroxy-

phenoxy)acetyl]amino]-4-geranylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Hexyl-N-(benzyloxyacetyl)amino]-4-geranylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Octyl-N-[(4-hydroxybenzyloxy)acetyl]amino]-4-geranylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(propoxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(hexyloxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(2-propenyloxy)acetyl]amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(3-butenyloxy)acetyl]amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(S-hexenyloxy)acetyl]amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(geranyloxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(phenoxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(4-methoxyphenoxy)acetyl]amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(4-hydroxyphenoxy)acetyl]amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(benzyloxyacetyl)amino]-4-(2-propenyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(4-hydroxybenzyloxy)acetyl]amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-(2-Propenyl)-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäuremethylester, 2-[N-(3-Butenyl)-N-(propoxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-(5-Hexenyl)(butoxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-(2-Propenyl)-N-(hexyloxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-benzoylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Geranyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-benzoylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Prenyl-N-[(5-hexenyloxy)acetyl]amino]-4-benzoylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Geranyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-benzylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Benzyl-N-(benzyloxyacetyl)amino]-4-benzylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Benzyl-N-[(4-hydroxybenzyloxy)acetyl]amino]-4-benzylaminoben-zoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-cinnamoylaminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-cinnamoylaminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(propoxyacetyl)amino]-4-(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-4-(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(hexyloxyacetyl)amino]-4-(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(2-propenyloxy)acetyl]amino]-4-(4-hydroxycinnamoyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(3-butenyloxy)acetyl]amino]-4-(3,4-dihydroxycinnamoyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(5-hexenyloxy)acetyl]amino-4-(3-hydroxycinnamoyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(geranyloxyacetyl)amino]-4-(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-(N-methyl-N-acetyl)aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-(N,N-dimethyl)aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(propoxyacetyl)amino]-4-(N,N-dimethyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-4-(N,N-dimethyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(hexyloxyacetyl)amino]-4-(N,N-dimethyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-(N,N-dimethyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(2-propenyloxy)acetyl]amino-4-(N-methyl-N-acetyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(3-butenyloxy)acetyl]amino]-4-(N-ethyl-N-acetyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(5-hexenyloxy)acetyl]amino]-4-(N-ethyl-N-acetyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(geranyloxyacetyl)amino]-4-(N-butyl-N-acetyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(phenoxyacetyl)amino]-4-[N-(2-propenyl)-N-acetyl]aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-[(4-methoxyphenoxy)acetyl]amino]-4-(N-geranyl-N-acetyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-[(4-hydroxyphenoxy)acetyl]amino]-4-(N-benzyl-N-acetyl)aminobenzoesäureethyl-ester, 2-[N-Methyl-N-(benzyloxy-N-acetyl)amino]-4-(N-methyl-N-benzyl)aminobenzoesäure-ethylester, 2-[N-Ethyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäuremethylester, 2-[N-Decyl(butoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(decyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäuremethylester, 2-[N-(2-Puropenyl)-N-(methoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäuremethylester, 2-[N-(2-Hydroxyethyl)-N-(methoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Geranyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-aminoben-zoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(benzyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-(3-Hydroxypropyl)-N-(methoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-benzylaminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(benzyloxyacetyl)amino]-4-methylaminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Ethyl-N-(3,4-dimethylbenzyloxy)acetyl]amino]-4-hexylaminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-(N,N-dimethyl)aminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-decylaminobenzoe-säuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-vinylaminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(benzyloxyacetyl)amino]-4-hexylaminobenzoesäuremethylester, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-(N,N-dimethyl)aminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-geranylaminobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-(N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,4,5-trimetho-

xycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-(2-pyridyloxy)acetyl]amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-(2-Furanyl)methyl-N-methoxyacetyl]amino]-4-nitrobenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-6-phenoxycarbonylbenzoesäureethylester, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-6-decyloxycarbonylbenzoesäureethylester, 2-[N-(3,5-Dimethylbenzyloxy)-N-ethoxyacetyl]amino]-6-hexylaminobenzoesäureethylester.

[0061] Diese verwenden eine synthetische Zwischenstufe der nützlichen Chinolinonderivate als eine Arznei, besonders als ein antiallergisches Mittel.

[0062] Das neue Chinolinonderivat, das durch das Herstellungsverfahren gemäß der vorliegenden Erfindung erhalten wurde, ist ein Chinolinonderivat, das durch die allgemeine Formel (II) ausgedrück wird.



(II)

[worin R_1 ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe, eine Alkenylgruppe oder eine Arylgruppe darstellt; R_2 eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Arylgruppe oder eine Aralkylgruppe darstellt; und R_4 bis R_7 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Hydroxylgruppe, eine Alkylgruppe, eine Alkoxygruppe, eine Alkenylgruppe, eine Alkenyloxygruppe, eine Arylgruppe, eine Aryloxygruppe, eine Aralkyloxygruppe, eine R_8R_9N-Gruppe (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Aralkylgruppe oder eine Acylgruppe darstellen), eine Nitrogruppe oder eine $R_{10}OOC$-Gruppe (worin R_{10} ein Wasserstoff atom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Arylgruppe oder eine Aralkylgruppe) darstellen]; mit der Ausnahme, dass die folgenden zwei Arten von Verbindungen nicht enthalten sind: (i) eine Verbindung, in der R_4, R_5 und R_7 jeweils ein Wasserstoffatom sind; und R_6 ausgewählt ist aus der Gruppe, umfassend ein Wasserstoffatom, eine Hydroxylgruppe, eine Alkoxygruppe, eine Alkenyloxygruppe, eine Aralkyloxygruppe, eine R_8R_9N-Gruppe (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Aralkylgruppe oder eine Acylgruppe darstellen), und eine Nitrogruppe; und (ii) eine Verbindung, in der R_4, R_5 und R_6 jeweils Wasserstoffatome sind und R_7 eine Methoxygruppe ist.

[0063] Speziell wird ein Chinolinonderivat, das durch die obige Formel ausgedrückt wird, bereitgestellt, worin R_1 ein Wasserstoffatom, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe und besitzend 1 bis 5 Kohlenstoffatome, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen ist; R_2 eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen ist; R_4 bis R_7 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Hydroxylgruppe, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkoxygruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenyloxygruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen, eine Aryloxygruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkyloxygruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen sind; R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Acylgruppe mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen sind; und R_{10} eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen ist; mit der Ausnahme, dass die folgenden beiden Arten von Verbindungen nicht enthalten sind: (i) eine Verbindung, in der R_4, R_5 und R_7 jeweils Wasserstoffatome sind; und R_6 ausgewählt ist aus der Gruppe, umfassend ein Wasserstoffatom, eine Hydroxylgruppe, eine Alkoxygruppe, eine Alkenyloxygruppe, eine Aralkyloxygruppe, eine R_8R_9N-Gruppe (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Aralkylgruppe oder eine Acylgruppe darstellen) und eine Nitrogruppe; und (ii) eine Verbindung, in der R_4, R_5 und R_6 jeweils Wasserstoffatome sind und R_7 eine Methoxygruppe ist.

[0064] Spezieller wird ein Chinolinonderivat, das durch die obige Formel ausgedrückt wird, bereitgestellt, worin R_1 ein Wasserstoffatom ist; R_2 eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoff-

atomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen ist; R_4 bis R_7 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Hydroxylgruppe, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkoxygruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenyloxygruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen, eine Aryloxygruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkyloxygruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen sind; R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Acylgruppe mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen sind; und R_{10} eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen ist; mit der Ausnahme, dass die folgenden beiden Arten von Verbindungen nicht enthalten sind: (i) eine Verbindung, in der R_4, R_5 und R_7 jeweils Wasserstoffatome sind; und R_6 ausgewählt ist aus der Gruppe, umfassend ein Wasserstoffatom, eine Hydroxylgruppe, eine Alkoxygruppe, eine Alkenyloxygruppe, eine Aralkyloxygruppe, eine R_8R_9N-Gruppe (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Aralkylgruppe oder eine Acylgruppe darstellen) und eine Nitrogruppe; und (ii) eine Verbindung, in der R_4, R_5 und R_6 jeweils Wasserstoffatome sind und R_7 eine Methoxygruppe ist.

[0065] Noch spezieller wird ein Chinolinonderivat, das durch die obige Formel ausgedrückt wird, bereitgestellt, worin R_1 entweder ein Wasserstoffatom oder eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen ist; und R_2 eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine geradkettige oder verzweigtkettige Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen oder eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen ist; mit der Ausnahme, dass die folgenden beiden Arten von Verbindungen nicht enthalten sind: (i) eine Verbindung, in der R_4, R_5 und R_7 jeweils Wasserstoffatome sind; und R_6 ausgewählt ist aus der Gruppe, umfassend ein Wasserstoffatom, eine Hydroxylgruppe, eine Alkoxygruppe, eine Alkenyloxygruppe, eine Aralkyloxygruppe, eine R_8R_9N-Gruppe (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Aralkylgruppe oder eine Acylgruppe darstellen) und eine Nitrogruppe; und (ii) eine Verbindung, in der R_4, R_5 und R_6 jeweils Wasserstoffatome sind und R_7 eine Methoxygruppe ist.

[0066] Die folgenden Verbindungen sind veranschaulichende Beispiele der auf diese Weise erhaltenen Chinolinonderivate der vorliegenden Erfindung, die durch die Formel (Π) dargestellt werden:

7-Nitro-3-methoxy-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon, 5-Nitro-3-methoxy-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon, 6-Nitro-3-methoxy-4-hydroxy-1-octyl-2(1H)-chinolinon, 7-Nitro-3-butoxy-4-hydroxy-1-decyl-2(1H)-chinolinon, 7-Nitro-3-butoxy-4-hydroxy-1-propenyl-2(1H)-chinolinon, 7-Nitro-3-decyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Nitro-3-methoxy-4-hydroxy-1-benzyl-2(1H)-chinolinon, 7-Nitro-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Nitro-3-methoxy-4-hydroxy-1-propenyl-2(1H)-chinolinon, 7-Nitro-3-methoxy-4-hydroxy-1-(2-hydroxyethyl)-2(1H)-chinolinon, 6-Nitro-3-butoxy-4-hydroxy-1-(6-hydroxyethyl)-2(1H)-chinolinon, 7-Amino-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Amino-3-ethoxy-4-hydroxy-1-geranyl-2(1H)-chinolinon, 5-Amino-3-ethoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Amino-3-phenoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Amino-3-geranyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Amino-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Amino-3-butoxy-4-hydroxy-1-(2-furylmethyl)-2(1H)-chinolinon, 7-Amino-3-benzyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Amino-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinoli-non, 7-Amino-3-methoxy-4-hydroxy-1-(2-hydroxyethyl)-2(1H)-chinolinon, 7-Benzoylamino-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Acetylamino-3-ethoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Acetylamino-3-phenoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Acetylamino-3-geranyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-[(4-Hydroxy-3,5-dimethoxycinnamoyl)-amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-[(3,4,5-Trimethoxycinnamoyl)ami-no]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Acetylamino-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Benzyolamino-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Methylamino-3-benzyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Hexylamino-3-(3,4-dimethylbenzyloxy)-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon, 7-Dimethylamino-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Benzylamino-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Decylamino-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Vinylamlino-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-(2-Furylmethyl)amino-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-(2-Pyridylmethyl)amino-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-(3,4-Dimethyl-benzyl)amino-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Geranylamino-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Puropenylamino-3-ethoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Benzylmethylamino-3-phenoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Butylamino-3-geranyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Hexylamino-3-benzyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Hydroxy-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Hydroxy-3-ethoxy-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon, 6-Hydroxy-3-phenoxy-4-hydroxy-1-octyl-2(1H)-chi-

nolinon, 8-Hydroxy-3-geranyloxy-4-hydroxy-1-benzyl-2(1H)-chinolinon, 7-Hydroxy-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chino-linon, 7-Hydroxy-3-octyloxy-4-hydroxy-1-propenyl-2(1H)-chinolinon, 7-Vinyloxy-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Octyloxy-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Decyloxy-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Phenoxy-3-ethoxy-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon, 5-Geranyloxy-3-ethoxy-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon, 6-Propenyloxy-3-phenoxy-4-hydroxy-1-octyl-2(1H)-chinolinon, 8-Benzyloxy-3-geranyloxy-4-hydroxy-1-benzyl-2(1H)-chinolinon, 7-Methoxy-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Butoxy-3-octyloxy-4-hydroxy-1-propenyl-2(1H)-chinolinon, 7-Methyl-3-octyloxy-4-hydroxy-1-propenyl-2(1H)-chinolinon, 7-Hexyl-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Decyl-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Propenyl-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Geranyl-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-(3,4-Dimethylbenzyl)3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Butyl-3-ethoxy-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon, 6-Phenyl-3-phenoxy-4-hydroxy-1-octyl-2(1H)-chinolinon, 6-Propenyl-3-phenoxy-4-hydroxy-1-octyl-2(1H)-chinolinon, 8-Methyl-3-geranyloxy-4-hydroxy-1-benzyl-2(1H)-chinolinon, 7-Methyl-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Butyl-3-octyloxy-4-hydroxy-1-propenyl-2(1H)-chinolinon, 5,7-Dihydroxy-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5,7-Dihydroxy-3-ethoxy-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon, 5,7-Dimethoxy-3-phenoxy-4-hydroxy-1-octyl-2(1H)-chinolinon, 5,7-Dibenzyloxy-3-geranyloxy-4-hydroxy-1-benzyl-2(1H)-chinolinon, 5,7-Dipuropenyloxy-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Ethoxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Phenoxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Propenyloxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Hydroxycarbonyl-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-[(3,5-Dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)am-ino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Benzylamino-3-phenoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Nitro-3-butoxy-4-hydroxy-1-decyl-2(1H)-chinolinon, 6-Nitro-3-butoxy-4-hydroxy-1-(6-hydroxyhexyl)-2(1H)-chinolinon, 5-Amino-3-ethoxy-4-hydroxy-1-geranyl-2(1H)-chinolinon, 7-[(3,4,5-Trimethoxycinnamoyl)amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Methylamino-3-benzyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Hexylamino-3-(3,5-dimethylbenzyloxy)-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon, 6-Decylamino-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Vinylamino-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-(3,5-Dimethylbenzylamino)-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-(2-Propenyloxy)-3-phenoxy-4-hydroxy-1-octyl-2(1H)-chinolinon, 7-Methyl-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-(2-Propenyl)-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Butyl-3-octyloxy-4-hydroxy-1-(2-propenyl)-2(1H)-chinolinon, 7-Nitro-3-(2-pydridyloxy)-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 7-Nitro-3-methoxy-4-hydroxy-1-(2-furanyl)methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Phenoxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Decyloxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Hexylamino-3-ethoxy-4-hydroxy-1-(3,5-dimethylbenzyloxy)-2(1H)-chinolinon, 5-Nitro-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Nitro-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Nitro-3-octyloxy-4-hyroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Amino-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Amino-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Amino-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-[(3,5-Dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-[(3,5-Dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-[(3,5-Dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Hexylamino-5-ethyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Methoxy-3-phenoxy-4-hydroxy-1-octyl-2(1H)-chinolinon, 6-Benzyloxy-3-geranyloxy-4-hydroxy-1-benzyl-2(1H)-chinolinon, 6-Propenyloxy-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Ethoxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Phenoxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Propenyloxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Hydroxycarbonyl-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Methoxy-3-phenoxy-4-hydroxy-1-octyl-2(1H)-chinolinon, 8-Benzyloxy-3-geranyloxy-4-hydroxy-1-benzyl-2(1H)-chinolinon, 8-Propenyloxy-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Ethoxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Phenoxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Propenyloxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Hydroxycarbonyl-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 5-Octyloxy-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 6-Hexyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Hexyloxy-3-hexyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Octyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Methylamino-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon, 8-Decylamino-3-ethoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon.

[0067] Da die erfindungsgemäßen 7-Aminochinolinonderivate und physiologisch annehmbare Salze (nachfolgend als "die Verbindung der vorliegenden Erfindung" bezeichnet) eine Funktion besitzen, allergische Reaktionen sowohl vom Sofort- als auch vom verzögerten Typ zu hemmen und eine niedrige Toxizität aufweisen, wie später in den Beispielen beschrieben wird, sind diese nützlich als antiallergische Mittel zur Behandlung oder zur Prävention von verschiedenen allergischen Erkrankungen.

[0068] Der Begriff "allergische Erkrankungen", wie er hierin verwendet wird, bedeutet allergische Erkrankungen, die aus übermäßiger Aktivität des biologischen Immunmechanismus, verursacht durch extrinsische oder

intrinsische Antigene, die Asthma vom Sofort-Typ, Asthma vom verzögerten Typ, bronchiales Asthma, pädiatrisches Asthma, Konstitutions-allergische Dermatitis, allergische Dermatitis, Urtikarie, Exzeme, allergische Bindehautentzündung, allergische Nasenschleimhautentzündung, Heuschnupfen, Nahrungsmittelallergie, allergische Gastroenteritis, allergische Colitis, Kontaktdermatitis, Autoimmunkrankheit und dergleichen enthalten, stammen.

[0069] Das antiallergische Mittel, das die Verbindung der vorliegenden Erfindung als ein aktives Ingredienz umfasst, kann oral verabreicht werden (innere Anwendung oder Inhalation) oder parenteral (z. B. intravenöse Injektion, subkutane Injektion, perkutane Absorption, rektale Verabreichung oder dergleichen). Ein derartiges pharmazeutisches Mittel kann je nach Verwendungszweck in verschiedene Dosierungsformen eingebaut werden, beispielsweise Tabletten, Kapseln, Körnchen, feine Stäube, Pulver, Pastillen, sublinguale Tabletten, Suppositorien, Salben, Injektionen, Emulsionen, Suspensionen, medizinische Sirups und dergleichen. Diese Dosierungsformen können gemäß bekannter Techniken unter Einsatz pharmazeutisch annehmbarer Träger hergestellt werden, die gewöhnlicherweise bei dieser Art von Arzneimitteln verwendet werden, wie z. B. Arzneistoffträger, Bindemittel, Desintegratoren, Gleitmittel, Konservierungsmittel, Antioxidantien, isotonische Mittel, Puffer, Beschichtungsmittel, Süßungsmittel, Auflösungsmittel, Basen, Dispergierungsmittel, stabilisierende Mittel, Färbemittel und dergleichen.

[0070] Anschauliche Beispiele dieser pharmazeutisch annehmbaren Träger sind im Folgenden aufgelistet.

[0071] Als Arzneistoffträger können zunächst die Folgenden aufgelistet werden: Stärke und Stärkederivate (wie z. B. Dextrin, Carboxymethylstärke und dergleichen), Cellulose und Cellulosederivate (wie z. B. Methylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose und dergleichen), Zucker (wie z. B. Lactose, Saccharose, Glucose und dergleichen), Kieselsäure und Silicate (wie z. B. natürlich auftretende Aluminiumsilicate, Magnesiumsilicate und dergleichen), Carbonate (wie z. B. Calciumcarbonat, Magnesiumcarbonat, Natriumhydrogencarbonat und dergleichen), Aluminiummagnesiumhydroxid, synthetischer Hydrotalcit, Polyoxyethylenderivate, Glycerinmonostearat, Sorbitanmonooleat und dergleichen.

[0072] Als Bindemittel können die Folgenden aufgelistet werden: Stärke und Stärkederivate (wie z. B. alpha-Stärke, Dextrin und dergleichen), Cellulose und Cellulosederivate (wie z. B. Ethylcellulose, Natriumcarboxymethylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose und dergleichen}, Gummi arabicum, Traganth, Gelatine, Zucker (wie z. B. Glucose, Saccharose und dergleichen), Ethanol, Polyvinylalkohole und dergleichen.

[0073] Als Desintegratoren können die Folgenden aufgelistet werden: Stärke und Stärkederivate (wie z. B. Carboxymethylstärke, Hydroxypropylstärke und dergleichen), Cellulose und Cellulosederivate (wie z. B. Natriumcarboxymethylcellulose, kristalline Cellulose, Hydroxypropymethylcellulose und dergleichen), Carbonate (wie z. B. Calciumcarbonat, Calciumhydrogencarbonat und dergleichen), Traganth, Gelatine, Agar und dergleichen.

[0074] Als Gleitmittel können die Folgenden aufgelistet werden: Stearinsäure, Calciumstearat, Magnesiumstearat, Talk, Kieselsäure und ihre Salze (wie z. B. leichtes Kieselsäureanhydrid, natürlich vorkommende Aluminiumsilicate und dergleichen), Titanoxid, Calciumhydrogenphosphat, trockenes Aluminiumhydroxidgel, Makrogol und dergleichen.

[0075] Als Konservierungsmittel können die Folgenden aufgelistet werden: p-Hydroxybenzoate, Sulfite (wie z. B. Natriumsulfit, Natriumpyrosulfit und dergleichen), Phosphate (wie z. B. Natriumphosphate, Calciumpolyphosphate, Natriumpolyphosphate, Natriummetaphosphate und dergleichen), Alkohole (wie z. B. Chlorbutanol, Benzylalkohol und dergleichen), Benzalkoniumchlorid, Benzethoniumchlorid, Phenol, Cresol, Chlorcresol, Dihydroessigsäure, Natriumdihydroacetat, Glycerinsorbat, Zucker und dergleichen.

[0076] Als Antioxidantien können die Folgenden aufgelistet werden: Sulfite (wie z. B. Natriumsulfit, Natriumhydrogensulfit und dergleichen), Rongalit, Isoascorbinsäure, L-Ascorbinsäure, Cystein, Thioglycerin, Butylhydroxyanisol, Dibutylhydroxytoluol, Gallosäurepropylester, Ascorbylpalmitat, dl-α-Tocopherol und dergleichen.

[0077] Als isotonische Mittel können die Folgenden aufgelistet werden: Natriumchlorid, Natriumnitrat, Kaliumnitrat, Dextrin, Glycerin, Glucose und dergleichen.

[0078] Als Puffer können die Folgenden aufgelistet werden: Natriumcarbonat, Salzsäure, Borsäure, Phosphate (wie z. B. Natriumhydrogenphosphat) und dergleichen.

[0079] Als Beschichtungsmittel können die Folgenden aufgelistet werden: Cellulosederivate (wie z. B. Hydroxypropylcellulose, Celluloseacetatphthalat, Hydroxypropylmethylcellulosephthalat und dergleichen), Shellak, Polyvinylpyrrolidon, Polyvinylpyridine (wie z. B. Poly-2-vinylpyridin, Poly-2-vinyl-5-ethylpyridin und dergleichen), Polyvinylacetyldiethylaminoacetat, Polyvinylalkoholphthalat, Methacrylat, Methacrylat-Copolymere und dergleichen.

[0080] Als Süßungsmittel können die Folgenden aufgelistet werden: Zucker (wie z. B. Glucose, Saccharose, Lactose und dergleichen), Natriumsaccharinat, Zuckeralkohole und dergleichen.

[0081] Als auflösende Mittel können die Folgenden aufgelistet werden: Ethylendiamin, Nicotinamid, Natriumsaccharinat, Citronensäure, Citrate, Natriumbenzoat, Seifen, Polyvinylpyrrolidon, Polysolvate, Sorbitanfettsäureester, Glycerin, Propylenglykol, Benzylalkohole und dergleichen.

[0082] Als Basen können die Folgenden aufgelistet werden: Fette (wie z. B. Schweinefett und dergleichen),

pflanzliche Öle (wie z. B. Olivenöl, Sesamöl und dergleichen), tierisches Öl, Lanolinsäure, Petrolatum, Paraffin, Wachs, Harze, Bentonit, Glycerin, Glykolöle, höhere Alkohole (wie z. B. Stearylalkohol, Cetanol) und dergleichen.

[0083] Als Dispergierungsmittel können die Folgenden aufgelistet werden: Gummi arabicum, Traganth, Cellulosederivate (wie z. B. Methylcellulose und dergleichen), Stearinsäurepolyester, Sorbitansesquioleat, Aluminiummonostearat, Natriumalginat, Polysolvate, Sorbitanfettsäureester und dergleichen.

[0084] Letzlich können als stabilisierende Mittel die Folgenden aufgelistet werden: Sulfate (wie z. B. Natriumhydrogensulfit und dergleichen), Stickstoff, Kohlendioxid und dergleichen.

[0085] Obwohl der Gehalt der Verbindungen der vorliegenden Erfindung in diesen pharmazeutischen Präparaten in Abhängigkeit von der Dosierungsform variiert, kann er vorzugsweise in einer Konzentration von 0,01 bis 100 Gew.-% liegen.

[0086] Die Dosis des antiallergischen Mittels der vorliegenden Erfindung kann über einen weiten Bereich variiert werden, in Abhängigkeit des jeweils zu behandelnden Warmblütlers einschließlich des Menschen und dergleichen, von dem Ausmaß der jeweiligen Erkrankung, vom Urteil des Arztes und dergleichen. Generell kann es jedoch in einer Dosis von 0,01 bis 50 mg, vorzugsweise von 0,01 bis 10 mg, als das aktive Ingredienz pro Tag pro kg Körpergewicht im Falle einer oralen Verabreichung oder einer. Dosis von 0,01 bis 10 mg, vorzugsweise von 0,01 bis 5 mg, als das aktive Ingredienz pro Tag pro kg Körpergewicht im Falle von parenteraler Verabreichung verabreicht werden. Die oben beschriebene tägliche Dosis kann in einer Portion oder in geteilten Portionen und wahlweise in Übereinstimmung mit dem Ausmaß der Erkrankungen und dem Urteil des Arztes abgeändert verändert werden.

[0087] Die folgenden Beispiele sollen diese Erfindung veranschaulichen.

BEISPIEL 1

2-[(Octyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester (Verbindung 1)

[0088] Zu einem Gemisch aus 20,00 g 4-Nitroanthranilsäureethylester (95,15 mmol) in 60 ml Toluol wurden 19,71 g Octyloxyessigsäure (104,67 mmol) und 0,91 g p-Toluolsulfonsäuremonohydrat (4,76 mmol) gegeben und das Gemisch wurde 6 Stunden bei 120°C gerührt. (Das während des Reaktionsprozesses gebildete Wasser wurde bei Bedarf entfernt.) Nachdem das Gemisch auf 30°C gekühlt war, wurden 0,53 g Triethylamin (5,71 mmol) zugegeben und das Gemisch wurde unter reduziertem Druck eingeengt. Das erhaltene Rohprodukt wurde aus Methanol kristallisiert unter Erhalt von 41,64 g der Titelverbindung (1). (Ausbeute = 93,9%).

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)

11,86 (s, 1H), 9,68 (s, 1H), 8,21 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,91 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 4,22 (m, 2H), 4,13 (s, 2H), 3,63 (t, 2H, J = 6,4 Hz), 1,80~1,20 (m, 15H), 0,88 (t, 3H, J = 6,8 Hz)

IR (KBr, cm^{-1}): 3240, 2850, 1740, 1550, 1345

Elementaranalyse für: $C_{19}H_{28}N_2O_6$

Berechnet (%): C 59,98; H 7,42; N 7,36; O 25,23

Gefunden (%): C 59,75; H 7,57; N 7,26; O 25,42

BEISPIEL 2

2-[(Octyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester (Verbindung 1)

[0089] Zu einem Gemisch von 20,00 g 4-Nitroanthranilsäureethylester (95,15 mmol) in 60 ml Tetrahydrofuran wurden 21,63 g Octyloxyacetylchlorid (104,67 mmol) und 11,65 g Triethylamin (115,14 mmol) bei 10°C gegeben und das Gemisch wurde 1 Stunde bei 10°C gerührt. Das Reaktionsgemisch wurde filtriert und das Filtrat bei reduziertem Druck eingeengt. Das resultierende Rohprodukt wurde aus Methanol kristallisiert unter Erhalt von 41,91 g der Titelverbindung (1). (Ausbeute = 94,5%).

BEISPIEL 3

2-[(Octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester (Verbindung 2)

[0090] Zu einem Gemisch von 10,00 g 2-[(Octyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester (26,28 mmol) in 58 ml 2-Methoxyethanol und 16 ml Toluol wurden 6,88 g Zinkpulver bei 20°C gegeben. Nachdem das Gemisch bei 10°C gerührt worden war, wurden 0,53 g Triethylamin (5,71 mmol) zugegeben, wobei die Temperatur für 1 Stunde unter 45°C gehalten wurde. Weiter wurde das Gemisch bei 80°C 3 Stunden gerührt. Das Gemisch wurde filtriert und zum Filtrat wurden Toluol und Wasser zugegeben und mit Toluol extrahiert. Die organische Phase wurde unter verringertem Druck eingeengt. Das resultierende Rohprodukt wurde aus Heptan kristalli-

sier, unter Erhalt von 9,07 g der Titelverbindung (2). (Ausbeute = 98,4%).
^{1}H-NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
11,96 (s, 1H), 8,13 (s, 1H), 7,88 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 6,32 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 4,35 (t, 2H, J = 5,2 Hz), 4,22 (bs, 2H), 4,07 (s, 2H), 3,74 (t, 2H, J = 5,2 Hz), 1,80~1,20 (m, 15H), 0,88 (t, 3H, J = 6,8 Hz),
IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 2850, 1725
Elementaranalyse für: $C_{19}H_{30}N_2O_4$
Berechnet (%): C 65,11; H 8,63; N 7,99; O 18,26
Gefunden (%): C 65,23; H 8,57; N 7,86; O 18,34

BEISPIEL 4

2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester (Verbindung 3)

[0091] Ein Gemisch von 10,00 g 2-[(Octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester (28,53 mmol) in 50 ml N,N-Dimethylformamid wurde auf 0 bis 5°C gekühlt. Danach wurden dem Gemisch 0,99 g Natriumethanolat (14,27 mmol) und 2,20 g Dimethylsulfat (17,12 mmol) bei –10 bis –5°C zugesetzt. Nachdem das Gemisch 1 Stunde bei –10 bis –5°C gerührt worden war, wurden 0,99 g Natriumethanolat (14,27 mmol) und 2,20 g Dimethylsulfat (17,12 mmol) bei –10 bis –5°C zugegeben. Nachdem das Gemisch bei –10 bis –5°C 1 Stunde lang gerührt worden war, wurden 0,40 g Natriumethanolat (5,71 mmol) und 0,88 g Dimethylsulfat (6,85 mmol) bei –10 bis –5°C zugegeben. Nachdem das Gemisch 1 Stunde bei –10 bis –5°C gerührt worden war, wurden 0,40 g Natriumethanolat (5,71 mmol) und 0,88 g Dimethylsulfat (6,58 mmol) bei –10 bis –5°C zugegeben. Nachdem das Gemisch 1 Stunde bei –10 bis –5°C gerührt worden war, wurden 5,00 g Schwefelsäure (1%ige Lösung in Wasser), 50 ml Wasser und 50 ml Toluol zugegeben und es wurde mit Toluol extrahiert. Die organische Phase wurde bei reduziertem Druck eingeengt. Das resultierende Rohprodukt wurde aus Toluol kristallisiert, unter Erhalt von 8,54 g der Titelverbindung (3). (Ausbeute = 80,0%)
^{1}H-NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
7,94 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 6,65 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 6,32 (d, 1H, J = 1,6 Hz), 4,40 (s, 2H), 4,22 (m, 2H), 3,85 (m, 2H), 3,40 (m, 2H), 3,18 (s, 3H), 1,80~1,20 (m, 15H), 0,87 (t, 3H, J = 6,8 Hz),
IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 2850, 1725
Elementaranalyse für: $C_{20}H_{32}N_2O_4$
Berechnet (%): C 65,90; H 8,85; N 7,69; O 17,56
Gefunden (%): C 65,73; H 8,77; N 7,83; O 17,67

BEISPIEL 5

2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)aminobenzoesäureethylester (Verbindung 4)

[0092] Ein Gemisch von 8,20 g 3,5-Dimethoxy-4-hydroxyzimtsäure (36,2 mmol) in 30 ml Tetrahydrofuran und 0,265 g N,N-Dimethylformamid wurde auf 0°C gekühlt. Dem Gemisch wurden bei 0 bis 10°C 4,31 g Thionylchlorid (36,2 mmol) zugesetzt. Nachdem das Gemisch 1 Stunde bei 0 bis 10°C gerührt worden war, wurde eine Lösung von 12,00 g 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester (32,9 mmol) in 36 ml Tetrahydrofuran zugegeben. Nachdem das Gemisch 30 Minute bei 0 bis 10°C gerührt worden war, wurden 7,80 g Pyridin (82,2 mmol) zugegeben. Nachdem das Gemisch 30 Minuten bei 0 bis 10°C gerührt worden war, wurden 60 ml Toluol und 60 ml Wasser zugegeben und mit Toluol extrahiert. Die organische Schicht wurde bei verringertem Druck konzentriert unter Erhalt eines Rohprodukts. Die Reinigung dieses Rohprodukts durch Säulenchromatograhie an Silicagel (Hexan-Ethylacetat = 1/2 als Eluens) ergab 17,66 g der Titelverbindung (4). (Ausbeute = 94,0%)
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,52 (s, 1H), 8,94 (s, 1H), 7,96 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,83 (d, 1H, J = 2,0 Hz), 7,76 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,57 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 6,93 (s, 2H), 6,68 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 4,24 (q, 2H), 3,85 (s, 6H), 3,78 (s, 3H), 3,68 (m, 2H), 3,38 (s, 3H), 3,27 (m, 2H), 1,40~1,10 (m, 12H), 0,83 (m, 3H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 1745, 1680, 1225
Elementaranalyse für: $C_{31}H_{42}N_2O_8$
Berechnet (%): C 65,24; H 7,42; N 4,91; O 22,42
Gefunden (%): C 65,35; H 7,35; N 4,96; O 22,34

BEISPIEL 6

2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester (Verbindung 5)

[0093] Zur Lösung von 5,0 g 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester (13,72 mmol) in 15 ml Ethylacetat wurden 3,0 g Essigsäureanhydrid bei Raumtemperatur während 2 Stunden gegeben. Das Reaktionsgemisch wurde filtriert und das Filtrat wurde bei reduziertem Druck eingeengt. Das resultierende Rohprodukt wurde aus Ethylacetat und Hexan kristallisiert, unter Erhalt von 4,73 g der Titelverbindung (5). (Ausbeute = 85,0%)
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,52 (s, 1H), 7,94 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 6,65 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 6,32 (d, 1H, J = 1,6 Hz), 4,24 (q, 2H), 3,78 (s, 3H), 3,68 (m, 2H), 3,38 (s, 3H), 3,27 (m, 2H), 2,34 (s, 3H), 1,40 1,10 (m, 12H), 0,83 (m, 3H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 1745, 1680, 1225
Elementaranalyse für: $C_{22}H_{34}N_2O_5$
Berechnet (%): C 65,00; H 8,43; N 6,89; O 19,68
Gefunden (%): C 65,12; H 8,35; N 6,96; O 19,57

BEISPIEL 7

2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester (Verbindung 6)

[0094] In Übereinstimmung mit Beispiel 4, 2-[(Methoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[(Octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (6) erhalten.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
9,68 (s, 1H), 8,21 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,91 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 4,23 (t, 2H, J = 7,2 Hz), 4,13 (s, 2H), 3,78 (s, 3H), 3,56 (s, 3H), 1,15 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 2850, 1740, 1550, 1345, 1225
Elementaranalyse für: $C_{13}H_{16}N_2O_6$
Berechnet (%): C 52,70; H 5,44; N 9,46; O 32,40
Gefunden (%): C 52,55; H 5,35; N 9,44; O 32,66

BEISPIEL 8

2-[N-Methyl-N-(decyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester (Verbindung 7)

[0095] In Übereinstimmung mit Beispiel 4, 2-[(Decyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[(Octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (7) erhalten.
^{1}H NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
9,68 (s, 1H), 8,21 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,91 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 4,22 (m, 2H), 4,13 (m, 2H), 3,63 (t, 2H, J = 6,4 Hz), 3,56 (s, 3H), 1,80~1,20 (m, 19H), 0,88 (t, 3H, J = 6,8 Hz),
IR (KBr, cm^{-1}): 2850, 1740, 1550, 1345, 1225
Elementaranalyse für: $C_{22}H_{34}N_2O_6$
Berechnet (%): C 62,54; H 8,11; N 6,63; O 22,72
Gefunden (%): C 62,55; H 8,05; N 6,43; O 22,97

BEISPIEL 9

2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-benzylaminobenzoesäureethylester (Verbindung 8)

[0096] In Übereinstimmung mit Beispiel 4, 2-[(Methoxyacetyl)amino]-4-benzylamino-benzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[(Octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäure-ethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (8) erhalten.
^{1}H NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
8,13 (s, 1H), 7,88 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,22 (m, 5H), 6,32 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 5,23 (s, 1H), 5,15 (s, 2H), 4,25 (t, 2H, J = 5,2 Hz), 4,07 (s, 2H), 3,74 (s, 3H), 3,58 (s, 3H), 1,22 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 2850, 1725, 1225
Elementaranalyse für: $C_{20}H_{24}N_2O_4$
Berechnet (%): C 67,39; H 6,79; N 7,86; O 17,96

Gefunden (%): C 67,55, H 6,84; N 7,83; O 17,78

BEISPIEL 10

2-[N-Decyl-N-(butoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester (Verbindung 9)

[0097] In Übereinstimmung mit Beispiel 1, 4-Nitro-N-decylanthranilsäureethylester und Butoxyessigsäure wurden anstelle von 4-Nitroanthranilsäureethylester und Octyloxyessigsäure verwendet, wurde die Titelverbindung (9) erhalten.
^{1}H NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
9,68 (s, 1H), 8,21 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,91 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 4,22 (m, 4H), 4,13 (s, 2H), 3,63 (m, 2H), 2,25~1,20 (m, 20H), 1,23 (t, 3H, J = 7,0 Hz), 0,88 (m, 6H)
IR (KBr, cm^{-1}): 2850, 1740, 1550, 1345
Elementaranalyse für: $C_{25}H_{40}N_2O_6$
Berechnet (%): C 64,63; H 8,63; N 6,03; O 20,66
Gefunden (%): C 64,55; H 8,84; N 6,00; O 20,61

BEISPIEL 11

2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-decylaminobenzoesäureethylester (Verbindung 10)

[0098] In Übereinstinunung mit Beispiel 1, 4-Nitro-N-methylanthranilsäureethylester und Methoxyessigsäure wurden anstelle von 4-Nitroanthranilsäureethylester und Octyloxyessigsäure verwendet, wurde die Titelverbindung (10) erhalten.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
8,13 (s, 1H), 7,88 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 6,32 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 5,23 (s, 1H), 4,25 (t, 2H, J = 5,2 Hz), 4,07 (s, 2H), 3,74 (s, 3H), 3,58 (s, 3H), 2,25~1,26 (m, 21H), 0,90 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 2850, 1725, 1225
Elementaranalyse für: $C_{23}H_{38}N_2O_4$
Berechnet (%): C 67,94; H 9,42; N 6,89; O 15,74
Gefunden (%): C 67,99; H 9,34, N 6,78; O 15,89

BEISPIEL 12

2-[N-(2-Propenyl)-N-(methoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester (Verbindung 11)

[0099] In Übereinstimmung mit Beispiel 1, 4-Nitro-N-(2-propenyl)anthranilsäureethylester und Methoxyessigsäure wurden anstelle von 4-Nitroanthranilsäureethylester und Octyloxyessigsäure verwendet, wurde die Titelverbinding (11) erhalten.
^{1}H NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
9,68 (s, 1H), 8,21 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,91 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 5,95 (m, 1H), 5,20 5,02 (m, 2H), 4,23 (t, 2H, J = 7,2 Hz), 4,13 (s, 2H), 3,78 (s, 3H), 3,45 (d, 2H, J = 7,2 Hz), 1,15 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 2850, 1740, 1550, 1345
Elementaranalyse für: $C_{15}H_{18}N_2O_6$
Berechnet (%): C 57,48; H 5,43; N 8,38; O 28,72
Gefunden (%): C 57,55; H 5,45; N 8,22; O 28,78

BEISPIEL 13

2-[N-Geranyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester (Verbindung 12)

[0100] In Übereinstimmung mit Beispiel 3, 2-[N-Geranyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[Octyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäure-ethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (12) erhalten.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
8,13 (s, 1H), 7,88 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 6,32 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 5,40 (m, 1H), 5,10 (m, 1H), 4,35 (t, 2H, J = 5,2 Hz), 4,22 (bs, 2H), 4,07 (s, 2H), 3,74 (t, 2H, J = 5,2 Hz), 3,45 (m, 2H), 2,25~1,55 (m, 13H), 1,18 (m, 6H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 2850, 1725, 1225
Elementaranalyse für: $C_{23}H_{34}N_2O_4$
Berechnet (%): C 68,63; H 8,51; N 6,96; O 15,90

Gefunden (%): C 68,55; H 8,57; N 6,86; O 16,02

BEISPIEL 14

2-[N-Methyl-N-(geranyloxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester (Verbindung 13)

[0101] In Übereinstimmung mit Beispiel 1, 4-Acetylamino-N-methylanthranilsäureethylester und Geranyloxyessigsäure wurden anstelle von 4-Nitroanthranilsäureethylester und Octyloxyessigsäure verwendet, wurde die Titelverbindung (13) erhalten.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
10,89 (s, 1H), 8,13 (s, 1H), 7,88 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 6,32 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 5,40 (m, 1H), 5,10 (m, 1H), 4,13 (t, 2H, J = 5,2 Hz), 4,07 (s, 2H), 3,74 (t, 2H, J = 5,2 Hz), 3,55 (s, 3H), 2,25~1,55 (m, 13H), 2,23 (s, 3H), 1,18 (m, 3H)
IR (KBr, cm^1): 3350, 2850, 1725, 1225
Elementaranalyse für: $C_{24}H_{34}N_2O_5$
Berechnet (%): C 66,95; H 7,96; N 6,51; O 18,58
Gefunden (%): C 66,89; H 7,97; N 6,45 O 18,69

BEISPIEL 15

2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-(N,N-dimethyl)aminobenzoesäureethylester (Verbindung 14)

[0102] In Übereinstimmung mit Beispiel 1, 4-(N,N-Dimethyl)amino-N-methylanthranilsäureethylester wurde anstelle von 4-Nitroanthranilsäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (14) erhalten.
^{1}H NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
7,94 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 6,65 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 6,32 (d, 1H, J = 1,6 Hz), 4,27 (m, 2H), 4,06 (s, 2H), 3,78 (m, 2H), 3,18 (s, 3H), 2,56 (s, 6H), 1,80~1,20 (m, 15H), 0,87 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 2850, 1725, 1225
Elementaranalyse für: $C_{22}H_{36}N_2O_4$
Berechnet (%): C 67,31; H 9,24; N 7,14; O 16,30
Gefunden (%): C 67,34; H 9,14; N 7,13; O 16,39

BEISPIEL 16

2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-vinylaminobenzoesäureethylester (Verbindung 15)

[0103] In Übereinstimmung mit Beispiel 1, 4-Vinylamino-N-methylanthranilsäureethylester und Methoxyessigsäure wurden anstelle von 4-Nitroanthranilsäureethylester und Octyloxyessigsäure verwendet, wurde die Titelverbindung (15) erhalten.
^{1}H NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
7,88 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 6,65 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 6,32 (d, 1H, J = 1,6 Hz), 6,23 (m, 1H), 5,26 (s, 1H), 4,90 (m, 1H), 4,56 (m, 1H), 4,25 (t, 2H, J = 5,2 Hz), 4,07 (s, 2H), 3,74 (s, 3H), 3,58 (s, 3H), 1,22 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 2850, 1725, 1225
Elementaranalyse für: $C_{15}H_{20}N_2O_4$
Berechnet (%): C 61,63; H 6,90; N 9,58; O 21,89
Gefunden (%): C 61,55; H 6,84; N 9,43; O 22,18

BEISPIEL 17

2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino)-4-geranylaminobenzoesäureethylester (Verbindung 16)

[0104] In Übereinstimmung mit Beispiel 1, 4-Geranylamino-N-methylanthranilsäureethylester und Methoxyessigsäure wurden anstelle von 4-Nitroanthranilsäureethylester und Octyloxyessigsäure verwendet, wurde die Titelverbindung (16) erhalten.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
7,88 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 6,65 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 6,32 (d, 1H, J = 1,6 Hz), 6,23 (m, 1H), 5,45 (m, 1H), 5,26 (s, 1H), 5,08 (m, 1H), 4,25 (t, 2H, J = 5,2 Hz), 4,10 (d, 2H, J = 7,5 Hz), 4,07 (s, 2H), 3,58 (s, 3H), 2,25~1,55 (m, 13H), 1,22 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 2850, 1725, 1225
Elementaranalyse für: $C_{23}H_{34}N_2O_4$

Berechnet (%): C 68,63; H 8,51; N 6,96; O 15,90
Gefunden (%): C 68,55; H 8,64; N 6,93; O 15,88

BEISPIEL 18

2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,4,5-trimethoxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester (Verbindung 17)

[0105] In Übereinstimmung mit Beispiel 5, 3,4,5-Trimethoxyzimtsäure wurde anstelle von 3,5-Dimethoxy-4-hydroxyzimtsäure verwendet, wurde die Titelverbindung (17) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,52 (s, 1H), 7,96 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,83 (d, 1H, J = 2,0 Hz), 7,76 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,57 (d, 1H, 15,6 Hz), 6,93 (s, 2H), 6,68 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 4,24 (q, 2H), 3,78 (s, 9H), 3,78 (s, 3H), 3,68 (m, 2H), 3,38 (s, 3H), 3,27 (m, 2H), 1,40~1,10 (m, 12H), 0,83 (m, 3H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 1745, 1680, 1225
Elementaranalyse für: $C_{33}H_{44}N_2O_8$
Berechnet (%): C 65,73; H 7,59; N 4,79; O 21,89
Gefunden (%): C 65,67; H 7,55; N 4,86; O 21,92

BEISPIEL 19

7-[(3,5-Dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 18)

[0106] Eine Lösung von 16,25 g Kalium-tert.-butanoat (114,9 mmol) in 97 ml Tetrahydrofuran wurde bei Raumtemperatur gerührt. Nachdem die Lösung auf 0°C gekühlt war, wurde eine Lösung von 18,77 g 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]-benzoesäureethylester (32,9 mmol) in 56 ml Tetrahydrofuran bei 0 bis 10°C zugetropft. Nachdem das Gemisch für 0 bis 10°C für 30 Minuten gerührt worden war, wurden 85 g einer wässrigen 2 mol/l-Lösung von Chlorwasserstoff zugegeben und es wurde mit 38 ml Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde mit 60 g 1%iger NaCl-Lösung in Wasser gewaschen und bei reduziertem Druck unter Erhalt eines Rohprodukts eingeengt. Das resultierende Rohprodukt wurde aus 2-Propanol kristallisiert, unter Erhalt von 15,87 g der Titelverbindung (18). (Ausbeute = 92,0%)
^{1}H NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,39 (s, 1H), 10,29 (s, 1H), 8,92 (s, 1H), 7,99 (s, 1H), 7,85 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,53 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 7,49 (s, 1H), 6,93 (s, 2H), 6,75 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 3,92 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,82 (s, 6H), 3,54 (s, 3H), 1,68 (m, 2H), 1,25 (m, 10H), 0,86 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1600, 1515, 1250
Elementaranalyse für: $C_{29}H_{36}N_2O_7$
Berechnet (%): C 66,39; H 6,92; N 5,34; O 21,35
Gefunden (%): C 66,45; H 7,08; N 4,96; O 21,51

BEISPIEL 20

7-[(3,5-Dimethoxy-4-hydroxy-cinnamoyl)amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 18)

[0107] Zu einem Gemisch von 5,80 g Natriumhydrid (Reinheit 60%, 114,9 mmol) in 90 ml Tetrahydrofuran wurde eine Lösung von 18,77 g 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester (32,9 mmol} in 56 ml Tetrahydrofuran bei 0 bis 10°C gegeben. Nachdem das Gemisch 30 Minuten bei 0 bis 10°C gerührt worden war, wurden 85 g einer wässrigen 2 mol/l-Lösung von Chlorwasserstoff zugegeben und es wurde mit 38 ml Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde mit 16 g einer 1%igen NaCl-Lösung in Wasser gewaschen und bei verringertem Druck unter Erhalt eines Rohprodukts eingeengt. Das resultierende Rohprodukt wurde aus 2-Propanol kristallisier, unter Erhalt von 7,70 g der Titelverbindung (18). (Ausbeute = 92,0%)

BEISPIEL 21

7-[(3,5-Dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 18)

[0108] Zu einer Lösung von 144,9 mmol LHDS(LHDS: Lithiumhexamethylsilazid) in 150 ml Tetrahydrofuran wurde eine Lösung von 18,77 g 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxy-cinnamoyl)amino]benzoesäureethylester (32,9 mmol) in 56 ml Tetrahydrofuran bei –40°C gegeben. Nachdem das Gemisch 30 Minuten bei –40°C gerührt worden war, wurden 85 g einer wässrigen 2 mol/l-Lösung von Chlorwasserstoff zugegeben und es wurde mit 38 ml Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde mit 60 g einer 1%igen NaCl-Lösung in Wasser gewaschen und bei verringertem Druck unter Erhalt eines Rohprodukts eingeengt. Das resultierende Rohprodukt wurde aus 2-Propanol kristallisiert, unter Erhalt von 16,05 g der Titelverbindung (18). (Ausbeute = 93,0%)

BEISPIEL 22

7-[(3,5-Dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 18)

[0109] Zu einer Lösung von 144,9 mol LDA(LDA: Lithiumdiisopropylamid) in 150 ml Tetrahydrofuran wurde eine Lösung von 18,77 g 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester (32,9 mmol) in 56 ml Tetrahydrofuran bei –40°C gegeben. Nachdem das Gemisch 30 Minuten bei –40°C gerührt worden war, wurden 85 g einer wässrigen 2 mol/l-Lösung von Chlorwasserstoff zugegeben und mit 38 ml Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde mit 60 g einer 1%igen NaCl-Lösung in Wasser gewaschen und bei verringertem Druck unter Erhalt eines Rohprodukts eingeengt. Das resultierende Rohprodukt wurde aus 2-Propanol kristallisiert, unter Erhalt von 15,18 g der Titelverbindung (18). (Ausbeute = 88,0%)

BEISPIEL 23

7-Acetylamino-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 19)

[0110] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (19) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,28 (s, 1H), 10,23 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,80 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,42 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 3,94 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,52 (s, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,69 (m, 2H), 1,25 (m, 10H), 0,86 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1515, 1250
Elementaranalyse für: $C_{20}H_{28}N_2O_4$
Berechnet (%): C 66,64; H 7,83; N 7,77; O 17,76
Gefunden (%): C 66,55; H 7,78; N 7,86; O 17,81

BEISPIEL 24

7-Benzoylamino-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 20)

[0111] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-benzoylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (20) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,28 (s, 1H), 10,23 (s, 1H), 8,10 (m, 2H), 7,85 (s, 1H), 7,80 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,60 7,45 (m, 3H), 7,42 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 3,94 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,52 (s, 3H), 1,69 (m, 2H), 1,25 (m, 10H), 0,86 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1515, 1250
Elementaranalyse für: $C_{25}H_{30}N_2O_4$
Berechnet (%): C 71,06; H 7,16; N 6,63; O 15,15
Gefunden (%): C 71,00; H 7,28; N 6,56; O 15,16

BEISPIEL 25

7-Nitro-3-methoxy-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 21)

[0112] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Ethyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester, wurde die Titelverbindung (21) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,05 (s, 1H), 8,05 (m, 3H), 3,75 (s, 3H), 3,68 (d, 2H, J = 6,8 Hz), 1,23 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1515, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{12}H_{12}N_2O_5$
Berechnet (%): C 54,54; H 4,58; N 10,60; O 30,28
Gefunden (%): C 54,44; H 4,65; N 10,56; O 30,35

BEISPIEL 26

6-Nitro-3-methoxy-4-hydroxy-1-octyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 22)

[0113] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Octyl-N-(methoxyacetyl)amino]-5-nitrobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (22) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,05 (s, 1H), 8,05 (m, 3H), 3,75 (s, 3H), 3,68 (d, 2H, J = 6,8 Hz), 1,87~1,23 (m, 12H), 0,90 (t, 3H, J = 6,9 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3500, 2940, 1610, 1515, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{18}H_{24}N_2O_5$
Berechnet (%): C 62,05; H 6,94; N 8,04; O 22,96
Gefunden (%): C 62,00; H 7,08; N 8,02; O 22,90

BEISPIEL 27

5-Amino-3-ethoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 23)

[0114] In Übereinstimmung mit Beispiel 22, 2-[N-Methyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-6-aminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (23) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,88~7,50 (m, 3H), 5,90 (bs, 2H), 4,23 (q, 2H, J = 6,8 Hz), 3,65 (s, 3H), 1,23 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{12}H_{14}N_2O_3$
Berechnet (%): C 61,52; H 6,02; N 11,96; O 20,49
Gefunden (%): C 61,55; H 6,07; N 11,78; O 20,60

BEISPIEL 28

6-Amino-3-phenoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 24)

[0115] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Methyl-N-(phenoxyacetyl)amino]-5-aminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (24) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,90~7,23 (m, 8H), 5,65 (bs, 2H), 3,65 (s, 3H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{16}H_{14}N_2O_3$
Berechnet (%): C 68,07; H 5,00; N 9,92; O 17,00
Gefunden (%): C 68,00; H 5,18; N 9,89; O 16,93

BEISPIEL 29

5-Acetylamino-3-ethoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 25)

[0116] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Methyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-6-acetylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (25) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,07 (s, 1H), 10,85 (s, 1H), 7,90 7,23 (m, 3H), 4,22 (m, 2H), 3,65 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 1,23 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{14}H_{16}N_2O_4$
Berechnet (%): C 60,86; H 5,84; N 10,14; O 23,16
Gefunden (%): C 60,99; H 5,78; N 10,09; O 23,14

BEISPIEL 30

6-Acetylamino-3-phenoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 26)

[0117] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Methyl-N-(phenoxyacetyl)amino]-5-acetylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (26) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,07 (s, 1H), 10,85 (s, 1H), 7,90 7,23 (m, 8H), 3,65 (s, 3H), 2,35 (s, 3H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{18}H_{16}N_2O_4$
Berechnet (%): C 66,66; H 4,97; N 8,64; O 19,73
Gefunden (%): C 66,54; H 4,90; N 8,66; O 19,90

BEISPIEL 31

5-Propenylamino-3-ethoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 27)

[0118] In Übereinstimmung mit Beispiel 22, 2-[N-Methyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-6-propenylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (27) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,90 7,23 (m, 3H), 5,96 (m, 1H), 5,26 (m, 3H), 4,22 (m, 2H), 3,88 (m, 2H), 3,65 (s, 3H), 1,23 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{15}H_{18}N_2O_3$
Berechnet (%): C 65,67; H 6,61; N 10,21; O 17,50
Gefunden (%): C 65,55; H 6,64; N 10,34; O 17,47

BEISPIEL 32

6-Benzylamino-3-phenoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 28)

[0119] In Übereinstimmung mit Beispiel 22, 2-[N-Methyl-N-(phenoxyacetyl)amino]-5-benzylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (28) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,90 7,15 (m, 13H), 5,26 (s, 1H), 3,65 (s, 3H), 3,45 (m, 2H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{23}H_{33}N_2O_3$
Berechnet (%): C 74,17; H 5,41; N 7,52; O 12,89
Gefunden (%): C 74,00; H 5,48; N 7,56; O 12,96

BEISPIEL 33

5-Hydroxy-3-ethoxy-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 29)

[0120] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Ethyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-6-hydroxybenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (29) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,07 (s, 1H), 10,75 (s, 1H), 7,65 7,13 (m, 3H), 4,22 (m, 2H), 3,65 (t, 2H), 1,23 (m, 6H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{13}H_{15}N_1O_4$
Berechnet (%): C 62,64; H 6,07; N 5,62; O 25,68
Gefunden (%): C 62,68; H 6,05; N 5,56; O 25,71

BEISPIEL 34

7-Hydroxy-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 30)

[0121] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-hydroxybenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (30) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,23 (s, 1H), 9,98 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,76 (d, 1H, J = 7,2 Hz), 7,50 (d, 1H, J = 7,2 Hz), 4,23 (d, 2H, J = 7,6 Hz), 3,54 (s, 3H), 1,86~1,45 (m, 12H), 0,97 (t, 3H, J = 7,5 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{18}H_{25}N_1O_4$
Berechnet (%): C 67,69; H 7,89; N 4,39; O 20,04
Gefunden (%): C 67,78; H 7,78; N 4,44; O 20,00

BEISPIEL 35

5-Phenoxy-3-ethoxy-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 31)

[0122] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Ethyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-6-phenoxybenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (31) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS) 10,75 (s, 1H), 7,65~7,13 (m, 8H), 4,22 (m, 2H), 3,65 (t, 2H), 1,23 (m, 6H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{19}H_{19}N_2O_4$
Berechnet (%): C 70,14; H 5,89; N 4,31; O 19,67
Gefunden (%): C 70,08; H 5,78; N 4,46; O 19,68

BEISPIEL 36

7-Methoxy-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 32)

[0123] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-methoxybenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester, wurde die Titelverbindung (32) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,23 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,76 (d, 1H, J = 7,2 Hz), 7,50 (d, 1H, J = 7,2 Hz), 4,23 (d, 2H, J = 7,6 Hz), 3,78 (s, 3H), 3,54 (s, 3H), 1,86~1,45 (m, 12H), 0,97 (t, 3H, J = 7,5 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{19}H_{27}N_1O_4$
Berechnet (%): C 68,44; H 8,16; N 4,20; O 19,20
Gefunden (%): C 68,24; H 8,28; N 4,21; O 19,27

BEISPIEL 37

7-Butoxy-3-octyloxy-4-hydroxy-1-propenyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 33)

[0124] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Propenyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-butoxybenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (33) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS) 11,02 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,76 (d, 1H, J = 7,2 Hz), 7,50 (d, 1H, J = 7,2 Hz), 5,95 (m, 1H), 5,10 (m, 2H), 4,23 (m, 4H), 3,30 (d, 2H, J = 7,2 Hz), 1,86~1,45 (m, 16H), 0,97 (m, 6H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{24}H_{35}N_1O_4$
Berechnet (%): C 71,79; H 8,79; N 3,49; O 15,94
Gefunden (%): C 71,67; H 8,66; N 3,48; O 16,19

BEISPIEL 38

6-Phenyl-3-phenoxy-4-hydroxy-1-octyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 34)

[0125] In Übereinstimmung mit Beispiel 22, 2-[N-Octyl-N-(phenoxyacetyl)amino]-5-phenylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (34) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,90 7,15 (m, 13H), 3,65 (d, 2H, J = 6,8 Hz), 1,84~1,23 (m, 12H), 0, 90 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{29}H_{31}N_1O_4$
Berechnet (%): C 76,12; H 6,83; N 3,06, O 13,99
Gefunden (%): C 76,01; H 6,87; N 3,05; O 14,07

BEISPIEL 39

7-Methyl-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 35)

[0126] In Übereinstimmung mit Beispiel 22, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-methylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (35) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,23 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,76 (d, 1H, J = 7,2 Hz), 7,50 (d, 1H, J = 7,2 Hz), 4,23 (d, 2H, J = 7,6 Hz), 3,54 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,86~1,45 (m, 12H), 0,97 (t, 3H, J = 7,5 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{19}H_{27}N_1O_3$
Berechnet (%): C 71,89; H 8,57; N 4,41; O 15,12
Gefunden (%): C 71,77; H 8,43; N 4,45; O 15,35

BEISPIEL 40

5,7-Dihydroxy-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 36)

[0127] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4,6-dihydroxybenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (36) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,23 (s, 1H), 10,87 (s, 1H), 10,23 (s, 1H), 7,56 (s, 1H), 7,50 (s, 1H), 3,89 (s, 3H), 3,64 (s, 3H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{11}H_{11}N_1O_5$
Berechnet (%): C 71,06; H 7,16; N 6,63; O 15,15
Gefunden (%): C 71,00; H 7,28; N 6,56; O 15,16

BEISPIEL 41

5,7-Dibenzyloxy-3-geranyloxy-4-hydroxy-1-benzyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 37)

[0128] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Benzyl-N-(geranyloxyacetyl)amino)-4,6-dibenzyloxybenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (37) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,87 (s, 1H), 7,65 7,13 (m, 23H), 5,40 (m, 1H), 4,12 (m, 2H), 2,15 1,60 (m, 13H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{40}H_{41}N_1O_5$
Berechnet (%): C 78,02; H 6,71; N 2,27; O 12,99
Gefunden (%): C 78,00; H 6,78; N 2,34; O 12,88

BEISPIEL 42

5-Ethoxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 38)

[0129] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-6-ethoxycarbonylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-((3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (38) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,68 (s, 1H), 7,88~7,55 (m, 3H), 4,22 (t, 2H, J = 6,9 Hz), 3,84 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,62 (s, 3H), 1,78~1,34 (m, 4H), 1,22 (t, 3H, J = 6,8 Hz), 0,96 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1715, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{40}H_{41}N_1O_5$
Berechnet (%): C 63,93; H 6,63; N 4,39; O 25,05
Gefunden (%): C 63,99; H 6,56; N 4,23; O 25,22

BEISPIEL 43

7-Nitro-3-methoxy-4-hydroxy-1-(2-hydroxyethyl)-2(1H)-chinolinon (Verbindung 39)

[0130] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-(2-Hydroxyethyl)-N-(methoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (39) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,05 (s, 1H), 8,05 (m, 3H), 3,75 (s, 3H), 3,68 (s, 3H), 2,88 (m, 2H),
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1515, 1400, 1250
Elementaranalyse für: $C_{12}H_{12}N_2O_6$
Berechnet (%): C 51,43; H 4,32; N 9,99; O 34,26
Gefunden (%): C 51,33, H 4,35; N 10,01; O 34,31

BEISPIEL 44

7-Acetylamino-3-octyloxy-4-hydroxyl-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 19)

[0131] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester und Magnesiumethoxid wurden anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester und Kalium-tert.-butoxid verwendet, wurde die Titelverbindung (19) erhalten.

BEISPIEL 45

7-Acetylamino-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 19)

[0132] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester und Calciumhydrid wurden anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester und Natriumhydrid verwendet, wurde die Titelverbindung (19) erhalten.

BEISPIEL 46

5-Nitro-3-methoxy-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 40)

[0133] In Übereinstimmung mit Beispiel 25, 2-[N-Ethyl-N-(methoxyacetyl)amino]-6-nitrobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (40) erhalten.
^{1}H NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,05 (s, 1H), 8,09 (m, 3H), 3,75 (s, 3H), 3,68 (d, 2H, J = 6,8 Hz), 1,23 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1515, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{12}H_{12}N_2O_5$
Berechnet (%): C 54,54; H 4,58; N 10,60; O 30,28
Gefunden (%): C 54,43; H 4,58; N 10,67; O 30,45

BEISPIEL 47

6-Nitro-3-butoxy-4-hydroxy-1-decyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 41)

[0134] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Decyl-N-(butoxyacetyl)amino]-5-nitrobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (41) erhalten.
^{1}H NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,05 (s, 1H), 8,09 (m, 3H), 4,12 (d, 2H, J = 6,8 Hz), 3,75 (d, 2H, J = 6,9 Hz), 2,23 1,23 (m, 20H), 0,90 (m, 6H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1515, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{23}H_{34}N_2O_5$
Berechnet (%): C 66,00; H 8,19; N 6,69; O 19,12
Gefunden (%): C 66,09; H 8,09; N 6,67; O 19,15

BEISPIEL 48

8-Nitro-3-methoxy-4-hydroxy-1-benzyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 42)

[0135] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Benzyl-N-(methoxyacetyl)amino]-3-nitrobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (42) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,05 (s, 1H), 8,09 (m, 3H), 7,25 (m, 5H), 5,23 (s, 2H), 3,89 (s, 3H),
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1515, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{17}H_{14}N_2O_5$
Berechnet (%): C 62,57; H 4,32; N 8,59; O 24,52
Gefunden (%): C 62,45; H 4,45; N 8,67; O 24,43

BEISPIEL 49

6-Nitro-3-butoxy-4-hydroxy-1-(6-hydroxyhexyl)-2(1H)-chinolinon (Verbindung 43)

[0136] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-(6-Hydroxyhexyl)-N-(butoxyacetyl)amino]-5-nitrobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (43) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,05 (s, 1H), 8,05 (m, 3H), 4,12 (d, 2H, J = 6,8 Hz), 3,87 (m, 3H), 3,75 (d, 2H, J = 6,9 Hz), 2,23~1,23 (m, 12H), 0,90 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1515, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{19}H_{25}N_2O_6$
Berechnet (%): C 60,30; H 6,93; N 7,40; O 25,38
Gefunden (%): C 60,24; H 7,09; N 7,28; O 25,39

BEISPIEL 50

5-Amino-3-ethoxy-4-hydroxy-1-geranyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 44)

[0137] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Geranyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-6-aminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (44) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,87 (s, 1H), 7,65~7,06 (m, 3H), 5,40 (m, 1H), 5,25 (m, 2H), 5,10 (m, 1H), 4,12 (m, 2H), 3,34 (m, 2H), 2,15~1,60 (m, 13H), 1,23 (t, 3H, J = 7,2 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1515, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{21}H_{28}N_2O_3$
Berechnet (%): C 70,76; H 7,92; N 7,86; O 13,47
Gefunden (%): C 70,74; H 7,89; N 7,78; O 25,39

BEISPIEL 51

8-Amino-3-geranyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 45)

[0138] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Methyl-N-(geranyloxyacetyl)amino]-3-aminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (45) erhalten.
^{1}H NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,87 (s, 1H), 7,65~7,06 (m, 3H), 5,40 (m, 1H), 5,25 (m, 2H), 5,10 (m, 1H), 4,23 (m, 2H), 3,67 (s, 3H), 2,15~1,60 (m, 13H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1515, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{20}H_{35}N_2O_3$
Berechnet (%): C 70,15; H 7,65; N 8,18; O 14,02
Gefunden (%): C 70,18; H 7,79; N 7,98; O 14,05

BEISPIEL 52

7-[(3,4,5-Trimethoxycinnamoyl)amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 46)

[0139] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,4,5-trimethoxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (46) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,39 (s, 1H), 8,92 (s, 1H), 7,99 (s, 1H), 7,85 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,53 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 7,49 (s, 1H), 6,93 (s, 2H), 6,75 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 3,92 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,78 (s, 9H), 3,54 (s, 3H), 1,68 (m, 2H), 1,25 (m, 10H), 0,86 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1600, 1515, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{30}H_{38}N_2O_7$
Berechnet (%): C 66,89; H 7,12; N 5,20; O 20,79
Gefunden (%): C 66,78; H 7,08; N 5,23; O 20,91

BEISPIEL 53

5-Methylamino-3-benzyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 47)

[0140] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Methyl-N-(benzyloxyacetyl)amino]-6-methylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (47) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,88~7,20 (m, 8H), 5,70 (bs, 1H), 5,15 (s, 2H), 3,65 (s, 3H), 2,78 (s, 3H),
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1515, 1100
Elementaranalyse für: $C_{18}H_{18}N_2O_3$ Berechnet (%): C 69,66, H 5,85; N 9,03; O 15,47
Gefunden (%): C 69,78; H 5,78; N 9,00; O 15,44

BEISPIEL 54

5-Hexylamino-3-(3,5-dimethylbenzyloxy)-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 48)

[0141] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Ethyl-N-(3,5-dimethylbenzyloxyacetyl)amino]-6-hexylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (48) erhalten.
^{1}H NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,88~7,20 (m, 6H), 5,65 (bs, 1H), 5,13 (s, 2H), 3,65 (d, 2H, J = 7,2 Hz), 2,89 (t, 2H, J = 6,9 Hz), 1,86~1,23 (m, 8H), 2,18 (s, 6H), 1,15 (t, 3H, J = 7,2 Hz), 0,90 (t, 3H, J = 6,9 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550,2 940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{26}H_{34}N_2O_3$
Berechnet (%): C 73,90; H 8,11; N 6,63; O 11,36
Gefunden (%): C 73,88; H 8,05; N 6,69; O 11,38

BEISPIEL 55

6-Decylamino-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 49)

[0142] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-5-decylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (49) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,88~7,40 (m, 3H), 5,65 (bs, 1H), 3,79 (s, 3H), 3,65 (s, 3H), 2,78 (t, 2H, J = 6,9 Hz), 1,89~1,18 (m, 16H), 0,90 (t, 3H, J = 6,9 Hz),
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{21}H_{32}N_2O_3$
Berechnet (%): C 69,97; H 8,95; N 7,77; O 13,32
Gefunden (%): C 69,98; H 8,95; N 7,58; O 13,49

BEISPIEL 56

6-Vinylamino-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 50)

[0143] In Übereinstimmung mit Beispiel 22, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-5-vinylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (50) erhalten.
^{1}H NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,88~7,40 (m, 3H), 6,23 (m, 1H), 5,26 (s, 1H), 4,90 (m, 1H), 4,56 (m, 1H), 3,87 (s, 3H), 3,65 (s, 3H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{13}H_{14}N_2O_3$
Berechnet (%): C 63,40; H 5,73; N 11,38; O 19,49
Gefunden (%): C 63,39; H 5,78; N 11,45; O 19,38

BEISPIEL 57

6-(3,5-Dimethylbenzylamino)-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 51)

[0144] In Übereinstimmung mit Beispiel 22, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-5-(3,5-dimethylbenzylamino)benzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (51) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,88~7,20 (m, 6H), 5,65 (bs, 1H), 3,78 (s, 3H), 3,56 (s, 3H), 3,06 (s, 2H), 2,18 (s, 6H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{20}H_{22}N_2O_3$
Berechnet (%): C 70,98; H 6,55; N 8,28; O 14,18
Gefunden (%): C 71,01; H 6,45; N 8,33; O 14,21

BEISPIEL 58

6-Geranylamino-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 52)

[0145] In Übereinstimmung mit Beispiel 19 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-5-geranylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (52) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,68~7,20 (m, 3H), 5,65 (bs, 1H), 5,45 (m, 1H), 5,08 (m, 1H), 3,78 (s, 3H), 3,56 (s, 3H), 3,34 (d, 2H, J = 7,5 Hz), 2,25~1,55 (m, 13H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{21}H_{28}N_2O_3$
Berechnet (%): C 70,76; H 7,92; N 7,86; O 13,47
Gefunden (%): C 70,67; H 7,96; N 7,87; O 13,50

BEISPIEL 59

8-Butylamino-3-geranyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 53)

[0146] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Methyl-N-(geranyloxyacetyl)amino]-3-butylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (53) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,68~7,20 (m, 3H), 5,58 (bs, 1H), 5,45 (m, 1H), 5,08 (m, 1H), 4,12 (d, 2H, J = 7,5 Hz), 3,56 (s, 3H), 2,89 (d, 2H, J = 7,2 Hz), 2,25~1,55 (m, 17H), 0,90 (t, 3H, J = 6,9 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{24}H_{34}N_2O_3$
Berechnet (%): C 72,33; H 8,60; N 7,03; O 12,04
Gefunden (%): C 72,18; H 8,59; N 7,07; O 12,16

BEISPIEL 60

6-Decyloxy-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 54)

[0147] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-5-decylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (54) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,68~7,20 (m, 3H), 4,18 (d, 2H, J = 7,2 Hz), 3,80 (d, 2H), 3,56 (s, 3H), 1,86~1,18 (m, 16H), 0,90 (t, 3H, J = 6,9 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{21}H_{31}N_1O_4$
Berechnet (%): C 69,77; H 8,65; N 3,88; O 17,71
Gefunden (%): C 69,68; H 8,59; N 3,90; O 17,83

BEISPIEL 61

6-(2-Propenyloxy)-3-phenoxy-4-hydroxy-1-octyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 55)

[0148] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Octyl-N-(phenoxyacetyl)amino]-5-(2-propenyloxy)benzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (55) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,75~7,20 (m, 8H), 5,80 (m, 1H), 5,25 (m, 2H), 4,45 (m, 2H), 3,67 (t, 2H, J = 7,4 Hz), 1,86~1,18 (m, 12H), 0,90 (t, 3H, J = 6,9 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{26}H_{31}N_1O_4$
Berechnet (%): C 74,08; H 7,41; N 3,32; O 15,18
Gefunden (%): C 74,10; H 7,43; N 3,40; O 15,07

BEISPIEL 62

8-Benzyloxy-3-geranyloxy-4-hydroxy-1-benzyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 56)

[0149] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Benzyl-N-(geranyloxyacetyl)amino)-3-benzylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (56) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS) 10,85 (s, 1H), 7,75~7,20 (m, 13H), 5,40 (m, 1H), 5,10 (m, 1H), 5,20 (s, 2H), 4,24 (t, 2H, J = 7,4 Hz), 3,67 (s, 2H), 2,15~1,45 (m, 13H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{33}H_{35}N_1O_4$
Berechnet (%): C 77,77; H 6,92; N 2,75; O 12,56
Gefunden (%): C 77,88; H 6,89; N 2,76; O 12,47

BEISPIEL 63

7-Methyl-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 57)

[0150] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-methylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (57) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,75~7,20 (m, 3H), 3,78 (s, 3H), 3,65 (s, 3H), 2,15 (s, 3H),
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{12}H_{13}N_1O_3$
Berechnet (%): C 65,74; H 5,98; N 6,93; O 21,89
Gefunden (%): C 65,77; H 5,89; N 6,55; O 21,79

BEISPIEL 64

7-Hexyl-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 58)

[0151] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-hexylbenzoesäureethylester anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (58) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,75 7,20 (m, 3H), 3,74 (s, 3H), 3,65 (s, 3H), 2,22 (d, 2H, J = 7,0 Hz), 1,78~1,23 (m, 8H), 0,89 (t, 3H, J = 7,0 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{17}H_{23}N_1O_3$
Berechnet (%): C 70,56; H 8,01; N 4,84; O 16,59
Gefunden (%): C 70,55; H 7,97; N 4,87; O 16,61

BEISPIEL 65

7-Decyl-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 59)

[0152] In Übereinstimmung mit Beispiel 22, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-decylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3, 5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (59) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,75~7,20 (m, 3H), 3,74 (s, 3H), 3,69 (s, 3H), 2,14 (d, 2H, J = 7,0 Hz), 1,78~1,23 (m, 16H), 0,89 (t, 3H, J = 7,0 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{21}H_{31}N_1O_3$
Berechnet (%): C 73,00; H 9,05; N 4,05; O 13,89
Gefunden (%): C 72,89; H 8,97; N 4,03; O 14,11

BEISPIEL 66

6-(2-Propenyl)-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 60)

[0153] In Übereinstimmung mit Beispiel 22, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-5-(2-propenyl)benzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (60) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS) 10,85 (s, 1H), 7,75~7,20 (m, 3H), 6,06 (m, 1H), 5,33 (m, 1H), 5,15 (m, 1H), 3,74 (s, 3H), 3,69 (s, 3H), 3,23 (m, 2H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{14}H_{15}N_1O_3$
Berechnet (%): C 68,55; H 6,16; N 5,71; O 19,57
Gefunden (%): C 68,45; H 6,23; N 5,69; O 19,63

BEISPIEL 67

6-Geranyl-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 61)

[0154] In Übereinstimmung mit Beispiel 22, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-5-geranylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (61) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,75~7,15 (m, 3H), 5,42 (m, 1H), 5,10 (m, 1H), 3,74 (s, 3H), 3,69 (s, 3H), 2,23~1,55 (m, 15H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{21}H_{27}N_1O_3$
Berechnet (%): C 73,87; H 7,97; N 4,10; O 14,06
Gefunden (%): C 73,78; H 7,87; N 4,09; O 14,26

BEISPIEL 68

5-Butyl-3-ethoxy-4-hydroxy-1-ethyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 62)

[0155] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Ethyl-N-(ethoxyacetyl)amino]-6-butylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (62) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,78 (s, 1H), 7,75~7,15 (m, 3H), 4,23 (d, 2H, J = 7,3 Hz), 3,68 (d, 2H, J = 6,8 Hz), 2,34 (d, 2H, J = 7,1 Hz), 1,85~1,23 (m, 10H), 0,90 (t, 3H, J = 6,9 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{17}H_{23}N_1O_3$
Berechnet (%): C 70,56; H 8,01; N 4,84; O 16,59
Gefunden (%): C 70,45; H 7,99; N 4,89; O 16,67

BEISPIEL 69

8-Methyl-3-geranyloxy-4-hydroxy-1-benzyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 63)

[0156] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Benzyl-N-(geranyloxyacetyl)amino]-3-methylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (63) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,78 (s, 1H), 7,79~7,15 (m, 8H), 4,33 (s, H), 4,24 (d, 2H, J = 7,3 Hz), 2,34 (d, 2H, J = 7,1 Hz), 2,25 (s, 3H), 2,34~1,56 (m, 13H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{27}H_{31}N_1O_3$
Berechnet (%): C 77,66; H 7,48; N 3,35; O 11,50
Gefunden (%): C 77,65; H 7,39; N 3,32; O 11,64

BEISPIEL 70

7-Butyl-3-octyloxy-4-hydroxy-1-(2-propenyl)-2(1H)-chinolinon (Verbindung 64)

[0157] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-(2-Propenyl)-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-butylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (64) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,78 (s, 1H), 7,80~7,15 (m, 3H), 5,95 (m, 1H), 5,20~5,00 (m, 2H), 4,24 (d, 2H, J = 7,3 Hz), 3,89 (m, 2H), 2,25 (t, 2H, J = 7,2 Hz), 1,80~1,25 (m, 16H), 0,89 (m, 6H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1105
Elementaranalyse für: $C_{24}H_{35}N_1O_3$
Berechnet (%): C 74,76; H 9,15; N 3,63; O 12,45
Gefunden (%): C 74,75; H 9,09; N 3,52; O 12,64

BEISPIEL 71

7-Nitro-3-(2-pyridyloxy)-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 65)

[0158] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Methyl-N-(pyridyloxyacetyl)amino)-4-nitrobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (65) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,78 (s, 1H), 8,56 (m, 1H), 8,15~7,23 (m, 6H), 3,58 (s, 3H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1550, 1255
Elementaranalyse für: $C_{15}H_{11}N_3O_5$
Berechnet (%): C 57,51; H 3,54; N 13,42; O 25,54
Gefunden (%): C 57,65; H 3,49; N 13,35; O 25,51

BEISPIEL 72

7-Nitro-3-methoxy-4-hydroxy-1-(2-franyl)-2(1H)-chinolinon (Verbindung 66)

[0159] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-(2-Franyl)-N-(methoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (66) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,78 (s, 1H), 8,15~7,69 (m, 3H), 7,28 (m, 1H), 6,25 (m, 1H), 5,85 (m, 1H), 3,78 (s, 3H), 2,56 (s, 2H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2920, 1550, 1255
Elementaranalyse für: $C_{15}H_{12}N_2O_6$
Berechnet (%): C 56,96; H 3,82; N 8,86; O 30,35
Gefunden (%): C 56,85; H 3,89; N 8,89; O 30,37

BEISPIEL 73

5-Phenoxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 67)

[0160] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-6-phenoxy carbonylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (67) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,68 (s, 1H), 7,88~7,35 (m, 8H), 3,84 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,62 (s, 3H), 1,78~1,34 (m, 4H), 0,96 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2920, 1715, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{20}H_{21}N_1O_5$
Berechnet (%): C 67,59; H 5,69; N 3,94; O 22,51
Gefunden (%): C 67,45; H 5,99; N 3,97; O 22,59

BEISPIEL 74

5-Decyloxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 68)

[0161] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-6-decyloxycarbonylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (68) erhalten.
^{1}H NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,68 (s, 1H), 7,88~7,45 (m, 3H), 4,23 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,84 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,62 (s, 3H), 1,78~1,34 (m, 20H), 0,96 (m, 6H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1715, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{24}H_{37}N_1O_5$
Berechnet (%): C 68,70; H 8,89; N 3,34; O 19,07
Gefunden (%): C 68,64; H 8,79; N 3,23; O 19,34

BEISPIEL 75

5-Hexylamino-3-ethoxy-4-hydroxy-1-[(3,5-dimethylbenzyl)-2(1H)-chinolinon (Verbindung 69)

[0162] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-(3,5-Dimethylbenzyl)-N-(ethoxyacetyl)amino]-6-hexylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (69) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,78 (s, 1H), 7,79~7,20 (m, 6H), 5,65 (bs, 1H), 3,65 (d, 2H, J = 7,2 Hz), 3,33 (s, 2H), 8,89 (t, 2H, J = 6,9 Hz), 1,86~1,23 (m, 8H), 2,25 (s, 6H), 1,15 (t, 3H, J = 7,2 Hz), 0,90 (t, 3H, J = 6,9 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1715, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{26}H_{34}N_2O_3$
Berechnet (%): C 73,90; H 8,11; N 6,63; O 11,36
Gefunden (%): C 73,89; H 8,10; N 6,58; O 11,43

BEISPIEL 76

2-[N-Benzyl-N-(methoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester (Verbindung 70)

[0163] In Übereinstimmung mit Beispiel 1, 2-Benzylamino-4-nitrobenzoesäureethylester und Methoxyessigsäure wurden anstelle von 4-Nitrobenzoesäureethylester und Octyloxyessigsäure verwendet, wurde die Titelverbindung (70) erhalten.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
9,55 (s, 1H), 8,21 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,91 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,25 (m, 5H), 4,23 (t, 2H, J = 7,2 Hz), 4,13 (s, 2H), 3,78 (s, 3H), 3,33 (s, 2H), 1,15 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 2850, 1740, 1550, 1345, 1225
Elementaranalyse für: $C_{19}H_{20}N_2O_6$
Berechnet (%): C 61,28; H 5,41; N 7,52; O 25,78
Gefunden (%): C 61,24; H 5,35; N 7,45; O 25,96

BEISPIEL 77

2-[N-Methyl-N-(phenoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester (Verbindung 71)

[0164] In Übereinstimmung mit Beispiel 1, 2-Methylamino-4-nitrobenzoesäureethylester und Phenoxyessigsäure wurden anstelle von 4-Nitrobenzoesäureethylester und Octyloxyessigsäure verwendet, wurde die Titelverbindung (71) erhalten.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
9,55 (s, 1H), 8,18 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,91 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,35 (m, 5H), 4,23 (t, 2H, J = 7,2 Hz), 4,13 (s, 2H), 3,56 (s, 3H), 1,15 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 2850, 1740, 1550, 1345, 1225
Elementaranalyse für: $C_{18}H_{18}N_2O_6$
Berechnet (%): C 60,33; H 5,06; N 7,82; O 26,79
Gefunden (%): C 60,24; H 5,15; N 7,75; O 26,86

BEISPIEL 78

2-[N-Methyl-N-(benzyloxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester (Verbindung 72)

[0165] In Übereinstimmung mit Beispiel 1, 2-Methylamino-4-nitrobenzoesäureethylester und Benzyloxyessigsäure wurden anstelle von 4-Nitrobenzoesäureethylester und Octyloxyessigsäure verwendet, wurde die Titelverbindung (72) erhalten.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
9,55 (s, 1H), 8,18 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,91 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,35 (m, 5H), 5,25 (s, 2H), 4,23 (t, 2H, J = 7,2 Hz), 4,13 (s, 2H), 3,56 (s, 3H), 1,15 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 2850, 1740, 1550, 1345, 1225
Elementaranalyse für: $C_{19}H_{20}N_2O_6$
Berechnet (%): C 61,28; H 5,41; N 7,52; O 25,78
Gefunden (%): C 61,22; H 5,45; N 7,55; O 25,78

BEISPIEL 79

2-[N-(6-Hydroxyhexyl)-N-(butoxyacetyl)amino]-4-nitrobenzoesäureethylester (Verbindung 73)

[0166] In Übereinstimmung mit Beispiel 1, 2-(6-Hydroxyhexyl)amino-4-nitrobenzoesäureethylester und Butoxyessigsäure wurden anstelle von 4-Nitrobenzoesäureethylester und Octyloxyessigsäure verwendet, wurde die Titelverbindung (73) erhalten.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
9,55 (s, 1H), 8,18 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,91 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 5,25 (s, 2H), 4,23 (t, 2H, J = 7,2 Hz), 4,13 (s, 2H), 3,45 (m, 2H), 2,87 (m, 2H), 1,78~1,25 (m, 12H), 1,15 (t, 3H, J = 6,8 Hz), 0,88 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 2850, 1740, 1550, 1345, 1225
Elementaranalyse für: $C_{21}H_{32}N_2O_7$
Berechnet (%): C 59,42; H 7,60; N 6,60; O 26,39
Gefunden (%): C 59,28; H 7,45; N 6,65; O 26,62

BEISPIEL 80

6-Nitro-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 74)

[0167] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-6-nitrobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (74) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,05 (s, 1H), 8,09 (m, 3H), 3,64 (s, 3H), 3,68 (d, 2H, J = 6,8 Hz), 1,87~1,23 (m, 12H), 0,90 (t, 3H, J = 6,9 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3500, 2940, 1610, 1515, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{18}H_{24}N_2O_5$
Berechnet (%): C 62,05; H 6,94; N 8,04; O 22,96
Gefunden (%): C 62,02; H 7,04; N 8,00; O 22,64

BEISPIEL 81

8-Nitro-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 75)

[0168] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-3-nitrobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (75) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,05 (s, 1H), 8,05 (m, 3H), 3,66 (s, 3H), 3,64 (d, 2H, J = 6,8 Hz), 1,87~1,23 (m, 12H), 0,89 (t, 3H, J = 6,9 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3500, 2940, 1610, 1515, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{18}H_{24}N_2O_5$
Berechnet (%): C 62,05; H 6,94; N 8,04; O 22,96
Gefunden (%): C 62,00; H 7,03; N 8,05; O 22,98

BEISPIEL 82

7-Acetylamino-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 76)

[0169] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-acetylaminobenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (76) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,28 (s, 1H), 10,23 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,80 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,42 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 3,94 (t, 1H, J = 6,8 Hz), 3,52 (s, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,69 (m, 2H), 1,25 (m, 10H), 0,86 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1515, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{18}H_{26}N_2O_3$
Berechnet (%): C 67,90; H 8,23; N 8,80; O 15,07
Gefunden (%): C 67,95; H 8,21; N 8,81; O 15,03

BEISPIEL 83

5-[(3,5-Dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 77)

[0170] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-6-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (77) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,39 (s, 1H), 10,29 (s, 1H), 8,90 (s, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,85 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,52 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 7,49 (s, 1H), 6,93 (s, 2H), 6,75 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 3,92 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,82 (s, 6H), 3,54 (s, 3H), 1,68 (m, 2H), 1,25 (m, 10H), 0,87 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1600, 1515, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{29}H_{36}N_2O_7$
Berechnet (%): C 66,39; H 6,92; N 5,34; O 21,35
Gefunden (%): C 66,44; H 7,00; N 5,30; O 21,26

BEISPIEL 84

6-[(3,4-Dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 78)

[0171] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-5-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (78) erhalten.
^{1}H NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,31 (s, 1H), 10,23 (s, 1H), 8,90 (s, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,85 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,54 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 7,49 (s, 1H), 6,93 (s, 2H), 6,75 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 3,92 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,81 (s, 6H), 3,54 (s, 3H), 1,68 (m, 2H), 1,25 (m, 10H), 0,85 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2950, 1600, 1515, 1240, 1100
Elementaranalyse für: $C_{29}H_{36}N_2O_7$
Berechnet (%): C 66,39; H 6,92; N 5,34; O 21,35
Gefunden (%): C 66,32; H 6,98; N 5,41; O 21,29

BEISPIEL 85

8-[(3,5-Dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 79)

[0172] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-3-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (79) erhalten.

^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,35 (s, 1H), 10,23 (s, 1H), 8,90 (s, 1H), 7,94 (s, 1H), 7,85 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,54 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 7,50 (s, 1H), 6,93 (s, 2H), 6,74 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 3,92 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,81 (s, 6H), 3,54 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 1,68 (m, 2H), 1,25 (m, 10H), 0,87 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1550, 1515, 1240, 1100
Elementaranalyse für: $C_{29}H_{36}N_2O_7$
Berechnet (%): C 66,39; H 6,92; N 5,34; O 21,35
Gefunden (%): C 66,33; H 6,90; N 5,36; O 21,41

BEISPIEL 86

6-Ethoxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 80)

[0173] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-5-ethoxycarbonylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (80) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,68 (s, 1H), 7,88~7,55 (m, 3H), 4,22 (t, 2H, J = 6,9 Hz), 3,84 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,62 (s, 3H), 1,78~1,34 (m, 4H), 1,22 (t, 3H, J = 6,8 Hz), 0,96 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1715, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{17}H_{21}N_1O_5$
Berechnet (%): C 63,93; H 6,63; N 4,39; O 25,05
Gefunden (%): C 63,70; H 6,58; N 4,45; O 25,27

BEISPIEL 87

6-Phenoxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 81)

[0174] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-5-phenoxycarbonylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (81) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,68 (s, 1H), 7,88~7,35 (m, 8H), 3,84 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,62 (s, 3H), 1,78~1,34 (m, 4H), 0,96 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1715, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{20}H_{21}N_1O_5$
Berechnet (%): C 67,59; H 5,96; N 3,94; O 22,51
Gefunden (%): C 67,57; H 6,04; N 3,90; O 22,49

BEISPIEL 88

8-Ethoxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 82)

[0175] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-3-ethoxycarbonylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (82) erhalten. ^{1}H NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,62 (s, 1H), 7,88~7,55 (m, 3H), 4,20 (t, 2H, J = 6,9 Hz), 3,85 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,62 (s, 3H), 1,78~1,34 (m, 4H), 1,22 (t, 3H, J = 6,8 Hz), 0,95 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1715, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{17}H_{21}N_1O_5$
Berechnet (%): C 63,93; H 6,63; N 4,39; O 25,05
Gefunden (%): C 63,88; H 6,59; N 4,35; O 25,18

BEISPIEL 89

8-Phenoxycarbonyl-3-butoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 83)

[0176] In Übereinstimmung mit Beispiel 20, 2-[N-Methyl-N-(butoxyacetyl)amino]-3-phenoxycarbonylbenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinna-

moyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (83) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,58 (s, 1H), 7,88~7,35 (m, 8H), 3,82 (t, 2H, J = 6,8 Hz), 3,64 (s, 3H), 1,78~1,34 (m, 4H), 0,99 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1715, 1610, 1250, 1100
Elementaranalyse für: $C_{20}H_{21}N_1O_5$
Berechnet (%): C 67,59; H 5,96; N 3,94; O 22,51
Gefunden (%): C 67,48; H 5,95; N 3,99; O 22,58

BEISPIEL 90

5-Octyloxy-3-methoxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 84)

[0177] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Methyl-N-(methoxyacetyl)amino]-6-octyloxybenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (84) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,75~7,20 (m, 3H), 3,74 (s, 3H), 3,65 (s, 3H), 2,22 (d, 2H, J = 7,0 Hz), 1,78~1,23 (m, 12H), 0,89 (t, 3H, J = 7,0 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{19}H_{27}N_1O_4$
Berechnet (%): C 68,44; H 8,16; N 4,20; O 19,20
Gefunden (%): C 68,46; H 8,19; N 4,27; O 19,08

BEISPIEL 91

3,8-Dihexyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 85)

[0178] In Übereinstimmung mit Beispiel 21, 2-[N-Methyl-N-(hexyloxyacetyl)amino]-3-hexyloxybenzoesäureethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (85) erhalten.
^{1}H NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,85 (s, 1H), 7,75~7,20 (m, 3H), 3,65 (s, 3H), 2,22 (d, 2H, J = 7,0 Hz), 2,00 (d, 2H, J = 7,0 Hz), 1,78~1,23 (m, 16H), 0,89 (t, 3H, J = 7,0 Hz), 0,83 (t, 3H, J = 7,0 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1610, 1100
Elementaranalyse für: $C_{22}H_{33}N_1O_4$
Berechnet (%): C 70,37; H 8,86; N 3,73; O 17,04
Gefunden (%): C 70,39; H 8,92; N 3,71; O 16,98

BEISPIEL 92

8-Methylamino-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 86)

[0179] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-3-methylaminobenzoesäurethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (86) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
11,23 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,76 (d, 1H, J = 7,2 Hz), 7,50 (d, 1H, J = 7,2 Hz), 4,23 (d, 2H, J = 7,6 Hz), 3,54 (s, 3H), 3,34 (s, 3H), 1,86~1,45 (m, 12H), 0,97 (t, 3H, J = 7,5 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3550, 2940, 1550, 1515, 1240, 1100
Elementaranalyse für: $C_{19}H_{28}N_2O_3$
Berechnet (%): C 68,64; H 8,49; N 8,43; O 14,44
Gefunden (%): C 68,61; H 8,50; N 8,49; O 14,40

BEISPIEL 93

2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäuremethylester (Verbindung 87)

[0180] In Übereinstimmung mit Beispiel 4, 2-[(Octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäuremethylester wurde anstelle von 2-[(Octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung

(87) erhalten.
^{1}H NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
7,94 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 6,65 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 6,32 (d, 1H, J = 1,6 Hz), 4,40 (s, 2H), 4,27 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,40 (m, 2H), 3,18 (s, 3H), 1,80~1,20 (m, 12H), 0,87 (t, 3H, J = 6,8 Hz)
IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 2850, 1725
Elementaranalyse für: $C_{19}H_{30}N_3O_4$
Berechnet (%): C 65,11; H 8,63; N 7,99; O 18,26
Gefunden (%): C 65,08; H 8,59; N 8,02; O 18,31

BEISPIEL 94

2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäurebutylester (Verbindung 88)

[0181] In Übereinstimmung mit Beispiel 4, 2-[(Octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäurebutylester wurde anstelle von 2-[(Octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (88) erhalten.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$, δ-TMS)
7,94 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 6,65 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 6,32 (d, 1H, J = 1,6 Hz), 4,40 (s, 2H), 4,27 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,40 (m, 2H), 3,18 (s, 3H), 2,30~1,20 (m, 14H), 0,87 (m, 6H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 2850, 1725
Elementaranalyse für: $C_{22}H_{36}N_2O_4$
Berechnet (%): C 67,31; H 9,24; N 7,14; O 16,30
Gefunden (%): C 67,28; H 9,27; N 7,21; O 16,24

BEISPIEL 95

2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäuremethylester (Verbindung 89)

[0182] In Übereinstimmung mit Beispiel 5, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäuremethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-aminobenzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (89) erhalten.
^{1}H-NMR (d_6-DMSO, δ-TMS)
10,52 (s, 1H), 8,94 (s, 1H), 7,96 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,83 (d, 1H, J = 2,0 Hz), 7,76 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,57 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 6,93 (s, 2H), 6,68 (d, 1H, J = 15,6 Hz), 3,85 (s, 6H), 3,81 (s, 3H), 3,78 (s, 3H), 3,68 (m, 2H), 3,27 (m, 2H), 1,40~1,10 (m, 12H), 0,83 (m, 3H)
IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 1745, 1680, 1225
Elementaranalyse für: $C_{30}H_{40}N_2O_8$
Berechnet (%): C 64,73; H 7,24; N 5,03; O 23,00
Gefunden (%): C 64,77; H 7,20; N 4,95; O 23,07

BEISPIEL 96

7-[(3,5-Dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 18)

[0183] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäuremethylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (18) erhalten.

BEISPIEL 97

7-[(3,5-Dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]-3-octyloxy-4-hydroxy-1-methyl-2(1H)-chinolinon (Verbindung 18)

[0184] In Übereinstimmung mit Beispiel 19, 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäurebutylester wurde anstelle von 2-[N-Methyl-N-(octyloxyacetyl)amino]-4-[(3,5-dimethoxy-4-hydroxycinnamoyl)amino]benzoesäureethylester verwendet, wurde die Titelverbindung (18) erhalten.

REFERENZBEISPIEL 1

Cyclisierung von 2-[(Methoxyacetyl)amino]-7-nitrobenzoesäureethylester

[0185] Zu einem Gemisch von 0,58 g Natriumhydrid (Reinheit 60%, 14,49 mmol) in 9 ml Tetrahydrofuran wurde eine Lösung von 1,02 g 2-[(Methoxyacetyl)amino]-7-nitrobenzoesäureethylester (3,62 mmol) in 6 ml Tetrahydrofuran bei 0 bis 10°C gegeben. Das Gemisch wurde 5 Stunden bei 0 bis 10°C gerührt. Es wurde kein Ablaufen der Cyclisierung beobachtet.

TESTBEISPIEL 1

Test auf akute Toxizität bei Mäusen

[0186] Wir führten diesen Test durch um die niedrige Toxizität der Verbindungen der vorliegenden Erfindung, Chinolinonderivate, zu bestätigen. Im Folgenden wird das Verfahren des Tests auf akute Toxizität erläutert.
[0187] Verfahren: Jedes der Chinolinonderivate (Verbindungs-Nr. 18 bis 69, 74 bis 86) wurde in Dosierungen von 1000 und 2000 mg/kg an männliche ICR-Mäuse (Körpergewicht beträgt 20 bis 25 g, 5 Mäuse pro Gruppe) unter Verwendung einer Schlundsonde gewaltsam oral verabreicht. Nach der Verabreichung wurden die Tiere für 7 Tage in Käfigen gehalten um generelle Symptome zu beobachten und tote Tiere zu zählen. Die letale Dosis (LD_{50}: mg/kg) wurde aus der Sterblichkeit am 7. Tag nach der Verabreichung extrapoliert.
[0188] Als Ergebnis waren die LD_{50}-Werte aller Verbindungen oberhalb 1000 mg/kg und es wurde daher klar gezeigt, dass die Verbindungen der vorliegenden Erfindung, Chinolinonderivate, eine außerordentlich niedrige Toxizität besitzen.

TESTBEISPIEL 2

Wirkung auf homologe passive kutane Anaphylaxie-Reaktion (PCA) bei Ratten

[0189] Wir führten diesen pharmakologischen Test durch PCA-Reaktion durch, der ein gut bekannter Durchmusterungs-Test für antiallergische Mittel war um zu zeigen, dass die Verbindungen der vorliegenden Erfindung, Chinolinonderivate, antiallergische Aktivität besitzen. Dieses experimentelle Tiermodell wird durch allergische Reaktion vom Sofort-Typ verursacht, nämlich Antigen-Antikörper-Reaktion. Im Folgenden wird das Verfahren dieses pharmakologischen Tests erläutert.
[0190] Verfahren: Männlichen Wistar-Ratten (9 Wochen alt) wurden intradermal 0,05 ml Antiserum gegen dinitrophenylierte Askaris (DNP-As) an zwei Stellen der rasierten Rückenhaut verabreicht. 48 Stunden später wurden den Tieren in 0,05%iger Methylcellulose (MC) suspendierte Chinolinonderivate (Testverbindungen) in einer Dosierung von 100 mg/kg oral gegeben. 1 Stunde nach der Verabreichung der Testverbindungen wurde den Tieren Anaphylaxie durch Injektion von Salzlösung (1 ml), in der 1 mg trinitrophenylierter Askaris (TNP-As) und 5 mg Evans-Blau gelöst waren, in die Schwanzvene der Tiere induziert. 30 Minuten nach der Induktion der Anaphylaxie wurden die Tiere durch Ether anästhesiert, durch Verblutenlassen getötet und ihnen wurde die Rückenhaut abgezogen. Das Lecken von Farbstoffwurde durch Messen des Durchmessers (Mittel aus kürzestem und längstem Durchmesser) des blauen Punktes auf der Innenseite der Rückenhaut beurteilt. Als Kontrollgruppe für den Träger wurde nur eine 0,5%ige MC-Lösung oral verabreicht und als positive Kontrollgruppe wurde in 0,5%iger MC-Lösung suspendiertes Tranilast oral in einer Dosierung von 200 mg/kg mit demselben Verfahren wie den Gruppen der Testverbindungen an die Tiere verabreicht. Die Inhibierung (%) der PCA-Reaktion wurde nach Gleichung 1 berechnet und das Ergebnis ist in Tabelle 1 gezeigt. Jede experimentelle Gruppe bestand auf 5 Ratten. In den Bedingungen dieses Experimentes wurde angenommen, dass die Verbindung, die die PCA-Reaktion bei über vierzig (40) Prozent gegenüber der in der Kontrollgruppe des Trägers inhibierte, offensichtlich für Allergien vom Sofort-Typ wirksam war.

(Gleichung 1)

[0191]

$$\text{Inhibierung (\%)} = (A - B)/A \times 100$$

[0192] In Gleichung 1:
A: Lecken von Farbstoff in der Kontrollgruppe des Trägers
B: Lecken von Farbstoff in der Gruppe der Testverbindung oder der positiven Kontrollgruppe

Tabelle 1

Verbindungs-Nr.	Inhibierung (%)	Verbindungs-Nr.	Inhibierung (%)
23	40	61	42
24	42	68	49
26	39	76	51
34	37	77	55
36	45	78	50
38	45	79	49
44	42	80	41
45	46	83	42
49	50	84	49
52	49	85	50
53	45	86	53
54	50	Tranilast	52

[0193]

FORMULIERUNGSBEISPIEL 1

(5%ige Pulver)

die Verbindungen der vorliegenden Erfindung	50 mg
Lactose	950 mg
	1000 mg

[0194] Im Folgenden wird das Verfahren für Pulver der Verbindungen 22, 24 und 45 gezeigt. Kristalle der Verbindung der vorliegenden Erfindung wurden in einem Mörser pulverisiert und mit Lactose innig vermischt. Zweitens wurde das Gemisch mit einem Pistill pulverisiert und 5%ige Pulver der Verbindung 22, 24 und 45 wurden erhalten.
[0195]

FORMULIERUNGSBEISPIEL 2

(10%ige Pulver)

die Verbindung der vorliegenden Erfindung	100 mg
Lactose	900 mg
	1000 mg

[0196] Im Folgenden werden Verfahren für Pulver der Verbindung 34, 52, 53 und 61 gezeigt. Das Verfahren des Formulierungsbeispiels 1 wurde unter Erhalt von 10%igen Pulvern der Verbindung 34, 52, 53 und 61 wiederholt.
[0197]

FORMULIERUNGSBEISPIEL 3

(10%ige Körnchen)

die Verbindung der vorliegenden Erfindung	300 mg
Lactose	2000 mg
Stärke	670 mg
Gelatine	30 mg
	3000 mg

[0198] Im Folgenden wird das Verfahren für Körnchen der Verbindung 38, 44, 49 und 68 gezeigt. Die Verbindung der vorliegenden Erfindung wird mit der äquivalenten Menge Stärke vermischt und in einem Mörser pul-

verisiert. Dieses wird weiter mit Lactose und dem verbliebenen Anteil Stärke vermischt. Davon getrennt, werden 30 mg Gelatine mit 1 ml gereinigtem Wasser vermischt, durch Erhitzen aufgelöst, abgekühlt und dann unter Rühren mit 1 ml Ethanol vermischt um eine Gelatinelösung herzustellen. Danach wird das oben hergestellte Gemisch mit der Gelatinelösung vermischt und das resultierende Gemisch wird geknetet, gekörnt, und dann unter Erhalt von Körnchen der Verbindung 38, 44, 49 und 68 getrocknet.
[0199]

FORMULIERUNGSBEISPIEL 4

(5-mg-Tabletten)	
die Verbindung der vorliegenden Erfindung	5 mg
Lactose	62 mg
Stärke	30 mg
Talk	2 mg
Magnesiumstearat	1 mg
	100 mg/Tablette

[0200] Im Folgenden wird ein Verfahren zur Herstellung von Tabletten der Verbindungen 76 bis 80 gezeigt. Ein 20mal größerer Anteil der obigen Zusammensetzung wurde verwendet um Tabletten herzustellen, von denen jede 5 mg des aktiven Ingrediens enthielt. D. h. 100 mg der Verbindung der vorliegenden Erfindung in einer Kristallform wurde in einem Mörser pulverisiert und mit Lactose und Stärke vermischt. Die auf diese Weise hergestellte Formulierung wurde mit 10%iger Stärkepaste vermischt, das Gemisch wurde geknetet und dann einer Granulation unterworfen. Nach dem Trocknen wurden die resultierenden Körnchen mit Talk und Magnesiumstearat vermischt und auf gewöhnlichem Weg einer Tablettenherstellung unterworfen. Mit dem obigen Verfahren wurden Tabletten der Verbindungen 76 bis 80 hergestellt.
[0201]

FORMULIERUNGSBEISPIEL 5

(20-mg-Tabletten)	
die Verbindung der vorliegenden Erfindung	20 mg
6% Hydroxypropylcellulose/Lactose	75 mg
Stearat/Talk	2 mg
Kartoffelstärke	3 mg
	100 mg/Tablette

[0202] Im Folgenden wird das Verfahren für Tabletten der Verbindungen 76 bis 80 gezeigt. Ein 10mal größerer Anteil der obigen Zusammensetzung wurde verwendet um Tabletten herzustellen, von denen jede 20 mg des aktiven Ingrediens enthielt. D. h. 6 g Hydroxypropylcellulose wurden in einem angemessenen Volumen Ethanol aufgelöst und mit 94 g Lactose vermischt und nachfolgend geknetet. Nach Trocknen auf ein Maß wird das Gemisch durch ein Netz Nr. 60 geführt und die auf diese Weise eingeteilten Körnchen wurden als 6% Hydroxypropylcellulose/Lactose verwendet. Davon getrennt wurden Magnesiumstearat und Talk in einem Verhältnis von 1 : 4 vermischt und als Stearat/Talk verwendet. Danach wurden die Verbindung der vorliegenden Erfindung, 6% Hydroxypropylcellulose/Lactose, Stearat/Talk und Kartoffelstärke innig miteinander vermischt und auf gewöhnlichem Weg der Tablettenherstellung unterworfen. Mit dem obigen Verfahren wurden Tabletten der Verbindungen 76 bis 80 hergestellt.
[0203]

FORMULIERUNGSBEISPIEL 6

(25-mg-Tabletten)	
die Verbindung der vorliegenden Erfindung	25 mg
Lactose	122 mg
Carboxymethylstärke	50 mg
Talk	2 mg
Magnesiumstearat	1 mg
	200 mg/Tablette

[0204] Im Folgenden wird das Verfahren für Tabletten der Verbindungen 44, 54, 76 bis 80, 85 und 86 gezeigt. Ein 10mal größerer Anteil der obigen Zusammensetzung wurde verwendet um Tabletten herzustellen, von denen jede 25 mg des aktiven Ingrediens enthielt. D. h. 250 mg der Verbindung der vorliegenden Erfindung in

einer Kristallform wurden in einem Mörser pulverisiert und innig mit Lactose vermischt. Ein angemessenes Volumen gereinigtes Wasser wurde zur Carboxymethylstärke gegeben, das anschließend zu dem obigen Gemisch gegeben wurde, und das resultierende Gemisch wurde geknetet und dann einer Granulation unterworfen. Nach dem Trocknen wurden die auf diese Weise hergestellten Körnchen mit Talk und Magnesiumstearat vermischt und auf gewöhnlichem Weg der Tablettenherstellung unterworfen. Mit dem obigen Verfahren wurden Tabletten der Verbindungen 44, 54, 76 bis 80, 85 und 86 hergestellt.
[0205]

FORMULIERUNGSBEISPIEL 7

(10-mg-Kapseln)

die Verbindung der vorliegenden Erfindung	300 mg
Lactose	2000 mg
Stärke	670 mg
Gelatine	30 mg
	3000 mg

[0206] Im Folgenden wird das Verfahren für Tabletten der Verbindungen 44, 54, 76 bis 80, 85 und 86 gezeigt. Körnchen wurden in Übereinstimmung mit dem in Formulierungsbeispiel 3 beschriebenen Verfahren hergestellt und in 100 mg-Anteilen in Kapseln gepackt. Mit dem obigen Verfahren wurden Kapseln der Verbindungen 44, 54, 76 bis 80, 85 und 86 hergestellt.
[0207]

FORMULIERUNGSEISPIEL 8

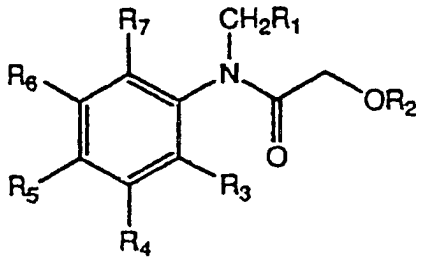
(0,5%-Salbe)

die Verbindung der vorliegenden Erfindung	5 mg
flüssiges Paraffin	80 mg
weißes Petrolatum	915 mg
	1000 mg

[0208] Im Folgenden wird das für Verfahren für Tabletten der Verbindungen 44, 54, 76 bis 80, 85 und 86 gezeigt. Ein 10mal größerer Anteil der obigen Zusammensetzung wurde verwendet um Salben herzustellen, von denen jede 5% des aktiven Ingrediens enthielt. D. h. die Verbindung der vorliegenden Erfindung und ein wenig flüssiges Paraffin wurden hinlänglich vermischt, in einem Mörser pulverisiert und als dispergierende Lösung verwendet. Davon getrennt wurde weißes Petrolatum mit flüssigem Paraffin durch Erhitzen vermischt um Grundstoffe herzustellen. Die obige dispergierende Lösung wurde in Maßen zu den Grundlagen gegeben und zur Homogenisierung gründlich geknetet. Mit dem obigen Verfahren wurden Salben von 44, 54, 76 bis 80, 85 und 86 hergestellt.
[0209] Somit ist es offensichtlich, dass in Übereinstimmung mit der vorliegenden Erfindung ein industrielles Herstellungsverfahren eines Chinolinonderivats und eines neuartigen Amidderivats als eine Zwischenstufe bei der Verwendung dieses Verfahrens bereitgestellt worden sind. Ebenfalls sind das bereitgestellte Chinolinonderivat und sein physiologisch annehmbares Salz ausgezeichnete antiallergische Mittel, die eine niedrige Toxizität besitzen und zur Behandlung oder Vorbeugung allergischer Erkrankungen vom Sofort-Typ und vom verzögerten Typ nützlich sind, im besonderen Maße ein ausgezeichnetes antiallergisches Mittel, das hochgradig wirksam bei Allergie vom verzögerten Typ ist, die nicht wirksam mit antiallergischen Mitteln gemäß dem Stand der Technik behandelt werden kann.

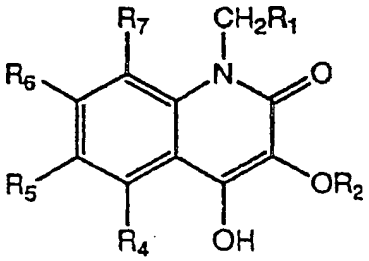
Patentansprüche

1. Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats, das durch die folgende allgemeine Formel (II) dargestellt wird, **dadurch gekennzeichnet**, dass ein Amidderivat, das durch die folgende allgemeine Formel (I) dargestellt wird, mit einer Base umgesetzt wird, gefolgt von intramolekularer Ringbildung



(I)

[worin R_1 ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe, eine Alkenylgruppe oder eine Arylgruppe, darstellt; R_2 eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Arylgruppe oder eine Aralkylgruppe darstellt; R_3 eine reaktive Carboxylgruppe darstellt; und R_4 bis R_7 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Hydroxylgruppe, eine Alkylgruppe, eine Alkoxgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Alkenyloxygruppe, eine Arylgruppe, eine Aryloxygruppe, eine Aralkyloxygruppe, eine R_8R_9N-Gruppe (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Aralkylgruppe oder eine Acylgruppe darstellen), eine Nitrogruppe oder eine $R_{10}OOC$-Gruppe (worin R_{10} ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Arylgruppe oder eine Aralkylgruppe darstellt) darstellen]



(II)

[worin R_1, R_2 und R_4 bis R_7 jeweils dieselben Bestandteile wie in der allgemeinen Formel (I) beschrieben darstellen].

2. Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats nach Anspruch 1, worin R_1 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einem Wasserstoffatom, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe und besitzend 1 bis 5 Kohlenstoffatome, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkenylgruppe mit 2 bis 9 Kohlenstoffatomen und einer Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen; R_2 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen; R_4, R_5 und R_7 jeweils ein Wasserstoffatom darstellen und R_6 eine R_8R_8N-Gruppe darstellt (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Acylgruppe mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen darstellen).

3. Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats nach Anspruch 1, worin R_1 ein Wasserstoffatom darstellt, R_2 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen; R_4, R_5 und R_7 jeweils ein Wasserstoffatom darstellen; und R_6 eine R_8R_9N-Gruppe darstellt (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Acylgruppe mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen darstellen).

4. Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats nach Anspruch 1, worin R_1 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einem Wasserstoffatom, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe und besitzend 1 bis 5 Kohlenstoffatome, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkenylgruppe mit

2 bis 9 Kohlenstoffatomen und einer Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen; R_2 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer ARylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen; R_4, R_5 und R_7 jeweils ein Wasserstoffatom darstellen; und R_6 eine Nitrogruppe darstellt.

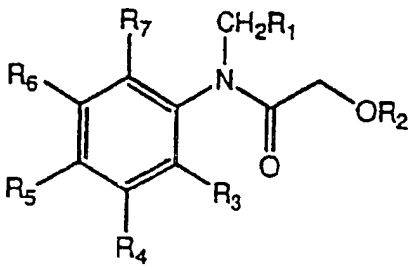
5. Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats nach Anspruch 1, worin R_1 ein Wasserstoffatom darstellt, R_2 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen; R_4, R_5 und R_7 jeweils ein Wasserstoffatom darstellen; und R_6 eine Nitrogruppe darstellt.

6. Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats nach Anspruch 1, worin R_1 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einem Wasserstoffatom, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe und besitzend 1 bis 5 Kohlenstoffatome, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkenylgruppe mit 2 bis 9 Kohlenstoffatomen und einer Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen; R_2 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen; R_4, R_5 und R_7 jeweils ein Wasserstoffatom darstellen; und R_6 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einer Hydroxylgruppe, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkyloxygruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkenyloxygruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Aralkyloxygruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen.

7. Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats nach einem der Ansprüche 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, dass die Base ein Alkalimetallalkoxid ist.

8. Verfahren zur Herstellung eines Chinolinonderivats nach einem der Ansprüche 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, dass die Base ein Alkalimetallamid ist.

9. Amidderivat, das durch die folgende allgemein Formel (I) dargestellt ist



(I)

[worin R_1 ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxylgruppe, eine Alkenylgruppe oder eine Arylgruppe, darstellt; R_2 eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Arylgruppe oder eine Aralkylgruppe darstellt; R_3 eine reaktive Carboxylgruppe darstellt; R_4, R_5 und R_7 jeweils ein Wasserstoffatom darstellen; und R_6 entweder eine R_8R_9N-Gruppe (worin R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Alkylgruppe, eine Alkenylgruppe, eine Aralkylgruppe oder Acylgruppe darstellen) oder eine Nitrogruppe darstellt].

10. Amidderivat nach Anspruch 9, worin R_1 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einem Wasserstoffatom, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe, enthaltend eine Hydroxyl-gruppe und besitzend 1 bis 5 Kohlenstoffatome, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkenylgruppe mit 2 bis 9 Kohlenstoffatomen und eine Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen; R_2 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen; und R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander eine Hydroxylgruppe, eine Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Acylgruppe mit 2 bis 12 Kohlenstoffato-

men darstellen.

11. Amidderivat nach Anspruch 10, worin R_1 ein Wasserstoffatom darstellt; R_2 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen; und R_8 und R_9 jeweils und unabhängig voneinander eine Hydroxylgruppe, eine Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, eine Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen oder eine Acylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen darstellen.

12. Amidderivat nach Anspruch 10, worin R_1 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einem Wasserstoffatom und einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe mit 1 bis 9 Kohlenstoffatomen; und R_2 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer geradkettigen oder verzweigtkettigen Alkenylgruppe mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen, einer Arylgruppe mit 5 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Aralkylgruppe mit 7 bis 9 Kohlenstoffatomen.

Es folgt kein Blatt Zeichnungen