

77.109/SZE

K I V O N A T

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

Antibakteriális hatású heterociklusos vegyületek, eljárás előállításukra és a heterociklusos vegyületeket tartalmazó gyógyszerkészítmények

A találmány tárgya az (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése halogénatom, azido-, tioalkohol-, izotiocianát, OR^4 , NHR^4 vagy $N(R^4)_2$ általános képletű csoport, ahol R^4 jelentése hidrogénatom vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: acil-, tioacil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, 3-6 szénatomos cikloalkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-karbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-karbonil-, aril-oxi-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-tiokarbonil-, aril-oxi-tiokarbonil-csoport, $-C(=O)C(=O)-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil}$, $-C(=O)-C(=O)-\text{aril}$, $-C(=O)-C(=O)-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkoxi}$, $-C(=O)-C(=O)-\text{aril-oxi}$, $-(C=S)-S-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil}$, $-(C=S)-NH_2$, $-(C=)-NH-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil}$, $-C(=S)-N-((1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil})_2$, $-C(=S)-NH-(2-6 \text{ szénatomos})\text{alkenil}$, $-(C=S)-(C=O)-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkoxi}$, $-(C=S)-(C=O)-\text{aril-oxi}$, $-C(=S)-O-(C=O)-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil}$, $C(=S)-C(=S)-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil}$, $-C(=S)-C(=S)-\text{aril}$ általános képletű csoport, tiomorfolinil-tiokarbonil- vagy pirrolidinil-tiokarbonil-csoport;

R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6

szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;

Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport;

Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, $=O$, $=S$ képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sója, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátja.

A fentiekben felsorolt vegyületek előállítására és ezeket tartalmazó gyógyászati készítményekre is.

TK

Jelölés: (1) áll. jelölés

P 0 3 0 2 5 8 0

S. B. G. & K.
Szabadalmi Ügyvédek
H-1062 Budapest, Andrássy út 113.
Telefon: 461-1000, Fax: 461-1099



77.109/SZE

Az

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

Antibakteriális hatású heterociklusos vegyületek, eljárás előállításukra és a heterociklusos vegyületeket tartalmazó gyógyszerkészítmények

A jelen találmány új oxazolidinon vegyületekkel, származékaikkal, analógjaikkal, tautomer alakjaikkal, sztereoizomerjeikkel, polimorfjaikkal, gyógyászati szempontból alkalmazható sóikkal, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjaikkal és az említetteket tartalmazó gyógyszerkészítményekkel foglalkozik. Közelebbről, a jelen találmány az (I) általános képletű új oxazolidinonokkal, származékaikkal, analógjaikkal, tautomer alakjaikkal, sztereoizomerjeikkel, polimorfjaikkal, gyógyászati szempontból alkalmazható sóikkal, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjaikkal és az említetteket tartalmazó gyógyszerkészítményekkel foglalkozik.

A jelen találmány eljárást is nyújt a fent említett új vegyületek, származékaik, analógjaik, tautomer alakjaik, sztereoizomerjeik, polimorfjaik, gyógyászati szempontból alkalmazható sóik, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjaik és az említetteket tartalmazó gyógyszerkészítmények előállítására is.

A jelen találmány foglalkozik az új köztestermékekkel, előállítási módjaikkal és az (I) általános képletű vegyületek előállításánál történő felhasználásukkal is.



Az oxazolidinonok baktériumellenes szerekként [J. Med. Chem., 39:673 (1996)], hisztaminellenes szerekként és allergiaellenes ágensekként [EP 291244], görcsoldókként [DE 3 915 184], kognitív rendellenességek kezelésére szolgáló hatóanyagokként, kedélybetegségek elleni szerekként, vérlemezke kicsapódásellenes szerekként, antidepresszánsként, nyugtatókként, altatókként, monoamin-oxidáz-gátlókként [WO 87/13768] és az aszimmetriás szintézisek királis segédanyagjaiként alkalmazhatók [Aldrichimica Acta, 15 23 (1982)].

A penicillin felfedezése óta a gyógyszergyárak több mint száz antibakteriális ágenszt dolgoztak ki a bakteriális fertőzések széleskörű leküzdésére. Az elmúlt néhány évben az antibiotikumok túlzott felhasználásának következtében számos baktériumnál kialakult az említett antibiotikumokkal szembeni rezisztencia. Az említett bakteriális kórokozók több hatóanyaggal szembeni rezisztenciája a mutációnak köszönhetően ugyancsak oda vezetett, hogy életképesebb klinikai kórokozók jelentek meg, és a legzavaróbb mérföldkövet jelentette a vankomicinnel szembeni rezisztencia, minthogy ezt az antibiotikumot úgy tekintették, mint a gram-pozitív fertőzésekkel szembeni utolsó általános hatóanyagot. A több hatóanyaggal szembeni növekvő rezisztencia újra ráirányította a figyelmet olyan új szerkezetű antibiotikumok kutatására, melyek új mechanizmusok révén képesek gátolni ezeknek a baktériumoknak a növekedését vagy képesek elpusztítani őket.

A legnagyobb mértékű problémát a klinikai izolátumok között az igen virulens, meticillin-rezisztens *Staphylococcus aureus* (MRSA) világszerte növekvő megjelenése okozza. A vankomicin-rezisztens mikroorganizmusokkal együtt sok MRSA törzs ellenálló az ismert antibiotikumokkal szemben, de az MRSA törzsek megőrizték a vankomicinnel szembeni szenzitivitásukat. Tekintettel azonban a vankomicin-rezisztens klinikai izolátumok növekvő számára és a baktériumok fokozódó rezisztenciájára,



igény van olyan új vegyületekre, melyek hatékonyak a növekvő számú és napjainkban problematikussá váló gram-pozitív mikroorganizmusokkal szembeni fellépésnél.

Napjainkban több oxazolidinont felfedeztek, melyek az 50S riboszomális alegységhez kötődve gátolják a fehérjeszintézist. Ezeknek az oxazolidinonoknak a kötődési helyei közel vannak a kloramfenikol és a linkomicin kötődési helyéhez, de a hatásmechanizmusuk eltér ettől a két antibiotikumtól.

A jelen találmány szerinti oxazolidinonok új osztálya alkalmas számos rezisztens és szenzitív gram-pozitív törzs elleni in vitro és in vivo kezelésre. A szakirodalomban eddig leírt néhány ismert vegyületet az alábbiakban sorolunk fel.

(i) A WO 93/23384 számú nemzetközi szabadalmi bejelentés foglalkozik a (IIa) általános képletű vegyületekkel, ahol az általános képletben

Y jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, aril-, OH, O-(1-6 szénatomos)-alkil-, O-vinil, O-fenil, O-C(=O)(1-6 szénatomos)alkil, -O-C(=O)fenil (a fenilcsoport 1-3 fluor-, klóratommal, OCH₃, OH, NH₂ képletű vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal lehet helyettesített), O-C(=O)-O-CH₃, S-(1-6 szénatomos)alkil, SO₂-(1-6 szénatomos)alkil, -SO₂-N(R³)₂ (ahol R³ jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport vagy fenilcsoport, mely 1-3 fluor-, klóratommal, OCH₃, OH, NH₂ képletű vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal lehet helyettesített), -C(=O)-(1-6 szénatomos)alkil, -C(=O)-O-(1-6 szénatomos)-alkil, -C(=O)-N(R³)₂, -C(=O)-CH(R⁴)N(R³)₂, -C(=O)-CH(R⁴)-NH-C(NH)-NH₂ (ahol R⁴ jelentése aminosav oldallánc), N(R³)₂, -N(CH₂)_m (ahol m jelentése 2-6 és a nitrogénatommal gyűrűs szerkezetet képez, ahol egy vagy több szénatom helyett kén-, oxigénatom vagy NR³ általános képletű csoport állhat), -C(CH₃)=N-OR képletű, illetve általános képletű csoport, vagy Y további jelentése (a) - (g) általános képletű csoport, melyen belül R⁵ jelentése OH, OCH₃, CH₂OH, CH₂OCH₃, CO₂CH₃, CO₂C₂H₅ képletű csoport; R⁶ jelentése CH₃ képletű csoport vagy

hidrogénatom; R^7 jelentése CH_2 vagy $C(=O)$ képletű csoport; R^8 jelentése hidrogénatom vagy $=O$ képletű csoport; p jelentése 1-2, R^9 jelentése oxigén-, kénatom, $S(O)$, SO_2 , CH_2 , NH , NCH_3 , NC_2H_5 , $NCHO$, $NCOCH_3$ vagy NCO_2CH_3 képletű csoport; és valamennyi előforduló nevezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport egy vagy több fluor-, klór-, bróm-, jódatommal, OR^1 , $COOR^1$, CN , SR^1 vagy R^1 (ahol R^1 jelentése hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport) képletű, illetve általános képletű csoporttal lehet helyettesített;

X és Z jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkil-, 3-12 szénatomos cikloalkilcsoport vagy hidrogénatom; vagy X és Y egy 0-3 szénatomos áthidaló csoportot képez; X és Z jelentése előnyösen hidrogénatom;

U , V és W jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, fluor-, klór-, bróm-, hidrogénatom vagy helyettesített, 1-6 szénatomos alkilcsoport, ahol a szubsztituens egy vagy több fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom; U és V jelentése előnyösen fluoratom, W jelentése előnyösen hidrogénatom;

R jelentése hidrogénatom, 1-12 szénatomos alkil-, 3-12 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos alkilcsoport, egy vagy több fluor-, klór- vagy jódatommal, hidroxilcsoporttal helyettesítve; n jelentése 1 vagy 2; q jelentése 0-4.

Ennek a csoportnak egyik képviselője a (IIb) képletű vegyület.

(ii) A WO 98/01447 számú nemzetközi szabadalmi bejelentés foglalkozik a (IIc) általános képletű vegyületekkel, ahol

R^1 jelentése $-NHC(=O)R^a$ általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport; R^2 és R^3 jelentése hidrogén- vagy fluoratom; R^4 és R^5 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy metilcsoport; R^6 jelentése piridilcsoport, adott esetben 1-4 szénatomos alkilcsoporttal (mely adott esetben helyettesített), halogénatommal, trifluor-metil-, 1-4 szénatomos alkil- $S(O)_n$ (ahol n jelentése 0, 1 vagy 2),



1-4 szénatomos alkil-, SO_2 -amino, 1-4 szénatomos alkanoil-amino-, karboxil-, hidroxil-, amino-, 1-4 szénatomos alkil-amino-, di(1-4 szénatomos)alkil-amino-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, karbamoil-, N-(1-4 szénatomos)alkil-karbamoil-, di(N-(1-4 szénatomos)alkil)-karbamoil- (melyen belül az 1-4 szénatomos alkilcsoport az utóbb említett két karbamoilcsoportnál adott esetben hidroxil-, 1-4 szénatomos alkoxi- vagy 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoporttal helyettesített), 2-4 szénatomos alkenil- (adott esetben karboxil- vagy 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoporttal helyettesítve), 1-4 szénatomos alkoxi-, ciano- vagy nitrocsoporttal helyettesítve.

Ennek a csoportnak egyik képviselője a (IIId) képletű vegyület.

(iii) A WO 95/07271 számú nemzetközi szabadalmi bejelentés foglalkozik a (IIc) általános képletű vegyületekkel, ahol X jelentése oxigén-, kénatom, SO, SO_2 , SNR^{10} vagy SONR^{10} képletű, illetve általános képletű csoport; R jelentése hidrogénatom, 1-8 szénatomos alkilcsoport, mely egy vagy több fluor-, klóratommal, hidroxil-, 1-8 szénatomos alkoxi-, 1-8 szénatomos acil-oxi- vagy $-\text{OCH}_2\text{Ph}$ képletű csoporttal helyettesített, vagy R jelentése 3-6 szénatomos cikloalkil-, amino-, 1-8 szénatomos alkil-amino-, 1-8 szénatomos dialkil-amino- vagy 1-8 szénatomos alkoxics csoport; R^1 jelentése hidrogénatom, kivéve ha X jelentése oxigénatom, R^1 további jelentése CH_3 , CO_2H képletű, ciano-, $-\text{CO}_2\text{R}$, $(\text{CH}_2)_m\text{R}^{11}$ általános képletű (melyen belül m jelentése 1 vagy 2) csoport; R^2 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor- vagy klóratom; R^3 jelentése hidrogénatom vagy CH_3 képletű csoport; R^{10} jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkil- (adott esetben klór-, fluoratommal, hidroxil-, 1-8 szénatomos alkoxi-, amino-, 1-8 szénatomos alkil-amino- vagy 1-8 szénatomos dialkil-amino-csoporttal helyettesítve) vagy p-toluolszulfonil-csoport; R^{11} jelentése hidrogénatom, hidroxil-, OR, OCOR, NH_2 , NHCOR vagy $\text{N}(\text{R}^{10})_2$ képletű, illetve általános képletű csoport; és n jelentése 0, 1 vagy 2.

Ennek a csoportnak egyik képviselője a (II_f) képletű vegyület.

(iv) A WO 95/25106 számú nemzetközi szabadalmi bejelentés foglalkozik a (II_g) általános képletű vegyületekkel, ahol R jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkil-, amino-, 1-8 szénatomos alkil-amino-, 1-8 szénatomos dialkil-amino-, 1-8 szénatomos alkoxi- vagy halogénezett, 1-8 szénatomos alkilcsoport; R¹ és R² jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-8 szénatomos alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkil-, $-(CH_2)_m-OR^{11}$ vagy $-C(=O)-R^{41}$ általános képletű csoport; X és Y jelentése egymástól függetlenül hidrogén- vagy halogénatom; R⁴ és R⁵ jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-8 szénatomos alkil-, 1-8 szénatomos alkoxi-, 1-8 szénatomos alkil-tio-, $-(CH_2)_m-OR^{51}$, $-O-(CH_2)_m-OR^{51}$, $-NR^{42}R^{52}$, $-N=CH-NR^{44}R^{55}$, $-C(=O)-NR^{42}R^{52}$ vagy $-(CH_2)_m-C(=A)-R^{41}$ általános képletű csoport vagy R⁴ és R⁵ együtt képeznek $=O$, $=NR^{43}$, $=S$, $=CR^{44}R^{54}$ képletű, illetve általános képletű csoportot vagy adott esetben helyettesített, telítetlen vagy telített, 5- vagy 6 tagú, 1-3 heteroatomot, mely lehet oxigén-, kén- vagy nitrogénatom, tartalmazó heterociklusos csoportot képeznek;

R¹¹ és R¹² jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-8 szénatomos alkil- vagy metoxi-metil-csoport; R⁴¹ jelentése hidrogénatom, $-(CH_2)_m-OH$, 1-8 szénatomos alkil-, 1-8 szénatomos alkoxi-, $-O-CH_2-O-C(=O)-R^{11}$ vagy $-(CH_2)_m-C(=O)-OR^{11}$ általános képletű csoport; R⁴² és R⁵² jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, $-(CH_2)_m-OR^{11}$, $-C(=O)R^{41}$, $-C(=O)-NR^{11}R^{12}$, $-(CH_2)_p$ -fenil általános képletű, 1-8 szénatomos alkil-, tiazol-2-il-csoport vagy az R⁴² és R⁵² együtt képezhet egy pirrolidino-, piperidino-, piperazino-, morfolino- vagy tiomorfolino-csoportot, melyek mindegyike helyettesítve lehet 1-8 szénatomos alkil- vagy $-(CH_2)_m-OH$ általános képletű csoporttal; R⁴³ jelentése hidrogénatom, 1-8 szénatomos alkil-, 1-8 szénatomos alkoxi-, $-OR^{51}$,

-(CH₂)_p-fenil, NR⁴²R⁵², -NH-C(=NH)-NH₂ általános képletű, [1,2,4]triazol-4-il- vagy cianocsoport;

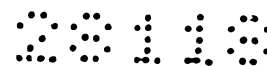
R⁴⁴ és R⁵⁴ jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-8 szénatomos alkil-, -C(=O)-R⁴¹ vagy -(CH₂)_p-fenil általános képletű csoport; R⁵¹ jelentése hidrogénatom, 1-8 szénatomos alkilcsoport egy vagy több hidroxilcsoporttal helyettesítve, 2-8 szénatomos alkenil-, halogénezett, 1-8 szénatomos alkil-, -(CH₂)_m-OR¹¹, -(CH₂)_m-C(=O)-R⁴¹, -C(=O)-(CH₂)_m-OR⁴ általános képletű csoport vagy tozilcsoport; A jelentése oxigénatom vagy etilén-ketál-csoport; --- jelentése kettős vagy egyes kötés; m' jelentése egymástól függetlenül 0, 1 vagy 2; n jelentése 0 vagy 1; p' jelentése egymástól függetlenül 1, 2, 3 vagy 4.

Ennek a csoportnak egyik képviselője a (IIh) képletű vegyület.

(v) A WO 96/13502 számú nemzetközi szabadalmi bejelentés foglalkozik a (IIi) általános képletű vegyületekkel, ahol Q jelentése (h) - (l) általános képletű csoport; R¹ jelentése hidrogén-, fluoratom, OR⁷, SR⁷, NR⁸R⁹, CN képletű, illetve általános képletű csoport, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxamid-, 1-4 szénatomos acilcsoport, adott esetben egy vagy több alábbi szubsztituenssel helyettesítve: fluoratom, hidroxil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos acil-oxi-, NHCO-(1-6 szénatomos)alkil- vagy NHOCH₂Ph, NSO₂R képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, adott esetben egy vagy több fluor-, klóratommal, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal vagy fenilcsoporttal helyettesítve;

R² jelentése egymástól függetlenül hidrogén- vagy fluoratom, hidroxil- vagy OR általános képletű csoport, melyen belül R jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, továbbá R² jelentése 1-4 szénatomos alkil- vagy fenilcsoport; R³ jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, fenil-, piridil- vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport, adott esetben fluor-, klóratommal, hidroxil-, 1-3 szénatomos alkoxi-karbonil-, 1-3 szénatomos acil-oxi-, 1-3

szénatomos alkoxi- vagy N-(1-4 szénatomos alkil)₂ általános képletű csoporttal helyettesítve; R⁴ jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluor- vagy klóratom, OCH₃ képletű csoport; R⁵ jelentése hidrogénatom, 1-8 szénatomos alkilcsoport, adott esetben egy vagy több fluor-, klóratommal, hidroxil-, 1-8 szénatomos alkoxi-, 1-8 szénatomos acil-oxi-csoporttal helyettesítve, R⁵ további jelentése 3-6 szénatomos cikloalkil-, amino-, 1-8 szénatomos alkil-amino-, 1-8 szénatomos dialkil-amino-, 1-8 szénatomos alkoxics csoport; R⁶ jelentése oxigén-, kénatom, NR¹⁰, CR¹¹R¹², (OR)₂ általános képletű csoport (melyen belül R jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport), O(CH₂)_mO, (SR)₂ általános képletű csoport (melyen belül R jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport), S(CH₂)_mS általános képletű csoport; R⁷ jelentése hidrogénatom, 1-8 szénatomos alkilcsoport, mely adott esetben egy vagy több fluor-, klóratommal, -CN, -OH képletű, 1-8 szénatomos alkoxi-, 1-8 szénatomos acil-oxi-, 1-8 szénatomos alkoxi-karbonil-, fenilcsoporttal helyettesített, 1-8 szénatomos acilcsoport, mely adott esetben egy vagy több hidroxil-, 1-8 szénatomos alkoxi-, 1-8 szénatomos acil-oxi-csoporttal helyettesített, 1-8 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxamidcsoport adott esetben a nitrogénatomján 1-4 szénatomos alkil- vagy fenilcsoporttal helyettesítve, fenilcsoport, adott esetben egy vagy több halogénatommal, CN képletű, 1-3 szénatomos alkoxi-, 1-3 szénatomos alkoxi-karbonil-, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal helyettesítve, mely helyettesített lehet egy vagy több fluoratommal vagy 1-3 szénatomos alkoxics csoporttal; R⁸ és R⁹ jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-8 szénatomos alkilcsoport, mely adott esetben egy vagy több fluor-, klóratommal, -CN, OH képletű, 1-8 szénatomos alkoxi-, 1-8 szénatomos acil-oxi-, 1-8 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy fenilcsoporttal helyettesített; 1-8 szénatomos acilcsoport, mely adott esetben egy vagy több hidroxil-, 1-8 szénatomos alkoxi-, 1-8 szénatomos acil-oxi-, amino-, 1-4 szénatomos acil-amino-, amino-(1-4 szénatomos)-acil-amino-csoporttal helyettesített; benzoilcsoport, mely adott esetben



egy vagy több fluor-, klóratommal, hidroxil-, 1-8 szénatomos alkoxi-, 1-8 szénatomos acil-oxi-, amino-, 1-4 szénatomos acil-amino-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-amino-csoporttal helyettesített; 1-8 szénatomos alkoxi-karbonil-, benzil-oxi-karbonil-, terc-butoxi-karbonil-csoport, karboxamidcsoport, melynek nitrogénatomja adott esetben 1-4 szénatomos alkil- vagy fenilcsoporttal helyettesített; trifluor-acetil- vagy CO(1-6 szénatomos)alkil általános képletű csoport; R^{10} jelentése hidrogénatom, OR^7 , NHR^7 , 1-8 szénatomos alkilcsoport, mely adott esetben fenilcsoporttal helyettesített; R^{11} és R^{12} jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, fluoratom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, mely adott esetben halogénatommal, hidroxil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, fenilcsoporttal helyettesített; 1-8 szénatomos acil-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy CN képletű csoport; R^{17} jelentése oxigén- vagy kénatom; R^{18} és R^{19} jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, mely adott esetben halogénatommal, hidroxil-, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal helyettesített; hidroxil-, 1-4 szénatomos alkoxicssoport, mely adott esetben hidroxil- vagy 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal helyettesített; NR^8R^9 , $-OC(O)-(1-4 \text{ szénatomos})\text{alkil}$ általános képletű csoport; R^{20} jelentése hidrogénatom vagy CH_3 képletű csoport; n jelentése 0 vagy 1; és m jelentése 2 vagy 3.

Ennek a csoportnak egyik képviselője a (IIj) képletű vegyület.

(vi) A WO 97/27188 számú nemzetközi szabadalmi bejelentés a (IIk) általános képletű vegyületekkel foglalkozik, ahol R^1 jelentése $-NHC(=O)-(1-4 \text{ szénatomos})\text{alkil}$, $-NHS(O)_n-(1-4 \text{ szénatomos})\text{alkil}$ általános képletű csoport, melyen belül n jelentése 0, 1 vagy 2 vagy R^1 jelentése hidroxilcsoport; R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén- vagy fluoratom; R^4 jelentése hidrogénatom, metil-, etil- vagy oxocsoport; R^5 jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szénatomos alkinil- vagy $R^6(CH_2)_m$ általános képletű csoport, melyen belül m jelentése 1-4 és



R^6 jelentése trifluor-metil-, difluor-metil-, fluor-metil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-, $S(O)_p$ általános képletű csoport, melyen belül p jelentése 0, 1 vagy 2, 1-6 szénatomos alkanoil-oxi-, di(N-(1-4 szénatomos)alkil)-amino-, N-(1-4 szénatomos)alkil-(1-4 szénatomos)alkanoil-amino-, ciano-, karboxil-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, karbamoil-, di(N-(1-4 szénatomos)alkil)-karbamoil-, N-(1-4 szénatomos)alkil-(1-4 szénatomos)alkánszulfonamido-, N^1 -(1-4 szénatomos)alkil-di(N^3 -(1-4 szénatomos)alkil-ureido-csoport vagy $-OC(=O)NR(R^8)$ vagy $N(R^9)SO_2NR^7(R^8)$ általános képletű csoport, melyen belül R^7 és R^8 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport és R^9 jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport; vagy m jelentése 2-4 és R^6 jelentése hidroxil-, 1-4 szénatomos alkanoil-amino-, amino-, 1-4 szénatomos alkil-amino-, 1-4 szénatomos alkánszulfonamido, ureido, di(N^3 -(1-4 szénatomos)alkil)-ureido vagy $NHSO_2NR^7(R^8)$ általános képletű csoport.

Ennek a csoportnak egyik képviselője a (III) képletű csoport.

(vii) A WO 98/01446 számú nemzetközi szabadalmi bejelentés foglalkozik a (IIIm) általános képletű vegyületekkel, ahol R^1 jelentése $-NHC(=O)R^a$ általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport; R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén- vagy fluoratom; R^4 és R^5 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy metilcsoport; R^6 jelentése 2 vagy 3 nitrogénatomot, mint egyetlen heteroatomot tartalmazó hattagú heteroarilcsoport, amely adott esetben az alábbi szubsztituensek valamelyikével lehet helyettesített: adott esetben helyettesített 1-4 szénatomos alkilcsoport, halogénatom, trifluor-metil-, 1-4 szénatomos alkil- $S(O)_n$ általános képletű (ahol n jelentése 0, 1 vagy 2), 1-4 szénatomos alkil- $S(O)_2$ -amino-, 1-4 szénatomos alkanoil-amino-, karboxil-, hidroxil-, amino-, 1-4 szénatomos alkil-amino-, di(1-4 szénatomos)alkil-amino-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, karbamoil-, N-(1-4 szénatomos)alkil-karbamoil-, di(N-(1-4 szénatomos)alkil)-karbamoil-csoport (melyen

belül az 1-4 szénatomos alkilcsoport vagy az utóbbi két említett karbamoil szubsztituens adott esetben hidroxil-, 1-4 szénatomos alkoxi- vagy 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoporttal helyettesített), 2-4 szénatomos alkenilcsoport (adott esetben karboxil- vagy 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoporttal helyettesítve), 1-4 szénatomos alkoxi-, ciano- vagy nitrocsoport.

Ennek a csoportnak egyik képviselője a (IIn) képletű vegyület

Összefoglalva: kutatásaink olyan új vegyületekre irányultak, melyek számos emberi és állati kórokozóval szemben hatásosak, ideértve a gram-pozitív aerob baktériumokat, mint amilyenek az MRSA-k, a Streptococcusok és Enterococcusok, az anaerob mikroorganizmusokat, mint amilyenek a Bacteroides, Clostridia fajok és a saválló mikroorganizmusok, például a Mycobacterium tuberculosis, Mycobacterium avium és Mycobacterium fajok. Az ilyen irányú munkánk vezetett a fenti (I) általános képletű vegyületek kifejlesztéséhez.

A jelen találmány tehát (I) általános képletű új oxazolidinonokkal, származékaikkal, analógjaikkal, tautomer alakjaikkal, sztereoizomerjeikkel, polimorfjaikkal, gyógyászati szempontból alkalmazható sóikkal, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjaikkal és az említetteket tartalmazó gyógyszerkészítményekkel és olyan keverékekkel foglalkozik, melyek fokozott aktivitásúak toxikus hatás nélkül vagy csökkent toxicitással.

Ugyancsak leírjuk az (I) általános képletű vegyületek, származékaik, analógjaik, tautomer alakjaik, sztereoizomerjeik, polimorfjaik, gyógyászati szempontból alkalmazható sóik és gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjaik előállítási eljárását is.

A jelen szabadalom továbbá gyógyszerkészítményekkel szolgál, mely (I) általános képletű vegyületeket, analógjait, származékait, tautomerjeit, sztereoizomerjeit, polimorfjait, sóit, szolvátjait vagy ezek keverékeit tartalmazzák alkalmas vivőanyagok,

oldószer, hígítók és más, az ilyen készítményeknél szokásosan alkalmazott közeganyagok kíséretében.

A találmány az (I) általános képletű vegyületek előállításánál alkalmazható (VI), (VII), (X), (XVI), (XVIII) általános képletű új köztesanyagokkal, előállítási eljárásaikkal és felhasználásukkal is foglalkozik.

A jelen találmány (I) általános képletű - ahol az általános képletben

R^1 jelentése halogénatom, azido-, tioalkohol-, izotiocianátcsoport, OR^4 , NHR^4 vagy $N(R^4)_2$ általános képletű csoport, ahol R^4 jelentése hidrogénatom vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: acil-, tioacil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, 3-6 szénatomos cikloalkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-karbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-karbonil-, aril-oxi-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-tiokarbonil-, aril-oxi-tiokarbonil-csoport, $-C(=O)C(=O)-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil}$, $-C(=O)-C(=O)-\text{aril}$, $-C(=O)-C(=O)-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkoxi}$, $-C(=O)-C(=O)-\text{aril-oxi}$, $-(C=S)-S-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil}$, $-(C=S)-NH_2$, $-(C=)-NH-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil}$, $-C(=S)-N-((1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil})_2$, $-C(=S)-NH-(2-6 \text{ szénatomos})\text{-alkenil}$, $(C=S)-(C=O)-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkoxi}$, $-(C=S)-(C=O)-\text{aril-oxi}$, $-C(=S)-O-(C=O)-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil}$, $C(=S)-C(=S)-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil}$, $-C(=S)-C(=S)-\text{aril}$ általános képletű csoport, tiomorfolinil-tiokarbonil- vagy pirrolidinil-tiokarbonil-csoport;

R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-,ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szén-

atomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;

Y^1 jelentése =O vagy =S képletű csoport;

Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, =O, =S képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport;

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyülettel, származékaival, analógjaival, tautomer alakjaival, sztereoizomerjeivel, polimorfjaival, gyógyászati szempontból alkalmazható sóival vagy gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjaival szolgál.

Az alkalmas R^4 csoportokat az alábbiak közül választjuk ki: hidrogénatom, 1-7 szénatomos acilcsoport, mint amilyen a $-C(=O)H$, $-C(=O)CH_3$, $-C(=O)CH_2CH_3$, $-C(=O)(CH_2)_2CH_3$, $-C(=O)(CH_2)_3CH_3$, $-C(=O)(CH_2)_4CH_3$, $-C(=O)(CH_2)_5CH_3$, $-C(=O)Ph$ képletű csoport és hasonló, az acilcsoport lehet helyettesített; tio-(1-7 szénatomos)acil-csoport, mint amilyen a $-C(=S)H$, $-C(=S)CH_3$, $-C(=S)CH_2CH_3$, $-C(=S)Ph$ képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos alkoxi-

-karbonil-csoport, melyben az 1-6 szénatomos alkilcsoport lehet egyenes vagy elágazó, mint amilyen a metoxi-karbonil-, etoxi-karbonil-, propoxi-karbonil-, izopropoxi-karbonil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; ciklo(3-6 szénatomos)-alkoxi-tiokarbonil-csoport, mint amilyen a ciklopropoxi-tiokarbonil-, ciklobutoxi-tiokarbonil-csoport és hasonló, a ciklo(3-6 szénatomos)alkoxi-tiokarbonil-csoportok lehetnek helyettesítettek; 2-6 szénatomos alkenil-oxi-karbonil-csoport, mint amilyen az etenil-oxi-karbonil-, propenil-oxi-karbonil-, butenil-oxi-karbonil-csoport és hasonló, a 2-6 szénatomos alkenil-oxi-karbonil-csoportok lehetnek helyettesítettek; aril-oxi-karbonil-csoport, mint amilyen a fenoxi-karbonil-, benzil-oxi-karbonil-csoport és hasonló, az aril-oxi-karbonil-csoportok lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-csoport, mint amilyen a $\text{CH}_3\text{O}-\text{C}(=\text{S})-$, $\text{C}_2\text{H}_5\text{O}-\text{C}(=\text{S})-$, $\text{C}_3\text{H}_7\text{O}-\text{C}(=\text{S})-$ képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 2-6 szénatomos alkenil-oxi-tiokarbonil-csoport, mint amilyen az etenil-oxi-tiokarbonil-, propenil-oxi-tiokarbonil-, butenil-oxi-tiokarbonil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; aril-oxi-tiokarbonil-csoport, mint amilyen a $\text{fenil-O-C}(=\text{S})-$, $\text{benzil-O-C}(=\text{S})-$ képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil}$ általános képletű csoport, mint amilyen a $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-\text{metil}$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-\text{etil}$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-\text{propil}$ képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-\text{aril}$ általános képletű csoport, mint amilyen a $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-\text{fenil}$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-\text{naftil}$ képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkoxi}$ általános képletű csoport, mint amilyen a $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-\text{metoxi-}$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-\text{etoxi-}$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-\text{propil-oxi}$ képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-\text{aril-oxi}$ általános képletű csoport, mint amilyen a $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-\text{fenil-oxi}$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})-\text{benzil-oxi}$ képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; $-(\text{C}=\text{S})-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil}$ álta-



lános képletű csoport, mint amilyen a $-(C=S)-S$ -metil-, $-(C=S)-S$ -etil, $-(C=S)-S$ -propil képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; $-(C=S)-NH_2$ képletű csoport; $-(C=S)-NH$ -(1-6 szénatomos)alkil általános képletű csoport, mint amilyen a $-(C=S)-NH$ -metil, $-(C=S)-NH$ -etil, $-(C=S)-NH$ -propil képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; $-(C=S)-N$ -(1-6 szénatomos)alkil₂ általános képletű csoport, mint amilyen a $-(C=S)-N$ -(metil)₂, $-(C=S)-N$ -(etil)₂, $-(C=S)-N$ -(propil)₂ képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; $-(C=S)-NH$ -(2-6 szénatomos)alkenil általános képletű csoport, mint amilyen a $-(C=S)-NH$ -etenil, $-(C=S)-NH$ -propenil, $-(C=S)-NH$ -butenil képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; $-(C=S)-(C=O)$ -(1-6 szénatomos)alkoxi általános képletű csoportok, mint amilyen $-(C=S)-(C=O)$ -metoxi, $-(C=S)-(C=O)$ -etoxi, $-(C=S)-(C=O)$ -propoxi képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; $-(C=S)-(C=O)$ -aril-oxi általános képletű csoport, mint amilyen a $-(C=S)-(C=O)$ -fenil-oxi, $-(C=S)-(C=O)$ -naftil-oxi képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; $-(C=S)-O-(C=O)$ -(1-6 szénatomos)alkil általános képletű csoport, mint amilyen a $-(C=S)-O-(C=O)$ -metil, $-(C=S)-O-(C=O)$ -etil, $-(C=S)-O-(C=O)$ -propil képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; $-C(=S)-C(=S)$ -(1-6 szénatomos)alkil általános képletű csoport, mint amilyen a $-C(=S)-C(=S)$ -metil, $-C(=S)-C(=S)$ -etil, $-C(=S)-C(=S)$ -propil képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; $-(=S)-C(=S)$ -aril általános képletű csoport, mint amilyen a $-(=S)-C(=S)$ -fenil, $-(=S)-C(=S)$ -naftil képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; tiomorfolinil-tiokarbonil-csoport vagy pirrolidinil-tiokarbonil-csoport.

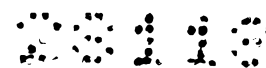
Amikor az R^4 csoport helyettesített, a szubsztituens lehet halogénatom, mint amilyen a klór-, fluor-, bróm- vagy jódatom; hidroxil-, amino-, mono(1-6 szénatomos)alkil-amino-csoport, mint amilyen a metil-amino-, etil-amino-, propil-amino-csoport

és hasonló, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-csoport, mint amilyen a dimetil-amino-, dietil-amino-, metil-etil-amino-, dipropil-amino-, etil-propil-amino-csoport és hasonló, nitro-, ciano-, alkoxi-, aril-, hidroxil-aril-, piridil-, hidroxil-alkil-, alkoxil-aril- vagy karboxilcsoport és származékaik.

Az alkalmas R^2 és R^3 csoportokat az alábbiak közül választhatjuk ki: hidrogénatom, halogénatom, mint amilyen a fluor-, klór- vagy brómatom; 1-6 szénatomos alkilcsoport, mint amilyen a metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, terc-butil-, pentil-, izopentil-, n-hexil-csoport és hasonló; halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport, mint amilyen a halogén-metil-, halogén-etil-, halogén-propil-, trihalogén-metil-csoport és hasonló, ahol a halogénatom lehet fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom; ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, ahol R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkilcsoport, mint amilyen a metil-, etil-, propil-, izopropilcsoport és hasonló.

Az R^a szubsztituens az alábbiak közül választjuk ki: hidroxilcsoport, halogénatom, nitro-, amino-, alkoxi-, karboxil- vagy cianocsoport.

Az alkalmas Z csoportot az alábbiak közül választjuk ki: kénatom, oxigénatom, $=CH$ képletű vagy NR^b általános képletű csoport, ahol R^b jelentése hidrogénatom, helyettesítetlen vagy helyettesített, 1-6 szénatomos alkilcsoport, mint amilyen a metil-, etil-, propilcsoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 2-6 szénatomos alkenilcsoport, mint amilyen az etenil, propenil-, butenilcsoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos cikloalkilcsoport, mint amilyen a ciklopropil-, ciklobutilcsoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos alkoxycsoport, mint amilyen a metoxi-, propoxi-, izopropoxycsoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; arilcsoport, mint amilyen a fenil-, naftilcsoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; aralkilcsoport, mint amilyen a benzil-, fenetilcsoport



és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; aril-
 -oxi-csoport, mint amilyen a fenil-oxi-, naftil-oxi-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos alkil-karbonil-csoport, mint amilyen a metil-karbonil-, etil-karbonil-, propil-karbonil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, mint amilyen a metil-karbonil-, etil-karbonil-, propil-karbonil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; aril-karbonil-csoport, mint amilyen a fenil-karbonil-, naftil-karbonil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, mint amilyen a metoxi-karbonil-, etoxi-karbonil-, propoxi-karbonil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; vagy aril-oxi-karbonil-csoport, mint amilyen a fenil-oxi-karbonil-, naftil-oxi-karbonil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek.

Az R^6 szubsztituenst az alábbi csoportok közül választjuk ki: hidroxil-, halogén-, pirrolidinil-, tiokarbonil-, nitro-, amino-, alkoxi-, karboxil- vagy cianocsoport,

Az Y^1 csoportot az $=O$ vagy $=S$ képletű csoport képviseli, az Y^2 és Y^3 csoportokat az alábbiak közül választjuk ki: hidrogénatom, halogénatom, mint amilyen a fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom; ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-amino-, $=O$, $=S$ képletű csoport, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkilcsoport, mint amilyen a metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, terc-butil-csoport és hasonló; 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-csoport, mint amilyen a hidroxil-metil-, hidroxil-etil-, hidroxil-propil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-csoport, mint amilyen a metoxi-metil-, metoxi-etil-, etoxi-etil-, etoxi-metil-, metoxi-propil-, propoxi-metil-, propoxi-etil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, mint amilyen a metoxi-karbonil-, etoxi-karbonil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-csoport, mint amilyen a CH_3COOH ,



CH₃-CH₂-COOH képletű csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, mint amilyen a metil-szulfonil-, etil-szulfonil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-csoport, mint amilyen a metil-karbonil-amino-metil-, etil-karbonil-amino-metil-, metil-karbonil-amino-etil-, etil-karbonil-amino-etil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-csoport, mint amilyen a fenil-karbonil-amino-metil-, fenil-karbonil-amino-etil-, etil-karbonil-amino-etil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-csoport, mint amilyen a fenil-karbonil-amino-metil-, fenil-karbonil-amino-etil-, naftil-karbonil-amino-metil-, naftil-karbonil-amino-etil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-csoport, mint amilyen a metil-karbonil-oxi-metil-, etil-karbonil-oxi-metil-, metil-karbonil-oxi-etil-, propil-karbonil-oxi-metil-, propil-karbonil-oxi-etil-, propil-karbonil-oxi-propil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos amino-alkil-csoport, mint amilyen az amino-metil-, amino-etil-, amino-propil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos monoalkil-amino-csoport, mint amilyen a metil-amino-, etil-amino-, propil-amino-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; di(1-6 szénatomos)alkil-amino-csoport, mint amilyen a dimetil-amino-, dietil-amino-, metil-etil-amino-, dipropil-amino-, etil-propil-amino-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; aril-amino-csoport, mint amilyen a fenil-amino-, benzil-amino-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; 1-6 szénatomos alkoxicssoport, mint amilyen a metoxi-, etoxi-, propoxi-, izopropoxicssoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; arilcsoport, mint amilyen a fenil-, naftilcsoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; aril-oxi-csoport, mint amilyen a fenoxi-, naftil-oxi-csoport és hasonló, melyek



lehetnek helyettesítettek; aralkilcsoport, mint amilyen a benzil-, fenetil-, $C_6H_5CH_2CH_2CH_2$ képletű, naftil-metil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; heteroarilcsoport, mint amilyen a piridil-, tienil-, furil-, pirrolil-, oxazolil-, tiazolil-, pirazolil-, imidazolil-, oxadiazolil-, tetrazolil-, benzopiranyl-, benzofuranilcsoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; heteroaralkil-csoport, mint amilyen az imidazol-metil-, imidazol-etil-, piridil-etil-, furil-metil-, oxazol-metil-, imidazolilcsoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek; heterociklusos csoport, mint amilyen a pirrolidinil-, piperidinil-, morfolinil-, piperazinil-csoport és hasonló; heterocikloalkil-csoport, mint amilyen a pirrolidin-metil-, piperidin-metil-, morfolin-metil-, piperazin-metil-csoport és hasonló, melyek lehetnek helyettesítettek.

Amikor Y^2 és Y^3 helyettesített, a szubsztituens lehet hidroxil-, nitro-, ciano-, amino-, terc-butil-dimetil-szilil-oxi-(TBSO), halogén-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 3-6 szénatomos cikloalkil-, arilcsoport, mint amilyen a fenil-, naftilcsoport és hasonló, benzil-oxi-, acilcsoport, mint amilyen a formil-, acetyl-csoport és hasonló, karboxil- vagy acil-oxi-csoport, mint amilyen a formil-oxi-, acetyl-oxi-csoport és hasonló.

Amikor Y^2 és Y^3 szomszédos szénatomokhoz kapcsolódik, alkalmas gyűrűs szerkezetet képezhet, ami lehet helyettesített vagy helyettesítetlen benzol-, piridin-, pirrolidin-, furán-, tiofén-, morfolin-, piperazin-, pirrolszerkezetű vagy hasonló.

A jelen találmány részét képező gyógyászati szempontból alkalmazható sók származhatnak szervetlen bázisból, mint amilyenek a Li, Na, K, Ca, Mg, Fe, Cu, Zn, Mn-sók; a sók képezhetők szerves bázisokkal, mint amilyen az N,N'-diacetyl-etylén-diamin, betain, koffein, 2-dietyl-amino-etanol, 2-dimetil-amino-etanol, N-etyl-morfolin, N-etyl-piperidin, glükamin, glükózamin, hidrabamin, izopropil-amin, metil-glükamin, morfolin, piperazin, piperidin, prokain, purinok, teobromin, trietyl-amin,



trimetil-amin, tripropil-amin, trometamin, dietanol-amin, meglumin, etilén-diamin, N,N'-difeni-etilén-diamin, N,N'-dibenzil-etilén-diamin, N-benzil-fenil-etil-amin, kolin, kolin-hidroxid, diciklohexil-amin, metformin, benzil-amin, fenil-etil-amin, dialkil-amin, trialkil-amin, tiamin, amino-pirimidin, amino-piridin, purin, spermidin és hasonló; királis bázisokkal, mint amilyen az alkil-fenil-amin, glicinol, fenil-glicinol és hasonló; természetes aminosavakkal, mint amilyen a glicin, alanin, valin, leucin, izoleucin, norleucin, tirozin, cisztin, cisztein, metionin, prolin, hidroxiprolin, hisztidin, ornitin, lizin, arginin, szerin, treonin, fenil-alanin; nem természetes aminosavakkal, mint amilyen a D-izomerek és a szubsztituált aminosavak; guanidinnel, helyettesített guanidinnel, ahol a szubsztituens lehet nitro-, amino-, alkilcsoport, mint amilyen a metil-, etil, propilcsoport és hasonló, alkenilcsoport, például etenil-, propenil-, butenilcsoport és hasonló, alkinilcsoport, például etinil-, propinilcsoport és hasonló; ammóniummal vagy helyettesített ammóniummal és alumíniummal. A sók lehetnek savaddíciós sók, például szulfátok, nitrátok, foszfátok, perklorátok, borátok, halogenidek, acetátok, tartarátok, maleátok, citrátok, szukcinátok, palmoátok, metánszulfonátok, benzoátok, szalicilátok, hidroxinaftoátok, benzolszulfonátok, aszkorbátok, glicerofoszfátok, ketoglutarátok és hasonló. A gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátok lehetnek hidrátok vagy a kristályosítás más oldószereivel, például alkoholokkal képzett szolvátok.

A jelen találmány különösen alkalmas vegyületei az alábbiak:

(5R)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-3-[3-fluor-4-(2-tioxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-3-[3-fluor-4-(2-tioxo-1,3-tiazolan-3-il)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxazolan-2-on,



(5R)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-
 -oxazolan-2-on,

3-{2-fluor-4-[(5R)-5-hidoxi-metil-2-oxo-1,3-oxazolan-3-il]-fenil}-2,3-dihidrobenco-
 [d][1,3]oxazol-2-on,

3-{2-fluor-4-[(5R)-5-hidoxi-metil-2-oxo-1,3-oxazolan-3-il]-fenil}-6-metil-2,3-di-
 hidrobenco[d][1,3]oxazol-2-on,

3-{2-fluor-4-[(5R)-5-hidoxi-metil-2-oxo-1,3-oxazolan-3-il]-fenil}-5-metil-2,3-di-
 hidrobenco[d][1,3]oxazol-2-on,

(5R)-5-hidroxi-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-
 -oxazolan-2-on,

(5R)-3-[2-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxazolan-2-
 -on,

(5R)-3-[3,5-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxazolan,
 -2-on,

(5R)-5-hidroxi-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-3-on,

3-{4-[(5R)-5-hidroxi-metil-2-oxo-1,3-oxazolan-3-il]-fenil}-2,3-dihidrobenco-
 [d][1,3]-oxazol-2-on,

(5R)-3-[3-fluor-4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxa-
 zolan-2-on,

(5R)-3-{3-fluor-4-[3-(4-metoxi-benzil)-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-5-hidroxi-
 -metil-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxa-
 zolan-2-on,

(5R)-5-hidroxi-metil-3-[4-(3-metil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxazolan-
 -2-on,



(5R)-5-hidroxi-metil-3-[4-(3-benzil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-3-fenil-1-imidazolidinil)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-3-{3-fluor-4-[3-(fluor-fenil)-2-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-5-hidroxi-metil-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-azido-metil-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-azido-metil-3-[2-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

3-{4-[(5R)-5-azido-metil-2-oxo-1,3-oxazolan-3-il]-2-fluor-fenil}-6-metil-2,3-dihidro-benzo[d][1,3]oxazol-2-on,

3-{4-[(5R)-5-azido-metil-2-oxo-1,3-oxazolan-3-il]-2-fluor-fenil}-5-metil-2,3-dihidrobenzo[d][1,3]oxazol-2-on,

(5R)-5-azido-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-5-azido-metil-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-azido-metil-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-5-azido-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

3-{4-[(5R)-5-azido-metil-2-oxo-1,2-oxazolan-3-il]-fenil}-2,3-dihidrobenzo[d][1,3]oxazol-2-on,

(5R)-5-azido-metil-3-[3-fluor-4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,



(5R)-5-azido-metil-3-[3-fluor-4-(3-fenil-2-oxo-1-imidazolindil)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-5-azido-metil-3-{3-fluor-4-[3-(4-fluor-fenil)-2-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-amino-metil-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-amino-metil-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-5-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-5-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-5-amino-metil-3-[3-fluor-4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-5-amino-metil-3-[3-fluor-4-(3-benzil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

N-{(5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-metánamid,

N-{(5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-metánamid,

N1-{(5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,

N1-{(5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-propánamid,

N1-{(5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-butánamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
-metil}-pentánamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
-metil}-heptánamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
-metil}-akrilamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
-metil}-2,2,2-trifluor-acetamid,

etil-(5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
-metil-karbamoil-metanoát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-tioxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
-metil}-acetamid,

N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-tioxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil}-
-acetamid,

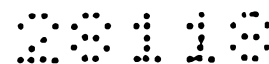
N1-((5S)-2-oxo-3-[3-fluor-4-(2-tioxo-1,3-tiazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-
-5-il-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-
-5-il-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-2,3-dihidrobenczo[d][1,3]oxazol-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-
-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(6-metil-2-oxo-2,3-dihidrobenczo[d][1,3]oxazol-3-il)-fenil]-
-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(5-metil-2-oxo-2,3-dihidrobenczo[d][1,3]oxazol-3-il)-fenil]-
-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,



N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil)-acetamid,

N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil)-propánamid,

N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil)-heptánamid,

N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil)-akrilamid,

N1-((5S)-3-[2-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-acetamid,

N1-((5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-acetamid,

N1-((5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-propánamid,

N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil)-acetamid,

N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-2,3-dihidrobenczo[d][1,3]oxazol-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil)-acetamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-acetamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-benzil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-acetamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-acetamid,

N1-((5S)-3-[4-(3-metil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-[4-(3-benzil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-fenil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-
-5-il-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-(4-fluor-fenil)-2-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-
-oxazolan-5-il-metil)-acetamid,

(5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-(1-tioxo-etil-amino-metil)-1,3-
-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-(3,3,3-trifluor-1-tioxo-propil-
-amino-metil)-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-5-(1-tioxo-etil-amino-
-metil)-1,3-oxazolan-2-on,

3-{2-fluor-4-[(5S)-2-oxo-5-(1-tioxo-etil-amino-metil)-1,3-oxazolan-3-il]-fenil}-
-2,3-dihidrobenzo[d][1,3]oxazol-2-on,

(5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-5-(1-tioxo-etil-amino-
-metil)-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-(1-tioxo-etil-amino-metil)-
-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-(1-tioxo-propil-amino-
-metil)-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-(1-tioxo-etil-amino-metil)-1,3-oxa-
zolan-2-on,

(5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-5-(1-tioxo-etil-amino-metil)-
-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[3-fluor-4-(3-fenil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-5-(1-tioxo-etil-amino-metil)-
-1,3-oxazolan-2-on,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-me-
til)-metil-karbamát,

N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-
-5-il-metil)-metil-karbamát,

N1-((5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
-metil)-metil-karbamát,

N1-((5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-
-metil-karbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-
-5-il-metil)-metil-karbamát,

(5S)-5-metil-tioxi-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-
-1,3-oxazolan-2-on,

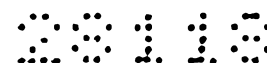
N1-((5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-
-il-metil)-metil-ditiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
-metil)-etil-tiokabamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
-metil)-trifluor-acetoxi-tiokarbamát,

- (5S)-5-ciklohexil-oxi-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-
- -fenil]-1,3-oxazolan-2-on,
- N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-tioxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
- metil)-metil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolindil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-
- 5-il-metil)-etil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolindil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-
- 5-il-metil)-1-propil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-
- 5-il-metil)-metil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-
- 5-il-metil)-2-propil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-
- 5-il-metil)-metil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-
- 5-il-metil)-etil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
- metil)-metil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-
- metil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-
- etil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-1-
- propil-tiokarbamát,



- (5S)-5-[2,2,2-trifluor-etil-oxi-(tioxo)-metil-amino-metil]-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,
- (5S)-5-[2-hidroxi-etil-oxi-(tioxo)-metil-amino-metil]-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,
- (5S)-5-[2-metoxi-etil-oxi-(tioxo)-metil-amino-metil]-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,
- N1-((5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-allil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolin-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-2-propil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-2,3-dihydrobenzo[d][1,3]oxazol-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-2,3-dihydrobenzo[d][1,3]oxazol-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-3-[4-(3-metil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-3-[4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,
- N1-((5S)-3-[4-(3-benzil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[4-(3-benzil-2-oxo-2-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-fenil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-fenil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-(4-fluor-fenil)-2-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-(4-fluor-fenil)-2-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-(4-fluor-fenil)-2-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-2-propil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-metoxi-metil-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-benzil-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-benzil-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{4-[4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-(N,N-dimetil-amino)-etil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-(4-metoxi-benzil)-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolin-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-benzil-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-izopropil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-(3-fluor-4-(3-hidroxi-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil)-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-(3-fluor-4-(4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil)-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-(3-fluor-4-(3-metil-4-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil)-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

(5S)-5-[(2S)-2-hidroxi-metil-azolan-1-il-(tioxo)-metil-amino-metil]-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-dietil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-allil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-benzil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-[4-metoxi-benzil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil]-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan,

(5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-[2-piridil-metil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-metil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-[2-hidroxi-etil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil]-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-[1,4-tizinan-4-il-(tioxo)-metil-amino-metil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-[2-piridil-amino-(tioxo)-metil-amino-
-metil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-amino-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-
-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-metil-amino-(tioxo)-metil-
-amino-metil-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-amino-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-
-fenil]-1,3-oxazolan-2-on, vagy sója,

(5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-metil-amino-(tioxo)-metil-
-amino-metil-1,3-oxazolan-2-on,

N1-((5S)-3-{4-[4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-(N,N-
-dimetil-amino)-etio-karokarbamát-hidroklorid
és sóik.

A jelen találmány foglalkozik az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése hidrogénatom és a többi jelölt csoport jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyület előállításával, mely abból áll, hogy

(i) a (III) általános képletű - ahol valamennyi csoport a fentiekben meghatározott - vegyületet (IV) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport, például halogénatom, alkoxi-, szulfonilcsoport és hasonló, R^2 és R^3 jelentése azonos a korábbi meghatározásokkal - vegyülettel reagáltatjuk, az (V) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve;

(ii) az (V) általános képletű vegyületet redukáljuk a (VI) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve;

- (iii) a (VI) általános képletű vegyületet alkil-klór-formiáttal reagáltatjuk a (VII) általános képletű - ahol R^c jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport, például metil-, etil-, propil-, benzil-, allilcsoport és hasonló; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve;
- (iv) a (VII) általános képletű vegyületet bázis jelenlétében (VIII) általános képletű - ahol R^{12} jelentése 1-3 szénatomos alkilcsoport, mint amilyen a metil-, etil- vagy propilcsoport - vegyülettel reagáltatjuk, az (I) általános képletű vegyületekhez jutva, ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve;
- (v) az (I) általános képletű vegyületet alkil-szulfonil-kloriddal vagy aril-szulfonil-kloriddal reagáltatjuk, az (I) általános képletű vegyületet nyerve, ahol R^1 jelentése alkil-szulfonil- vagy aril-szulfonil-csoport, amit nátrium-aziddal reagáltatva megkapjuk az (I) általános képletű vegyületet, ahol R^1 jelentése azidocsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve;
- (vi) az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése azidocsoport - vegyületet redukáljuk, (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése hidrogénatom; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott.

A (III) általános képletű vegyületnek (IV) általános képletű vegyülettel való, (V) általános képletű vegyületet eredményező reagáltatását bázis jelenlétében végezhetjük, ami lehet kálium-hidroxid, nátrium-hidroxid, kálium-karbonát, nátrium-karbonát, nátrium-hidrid, kálium-hidrid, trietil-amin, diizopropil-etil-amin és hasonló. A reakcióhoz használhatunk oldószert, például dimetil-szulfoxidot, dimetil-formamidot, tetrahidrofuránt, acetonitrilt, kloroformot és hasonló vagy ezek elegyét. A reakciót közömbös gáztérben, például nitrogén- vagy argongázban hajthatjuk végre. A reakció hőmérsék-

lete 20-100°C, előnyösen szobahőmérséklet és 80°C közötti hőmérséklet. A reakcióidő 1-15 óra, előnyösen 6-12 óra.

Az (V) általános képletű vegyület (VI) általános képletű vegyületet eredményező redukcióját hidrogéngázzal végezhetjük katalizátor jelenlétében, ami lehet szilárd hordozón, például aktívszénen, alumínium-oxidon, azbeszten vagy hasonlóan lévő ruténium, palládium, ródium, nikkel. A reakcióhoz használt oldószer lehet dioxán, ecetsav, etil-acetát, tetrahidrofurán, alkohol, például metanol, etanol és hasonlóak vagy ezek elegye. A gáz nyomása légköri nyomás és 60 psi nyomás közötti. A reakciót 25-60°C hőmérsékleten végezhetjük, előnyösen szobahőmérsékleten. A reakcióidő 2 és 48 óra között változik. A redukáláshoz használhatunk ásványi savban lévő fémet is, például ón/sósav, vas/sósav, cink/ecetsav kombinációkat és hasonlókat.

A (VI) általános képletű vegyületnek (VII) általános képletű vegyületté való átalakítását alkil-klór-formiáttal, például metil-klór-formiáttal, etil-klór-formiáttal, propil-klór-formiáttal, benzil-klór-formiáttal és hasonlóval végezzük. A reakció oldószere lehet víz, aceton, tetrahidrofurán (THF), acetonitril, diklór-metán (DCM) és hasonló vagy ezek elegye. A reakciót bázis, például kálium-karbonát, nátrium-karbonát, nátrium-hidrid, kálium-hidroxid, trietil-amin és hasonló jelenlétében végezhetjük. A reakciót 0-60°C, előnyösen 0°C és szobahőmérséklet közötti hőmérsékleten hajtjuk végre. A reakcióidő 1-12 óra, előnyösen 1-4 óra.

A (VIII) általános képletű vegyületnek (VII) általános képletű vegyületnek (VIII) általános képletű vegyülettel történő, (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport - vegyületet eredményező reakcióját bázis, például alkálifém-hidrid, mint amilyen a nátrium-hidrid vagy kálium-hidrid, szerves lítiumvegyület, mint amilyen a metil-lítium, butil-lítium, lítium-diizopropil-amid (LDA) és hasonló vagy alkoxid, mint amilyen a nátrium-metoxid, nátrium-etoxid, kálium-terc-butoxid jelenlétében hajthatjuk

vége. A reakciót végezhetjük oldószer, például THF, dioxán, dimetil-formamid (DMF), dimetil-szulfoxid (DMSO), etilén-glikol-dimetil-éter (DME) és hasonló vagy ezek elegye jelenlétében. Társoldószerként használhatunk hexametil-foszfamidot (HMPA). A reakciót -78°C és 150°C , előnyösen -78°C és 30°C közötti hőmérsékleten hajthatjuk végre. A reakcióidő 3-12 óra.

Az (I) általános képletű vegyületet - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport - alkil-szulfonil-kloriddal vagy aril-szulfonil-kloriddal, például metánszulfonil-kloriddal, p-toluolszulfonil-kloriddal és hasonlóval reagáltatva, (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése alkil-szulfonil- vagy aril-szulfonil-csoport - vegyületté alakítjuk. A reakciót kloroformban, diklór-metánban, tetrahidrofuránban, dioxánban és hasonlóban vagy ezek elegyében hajthatjuk végre. A reakciónál használt bázis lehet trietil-amin, diizopropil-etil-amin, nátrium-karbonát, kálium-karbonát és hasonló. A reakciót $0-50^{\circ}\text{C}$, előnyösen 0°C és szobahőmérséklet között hajtjuk végre. A reakcióidő 1-12 óra, előnyösen 1-4 óra. Az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése alkil-szulfonil- vagy aril-szulfonil-csoport - vegyületet nátrium-aziddal reagáltatva, (I) általános képletű vegyületté - ahol R^1 jelentése azidocsoport - alakítjuk át. A reakciónál használt oldószer lehet dimetil-formamid, dimetil-szulfoxid, metil-cianid és hasonló. A reakciót szobahőmérséklet és 120°C , előnyösen szobahőmérséklet és 80°C közötti hőmérsékleten végezzük. A reakcióidő 1-12 óra, előnyösen 1-4 óra.

Az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése azidocsoport - vegyületnek (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport - melyen belül R^4 jelentése hidrogénatom - vegyületté történő redukálását hidrogéngázban hajthatjuk végre katalizátor, például szilárd hordozón, mint amilyen az aktívszén, alumínium-oxid, azbeszt és hasonló, lévő katalizátor, például Ru, Pd, Rh, Pt vagy Ni jelenlétében. A redukció oldószere lehet például dioxán, ecetsav, etil-acetát, THF, alkohol, mint ami-

lyen a metanol, etanol és hasonló. A reakciót 25°C és 60°C közötti, előnyösen szobahőmérsékleten hajtjuk végre. A reakcióidő 2-48 óra. A redukciót végezhetjük trifenil-foszfinnal (PPh_3) is vízben.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja egy másik eljárást nyújt az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport és a többi jelölés jelentése azonos a fenti meghatározásokkal - vegyület előállítására, mely szerint:

- (i) a (VI) általános képletű - ahol valamennyi jelölés jelentése azonos a fenti meghatározásokkal - vegyületet a (IX) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport - vegyülettel reagáltatjuk, a (X) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve; és
- (ii) a (X) általános képletű vegyületet alkalmas karbonilező szerrel karbonilezzük, az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport és az összes többi jelölés jelentése a fentiekben meghatározott - vegyülethez jutva.

A fentiekben meghatározott (VI) általános képletű vegyületnek a fentiekben meghatározott (IX) általános képletű vegyülettel történő reakcióját végezhetjük bázis, például kálium-karbonát, nátrium-hidrid, kálium-terc-butoxid és hasonló vagy ezek keveréke, jelenlétében vagy távollétében. A reakciót végrehajthatjuk oldószerben, például dimetil-formamidban, toluolban, tetrahidrofuránban, acetonitrilben és hasonlóban vagy ezek elegyében. A reakciót végezhetjük Lewis-sav jelenlétében is, ami lehet például bór-trifluorid-dietil-éterát ($\text{BF}_3 \cdot \text{OEt}_2$), cink-klorid, titán(IV)-izopropoxid ($\text{Ti}(\text{OiPr})_4$), lantanid fémkomplex és hasonló, DCE, DMF, THF és hasonló vagy ezek elegyének jelenlétében. A reakcióhőmérséklet 0-120°C, előnyösen 0-100°C. A reakcióidő 3-24 óra, előnyösen 4-12 óra.

A (X) általános képletű vegyületnek (I) általános képletű vegyületté történő átalakításánál használt alkilezőszer lehet például dialkil-karbonát, dihalogén-karbonil,



1,1'-karbonil-diimidazol és hasonló bázis jelenlétében vagy anélkül. A bázis lehet trietil-amin, tributil-amin, diizopropil-etil-amin, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]oktán (DABCO), 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undek-7-én (DBU), 1,1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-én (DBN), alkoxid, mint amilyen a nátrium-metoxid, nátrium-etoxid és hasonló vagy szervesetlen bázis, például nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid és hasonló. A reakciót végezhetjük oldószerben, mint amilyen a diklór-metán, THF, DMF, etil-acetát és hasonló vagy ezek elegye. A reakció hőmérsékleten -20°C és 135°C közötti, előnyösen $15-80^{\circ}\text{C}$ tartományba esik. A reakcióidő 2-72 óra, előnyösen 2-50 óra.

A jelen találmány egy további megvalósítási módja eljárást nyújt az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése azidocsoport és az összes többi jelölés jelentése azonos a fentebbi meghatározásokkal - vegyület előállítására, mely az alábbi lépésekből áll:

(i) a (VII) általános képletű - ahol R^c jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport, például metil-, etil-, propil-, benzil-, allilcsoport és hasonló, a többi jelölés jelentése azonos a fenti meghatározásokkal - vegyületet (XI) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport, például halogénatom, alkoxi-, szulfonilcsoport és hasonló -vegyülettel reagáltatjuk, a (XII) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve;

(ii) a fentiekben meghatározott (XII) általános képletű vegyületet (XIII) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületté alakítjuk; és

(iii) a fentiekben meghatározott (XIII) általános képletű vegyületet szerves vagy szervesetlen aziddal reagáltatva, (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése azidocsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületté alakítjuk.

A (VII) általános képletű vegyületnek (XI) általános képletű vegyülettel való reakcióját bázis, például nátrium-hidrid, kálium-hidrid, kálium-karbonát, kálium-terc-

-butoxid, lítium-diizopropil-amid (LDA), nátrium-metoxid jelenlétében, transzfer katalizátorral, mint amilyen a tetrabutyl-ammónium-halogenid és hasonló, hajtjuk végre. A reakciót végezhetjük alkalmas oldószer, például THF, DMF, DMSO, benzol és hasonló vagy ezek elegye jelenlétében. A reakcióhőmérséklet -78°C és 120°C közé, előnyösen -78°C és 60°C közé esik. A reakcióidő 2-20 óra, előnyösen 4-10 óra.

A (XII) általános képletű vegyületnek a (XIII) általános képletű vegyületté való átalakítását olyan reagensek jelenlétében hajtjuk végre, mint a jód, kálium-jodid vagy nátrium-jodid. A reakció oldószere lehet kloroform, diklór-metán, THF, DMF, DMSO, acetonitril és hasonló vagy ezek elegye. A reakciót $0-100^{\circ}\text{C}$ hőmérsékleten, előnyösen szobahőmérsékleten hajtjuk végre. A reakcióidő 2-24 óra, előnyösen 2-12 óra.

A (XIII) általános képletű vegyületnek (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése azidocsoport - vegyületté történő átalakítását egy vagy több egyenértéknyi mennyiségű fémazid, például lítium-azid, nátrium-azid vagy trialkil-szilazid jelenlétében végezzük. A reakcióhoz használhatunk oldószert, például THF-et, acetont, DMF-et, DMSO-t és hasonlókat vagy ezek elegyét. A reakciót végezhetjük közömbös gáztérben, ami lehet nitrogén-gáz vagy argongáz. A reakció hőmérséklete szobahőmérséklet és a reakcióelegy forráspontja közé eshet, előnyös az $50-80^{\circ}\text{C}$ hőmérséklet. A reakcióidő 0,5-8 óra, előnyösen 1-4 óra.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja eljárást nyújt az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport és a többi jelölés jelentése azonos a korábbi meghatározásokkal - vegyület előállítására, mely az alábbi lépésekből áll:

(i) a (VII) általános képletű - ahol valamennyi jelölés jelentése azonos a korábbi meghatározásokkal - vegyületet (XIV) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport, például halogénatom, alkoxi-, szulfonilcsoport és hasonló - vegyülettel reagáltat-



juk a (XV) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a korábbi meghatározásokkal - vegyületet nyerve;

(ii) a (XV) általános képletű vegyület acetonid részét a szokásos módszerekkel hidrolizáljuk, a (XVI) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyülethez jutva;

(iii) a (XVI) általános képletű vegyületet bázissal vagy anélkül gyűrűvé zárjuk, megkapva az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport és a többi jelölés a fentiekben meghatározott - vegyületet.

A (VII) általános képletű vegyületnek (XIV) általános képletű vegyülettel történő, (XV) általános képletű vegyületet eredményező reakcióját bázis jelenlétében végezhetjük. Az alkalmazott bázis lehet kálium-karbonát, nátrium-hidrid, kálium-terc-butoxid, LDA és hasonló. A reakciót végezhetjük oldószer jelenlétében, ami lehet DMF, THF, DMSO, etanol és hasonló. A reakciót -72°C és 120°C közötti, előnyösen -78°C és 100°C közötti hőmérsékleten hajthatjuk végre. A reakcióidő 2-24 óra, előnyösen 2-20 óra között változhat.

A (XV) általános képletű vegyületnek (XVI) általános képletű vegyületet eredményező hidrolízisét végezhetjük híg ásványi savval, például sósavval, kénsavval, stb., szerves savval, például vizes ecetsavval, p-toluolszulfonsavval, kámforszulfonsavval, trifluor-ecetsavval és hasonlóval. A reakciót végezhetjük alkalmas oldószer, például víz, metanol, THF, dioxán és hasonló vagy ezek elegye jelenlétében. A reakciót $30-100^{\circ}\text{C}$, előnyösen $30-60^{\circ}\text{C}$ hőmérsékleten hajthatjuk végre. A reakcióidő 10 perc és 5 óra között, előnyösen 0,5-2,5 óra között változhat.

A (XVI) általános képletű vegyületnek (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport - vegyületté való átalakításához használt bázis lehet nátrium-metoxid, kálium-karbonát, nátrium-hidrid és hasonló, az oldószer lehet metanol, DMF, THF és

használó. A reakcióhőmérséklet szobahőmérséklet és 150°C közötti, a reakcióidő 2-4 óra.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja eljárást nyújt az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése azidocsoport és a többi jelölés a fentiekben meghatározott - vegyület további előállítására, mely az alábbi lépésekből áll:

- (i) a (VII) általános képletű - ahol valamennyi jelölés a fentiekben meghatározott - vegyületet (XVII) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport, például halogénatom, alkoxi-, szulfonilcsoport és hasonló - vegyülettel reagáltatjuk, a (XVIII) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve; és
- (ii) a fentiekben meghatározott (XVIII) általános képletű vegyületet szerves vagy szervetlen aziddal reagáltatva, az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése azidocsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve.

A fentiekben meghatározott (XVII) általános képletű vegyülettel történő reagáltatást bázis, például nátrium-hidrid, nátrium-metoxi, kálium-karbonát, n-butil-lítium, LDA és hasonló jelenlétében végezzük. A reakciót végezhetjük oldószer jelenlétében, ami lehet DMF, THF, DMSO, benzol és hasonló vagy ezek elegyei. A reakciót -78°C és 70°C, előnyösen -78°C és 50°C közötti hőmérsékleten hajthatjuk végre. A reakcióidő 1-15 óra, előnyösen 1-10 óra.

A (XVIII) általános képletű vegyület (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése azidocsoport - vegyületté való átalakítását egy vagy több egyenértéknyi fémazid, például lítium-azid, nátrium-azid vagy trialkil-szilil-azid jelenlétében végezhetjük. A reakcióhoz használt oldószer lehet THF, aceton, DMF, DMSO vagy hasonló vagy ezek elegyei. A reakciót végezhetjük közömbös gáztérben, például nitrogén- vagy argon-

gázban. A reakciót a környezeti hőmérséklet és az oldószer forráspontja közötti hőmérsékleten, előnyösen 5-80°C hőmérsékleten hajthatjuk végre. A reakcióidő 0,5-18 óra, előnyösen 1-4 óra.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja egy másik eljárást nyújt az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése acetylcsoporthoz és a többi jelölés jelentése azonos a fentebbi meghatározásokkal vegyület előállítására, ami az alábbi lépésekből áll:

(i) a (VII) általános képletű - ahol valamennyi jelölés a fentiekben meghatározott - vegyületet a (XIX) általános képletű vegyülettel reagáltatjuk az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése acetylcsoporthoz; és Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyület nyerve.

A fentiekben meghatározott (VII) általános képletű vegyületet a (XIX) általános képletű vegyülettel bázis, például nátrium-hidrid, LDA, BuLi és hasonló jelenlétében reagáltatjuk. A reakciót -78°C és 100°C, előnyösen -78°C és 80°C közötti hőmérsékleten hajthatjuk végre. A reakcióidő 3-10 óra.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja eljárást nyújt az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 , melyen belül R^4 jelentése formilcsoport - vegyület előállítására (I) általános képletű vegyületből, ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése hidrogénatom. Az átalakítást alkil-formiát, például metil-formiát, etil-formiát és hasonló jelenlétében végezzük. A reakcióidő 4-48 óra, előnyösen 12-24 óra. A reakciót 60-120°C hőmérsékleten, előnyösen a reakcióelegy forráspontján hajtjuk végre.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja eljárást nyújt az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése

-C(=O)R^{4a} általános képletű csoport, ahol R^{4a} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 2-6 szénatomos alkenil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, aril-oxi-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-, aril-oxi-karbonil- vagy 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport - vegyület előállítására, mely eljárás az (I) általános képletű vegyületből indul ki, ahol R¹ jelentése NHR⁴ általános képletű csoport, melyen belül R⁴ jelentése hidrogénatom és a többi jelölés a fentiekben meghatározott.

Az (I) általános képletű vegyületet, ahol R¹ jelentése NHR⁴ általános képletű csoport, melyen belül R⁴ jelentése -C(=O)R^{4a} általános képletű csoport, ahol R^{4a} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 2-6 szénatomos alkenil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, aril-oxi-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-, aril-oxi-karbonil- vagy 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, az (I) általános képletű vegyületből állítjuk elő, ahol R¹ jelentése NHR⁴ általános képletű csoport, melyen belül R⁴ jelentése hidrogénatom. Ez utóbbi vegyületet a megfelelő halogeniddel, például acetyl-kloriddal, propionil-kloriddal és hasonlóval; alkil-klór-formiáttal, például metil-klór-formiáttal, etil-klór-formiáttal és hasonlóval, aralkil-klór-formiáttal, például benzil-klór-formiáttal és hasonlóval reagáltatjuk. A reakciót végezhetjük oldószer jelenlétében, ami lehet dikórmetán, kloroform, toluol, THF és hasonló vagy ezek elegyei. A reakciót végezhetjük bázis jelenlétében, ami lehet trietil-amin, diizopropil-etil-amin, kálium-karbonátm, nátrium-hidrid, kálium-terc-butoxid és hasonlók. A reakciót -20°C és 60°C, előnyösen 0°C és szobahőmérséklet között hajtjuk végre. A reakcióidő 1-12 óra, előnyösen 1-4 óra.

Ettől eltérő módon az (I) általános képletű vegyület - ahol R¹ jelentése NHR⁴ általános képletű csoport, melyen belül R⁴ jelentése acetyl-csoport - előállítható úgy is, hogy az (I) általános képletű - ahol R¹ jelentése azidocsoport - vegyületet tioecetsavval reagáltatjuk.

Az (I) általános képletű vegyület, ahol R^1 jelentése azidocsoport, tioecetsavval átalakítható (I) általános képletű vegyületté, ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése acetyl csoport. A reakció végezhető oldószer nélkül vagy oldószerben, ami lehet THF, DMF, toluol vagy hasonló. A reakciót 25-40°C között, előnyösen szobahőmérsékleten végezzük. A reakcióidő 3-24 óra, előnyösen 4-12 óra.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja eljárást nyújt az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése $-C(=S)-R^{4b}$ általános képletű csoport, ahol R^{4b} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, $C(=O)-(1-6 \text{ szénatomos})$ alkoxi, $-C(=O)$ aril-oxi, $-C(=S)-(1-6 \text{ szénatomos})$ alkil vagy $-C(=S)$ -aril általános képletű csoport - vegyület (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése $-C(=O)R^{4b}$ általános képletű csoport, ahol R^{4b} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, $C(=O)-(1-6 \text{ szénatomos})$ alkoxi, $-C(=O)$ -aril-oxi, $-C(=S)-(1-6 \text{ szénatomos})$ alkil vagy $-C(=S)$ -aril általános képletű csoport; a több jelölés a fentiekben meghatározott - vegyületből történő előállítására.

Az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése $-C(=O)-R^{4b}$ általános képletű csoport, ahol R^{4b} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, $C(=O)-(1-6 \text{ szénatomos})$ alkoxi, $-C(=O)$ aril-oxi, $-C(=S)-(1-6 \text{ szénatomos})$ alkil vagy $-C(=S)$ -aril általános képletű csoport - vegyületet (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése $-C(=S)-R^{4b}$ általános képletű csoport, ahol R^{4b} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, $C(=O)-(1-6 \text{ szénatomos})$ alkoxi, $-C(=O)$ aril-oxi, $-C(=S)-(1-6 \text{ szénatomos})$ alkil vagy $-C(=S)$ -aril általános képletű csoport - vegyületté úgy alakíthatjuk, hogy az amidot és a Lawesson-féle

reagenst [2,4-bisz(metoxi-fenil)-1,3-ditia-2,4-difoszfetán-2,4-diszulfid] vízmentes dioxánban, toluolban, THF-ban, DMF-ben vagy hasonlóban reagáltatjuk. A reakciót szobahőmérséklet és 130°C közötti, előnyösen 55-90°C hőmérsékleten hajthatjuk végre. A reakcióidő 3-24 óra, előnyösen 3-10 óra lehet.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja eljárást nyújt az (I) általános képletű - ahol R^4 jelentése $-C(=S)-SR^{4c}$ általános képletű csoport, melyen belül R^{4c} jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport - vegyületnek (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése hidrogénatom, és a többi jelölés jelentése azonos a fentebbi meghatározásokkal - vegyületből történő előállítására.

Az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése $C(=S)-SR^{4c}$ általános képletű csoport, ahol R^{4c} jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport - vegyületet az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 , melyen belül R^4 jelentése hidrogénatom - vegyületből állítjuk elő, bázis jelenlétében szén-diszulfiddal, majd megfelelő alkilhalogeniddal, például metil-jodiddal, etil-bromiddal, propil-bromiddal és hasonlóval reagáltatva. A bázis lehet trietil-amin, diizopropil-etil-amin, kálium-karbonát, nátrium-hidrid, kálium-terc-butoxid és hasonló. A reakciót végezhetjük oldószer jelenlétében, ami lehet víz, etanol, metanol, izopropanol, acetonitril és hasonló vagy ezek elegye. A reakciót szobahőmérséklet és 60°C közötti hőmérsékleten, előnyösen szobahőmérsékleten hajthatjuk végre. A reakcióidő 6-24 óra.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja eljárást nyújt az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 , melyen belül R^4 jelentése $-C(=S)-OR^{4d}$, ahol R^{4d} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, $-C(=O)-(1-6$ szénatomos)alkil általános képletű csoport, fluoratómmal helyettesítve; aril-, halogénezett,

1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil- vagy 2-6 szénatomos alkenilcsoport - vegyület előállítására, ami a következő lépésekből áll:

(i) az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése hidrogénatom - vegyületet (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése izotiocianátcsoport és az összes többi jelölés a fentiekben meghatározott - vegyületté alakítjuk;

(ii) az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése izotiocianátcsoport - vegyületet (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 , melyen belül R^4 jelentése $-C(=S)-OR^{4d}$, ahol R^{4d} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, $-C(=O)-(1-6$ szénatomos)alkil általános képletű csoport, fluoratómmal helyettesítve; aril-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil- vagy 2-6 szénatomos alkenilcsoport és az összes többi jelölés a fentiekben meghatározott - vegyületté alakítjuk.

Az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése izotiocianátcsoport - vegyületet (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése hidrogénatom - vegyületből állítjuk elő tiofoszfénnel bázis, például trietil-amin, kálium-karbonát, nátrium-hidroxid és hasonló jelenlétében. A reakciót végezhetjük oldószer, például etanol, metanol, izopropanol, diklór-metán, acetonitril és hasonló jelenlétében 0-60°C közötti hőmérsékleten, előnyösen 0°C-on. A reakciót végrehajthatjuk közömbös gáztérben, argongázt vagy más közömbös gázt használva. A reakcióidő 3-24 óra.

Az (I) általános képletű - ahol - ahol R^1 jelentése NHR^4 , melyen belül R^4 jelentése $-C(=S)-OR^{4d}$, ahol R^{4d} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, $-C(=O)-(1-6$ szénatomos)alkil általános képletű csoport, fluoratómmal

helyettesítve; aril-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil- vagy 2-6 szénatomos alkenilcsoport - vegyületet az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése izotiocianátcsoport - vegyületből állítjuk elő a megfelelő alkohol, például metanol, etanol, propanol, ciklohexanol és hasonló felhasználásával bázis, például nátrium-hidrid, kálium-hidrid és hasonló jelenlétében. A reakciót végezhetjük oldószer, például THF, toluol, DMF és hasonló jelenlétében szobahőmérséklet és 130°C közötti hőmérsékleten, előnyösen az alkalmazott oldószer forráspontján visszafolyató hűtő alatt. A reakcióidő 6-24 óra.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja eljárást nyújt az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése - $\text{C}(=\text{S})\text{-N}(\text{R}'\text{R}'')$ általános képletű csoport, ahol R' jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, helyettesített vagy helyettesítetlen aralkil-, heteroaralkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-csoport; R'' jelentése hidrogénatom vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport; vagy az R' és R'' együtt egy vagy két heteroatomot tartalmazó, 5- vagy 6 tagú gyűrűs csoportot alkot - vegyület előállítására az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése izotiocianátcsoport, az összes többi jelölés a fentiekben meghatározott - vegyületből.

Az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése $\text{-C}(=\text{S})\text{-N}(\text{R}'\text{R}'')$ általános képletű csoport, ahol R' és R'' jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom - vegyületet úgy állítjuk elő, hogy az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése izotiocianátcsoport - vegyület oldatán, ahol az oldószer THF, toluol vagy hasonló, ammóniagázt vezetünk át. A reakciót -10°C és szobahőmérsékleten között, előnyösen -10°C hőmérsékleten hajtjuk végre. A reakcióidő 20 perc és 4 óra között változhat, előnyösen 30 perc.

Az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése $-C(=S)-N(R'R'')$ általános képletű csoport, ahol R' jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, helyettesített vagy helyettesítetlen aralkil-, heteroaralkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-csoport; R'' jelentése hidrogénatom vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport; vagy R' és R'' együtt egy vagy két heteroatomot tartalmazó, 5- vagy 6-tagú gyűrűs szerkezetet alkot - vegyületet úgy állítjuk elő, hogy az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése izotiocianátcsoport - vegyületet a megfelelő aminnal, például metil-aminnal, etil-aminnal, dimetil-aminnal, dietil-aminnal, benzil-aminnal, anilinnel, prolinnal, morfolinnal, tiomorfolinnal, piridil-metil-aminnal és hasonlókkal reagáltatjuk oldószer, például THF, DMF, toluol és hasonló jelenlétében. A reakciót szobahőmérséklete és 140°C közötti, előnyösen $60-100^\circ\text{C}$ közötti hőmérsékleten végezzük. A reakcióidő 1-24 óra, előnyösen 4-12 óra.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja eljárás nyújt az (I) általános képletű - ahol Z jelentése NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom; Y^1 jelentése $=O$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom - vegyület előállítására (I) általános képletű - ahol Z jelentése NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidroxilcsoporttal helyettesített, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Y^1 jelentése $=O$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom; és az összes többi jelölés jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületből.

Az (I) általános képletű - ahol Z jelentése NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^6 jelentése hidrogénatom; Y^1 jelentése $=O$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom - vegyületet az (I) általános képletű - ahol Z jelentése NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése α -

-helyzetben hidroxilcsoporttal helyettesített 1-6 szénatomos alkilcsoport; Y^1 jelentése $=O$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom - vegyületből állíthatjuk elő, bázissal reagáltatva, ami lehet például trietil-amin, diizopropil-amin, diizopropil-etil-amin, piridin, piperidin, 4-dimetil-amino-piridin (DMAP), 1,8 diazabicyclo[5.4.0]undec-7-én (DBU), lítium-diizopropil-amid (LDA), kálium-bisz(trimetil-szilil)-amid, butil-lítium, nátrium-karbonát, kálium-karbonát, nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid, nátrium-metoxid, nátrium-etoxid, nátrium-izopropoxid, kálium-terc-butoxid, nátrium-hidrid, kálium-hidrid és hasonló. A reakcióhoz használt oldószer lehet THF, dietil-éter, dioxán, toluol, benzol, DMF, DMSO, metil-cianid és hasonló. A reakciót $-20^{\circ}C$ és $150^{\circ}C$ közötti hőmérsékleten, előnyösen $-10^{\circ}C$ és $100^{\circ}C$ közötti hőmérsékleten hajtjuk végre. A reakcióidő 0,2-64 óra, előnyösen 1-48 óra.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja eljárást nyújt az (I) általános képletű - ahol Z jelentése NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy aralkilcsoport; Y^1 jelentése $=O$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom - vegyület (I) általános képletű - ahol Z jelentése NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom; Y^1 jelentése $=O$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom; az összes többi jelölés a fentiekben meghatározott - vegyületből történő előállítására.

Az (I) általános képletű - ahol Z jelentése NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy aralkilcsoport; Y^1 jelentése $=O$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom - vegyületet az (I) általános képletű - ahol Z jelentése NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom; Y^1 jelentése $=O$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom - vegyületből állíthat-

juk elő bázis, például trietil-amin, diizopropil-amin, diizopropil-etil-amin, piridin, piperidin, DMAP, 1,8 diazabiciklo[5.4.0]undec-7-pn (DBU), lítium-diizopropil-amid (LDA), kálium-bisz(trimetil-szilil)amid, butil-lítium, nátrium-karbonát, kálium-karbonát, nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid, nátrium-metoxid, nátrium-etoxid, nátrium-izopropoxid, kálium-terc-butoxid, nátrium-hidrid, kálium-hidrid és hasonló jelenlétében alkil-halogeniddel, például metil-jodiddal, metoxi-metil-kloriddal, allil-bromiddal, benzil-bromiddal és hasonlóval reagáltatva. A reakciót -5°C és 150°C közötti hőmérsékleten, előnyösen 0°C és a forráspont közötti hőmérsékleten hajtjuk végre. A reakcióidő 0,2-48 óra, előnyösen 0,5-24 óra.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja eljárást nyújt az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése halogénatom - előállítására az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport és az összes többi jelölés a fentiekben meghatározott - vegyületből történő előállítására.

Az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése halogénatom - vegyület előállításánál az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport - vegyületet tetrahalogénmetánnal, például tetrabrom-metánnal, tetraklór-metánnal vagy hasonlóval reagáltatjuk trifenil-foszfín, trialkil-foszfín és hasonló jelenlétében. A reakciót végezhetjük oldószer, például vízmentes diklór-metán, kloroform, tetraklór-metán, benzol, DMF, DMSO, THF és hasonló jelenlétében. A reakciót $0-60^{\circ}\text{C}$ hőmérsékleten, előnyösen szobahőmérsékleten hajthatjuk végre. A reakcióidő 2-24 óra, előnyösen 8-13 óra.

A jelen találmány egy további megvalósítási módja eljárást nyújt az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése SH képletű csoport - vegyület (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése halogénatom és az összes további jelölés a fentiekben meghatározott - vegyületből történő előállítására, mely az alábbi lépésekből áll:

- (i) az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése halogénatom - vegyületet bázissal és tioecetsavval reagáltatjuk a (XX) általános képletű vegyületet nyerve, ahol valamennyi jelölés a fentiekben meghatározott;
- (ii) a (XX) általános képletű vegyületet bázissal reagáltatva, megkapjuk az (I) általános képletű vegyületet, ahol R^1 jelentése SH képletű csoport és az összes többi jelölés jelentése azonos a fentebbi meghatározásokkal.

A (XX) általános képletű vegyületnek (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport - vegyületből történő előállításához tioecetsavat használunk bázis, például trietil-amin, diizopropil-amin, diizopropil-etil-amin, piridin, piperidin, DMAP, 1,8 diazabiciklo[5.4.0]undec-7-én (DBU), lítium-diizopropil-amid (LDA), kálium-bisz(trimetil-szilil)amid, butil-lítium, nátrium-karbonát, kálium-karbonát, nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid, nátrium-metoxid, nátrium-etoxid, nátrium-izopropoxid, kálium-terc-butoxid, nátrium-hidrid, kálium-hidrid és hasonló jelenlétében. A reakcióhoz használt oldószer lehet THF, benzol, dioxán és hasonló. A reakciót szobahőmérséklet és az elegy forráspontja közötti hőmérsékleten hajthatjuk végre. A reakcióidő 2-24 óra, előnyösen 6 óra.

Az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése SH képletű csoport - vegyületet a (XX) általános képletű képletű vegyületnek bázissal, például kálium-karbonáttal, nátrium-hidroxiddal, kálium-hidroxiddal, butil-lítiummal és hasonlóval való reagáltatásával állítjuk elő. A reakciót szobahőmérséklet és az elegy forráspontja közötti hőmérsékleten hajthatjuk végre. A reakcióidő 1-24 óra.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja új, (VII) általános képletű köztesanyaggal szolgál, ahol az általános képletben R^c jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport, például metil-, etil-, propil-, benzil-, allilcsoport és hasonló; R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogéne-

zett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyeken belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Z jelentése kén-, oxigénatom, $=\text{CH}$ képletű vagy NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport; Y^1 jelentése $=\text{O}$ vagy $=\text{S}$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, aminocsoport, $=\text{O}$, $=\text{S}$ képletű csoport, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; Y^2 és Y^3 ha szomszédos szénatomon helyezkednek el, együtt alkothatnak helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmazva.

A (VII) általános képletű új köztesanyagot az alábbi lépéseken keresztül állíthatjuk elő:

(i) a (III) általános képletű - ahol minden jelölés a fentiekben meghatározott - vegyületet (IV) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport, például halogénatom, alkoxi-, szulfonilcsoport és hasonló; R^2 és R^3 jelentése a korábbiakban meghatározott -

vegyülettel reagáltatjuk az (V) általános képletű - ahol Y^1, Y^2, Y^3, R^2, R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve;

(ii) az (V) általános képletű vegyületet redukáljuk, a (VI) általános képletű - ahol Y^1, Y^2, Y^3, R^2, R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve;

(iii) a (VI) általános képletű vegyületet alkil-klór-formiáttal reagáltatjuk, a (VII) általános képletű - ahol $R^c, Y^1, Y^2, Y^3, R^2, R^3$ és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve.

Az (V) általános képletű vegyületnek (III) és (IV) általános képletű vegyületekből való előállítását bázis jelenlétében végezhetjük, ami lehet kálium-hidroxid, nátrium-hidroxid, kálium-karbonát, nátrium-hidrid, kálium-hidrid, trietil-amin, diizopropil-etil-amin és hasonló. A reakciót végezhetjük oldószer felhasználásával, ami lehet DMSO, DMF, THF, acetonitril, kloroform vagy hasonló vagy ezek elegyei. A reakciót végrehajthatjuk közömbös gáztérben, például nitrogéngázban vagy argongázban. A reakció hőmérséklete $20-100^\circ\text{C}$, előnyösen környezeti hőmérséklet és 80°C közötti. A reakcióidő 1-15 óra, előnyösen 6-12 óra.

Az (V) általános képletű vegyület (VI) általános képletű vegyületté történő redukcióját hidrogéngázzal végezhetjük katalizátor jelenlétében, ami lehet szénen, alumínium-oxidon, azbeszten és hasonló szilárd hordozón lévő rubídium, palládium, ródi-um, platina vagy nikkel. A redukció történhet oldószer jelenlétében, ami lehet dioxán, ecetsav, etil-acetát, THF, alkohol, például metanol, etanol és hasonló vagy ezek elegyei. Az alkalmazott nyomás légköri és 60 psi közötti. A reakciót $25-60^\circ\text{C}$ hőmérsékleten, előnyösen szobahőmérsékleten végezhetjük. A reakcióidő 2-48 óra. A redukciót végezhetjük ásványi savban lévő fémmel is, például ón/sósav, vas/sósav, cink/sósav, cink/ecetsav és hasonló kombinációkkal.

A (VI) általános képletű vegyületnek (VII) általános képletű vegyületté történő átalakítását végezhetjük alkil-klór-formiáttal, például metil-klór-formiáttal, etil-klór-formiáttal, propil-klór-formiáttal, benzil-klór-formiáttal és hasonlóval. A reakció oldószere lehet víz, aceton, THF, acetonitril, diklór-metán (DCM) és hasonló vagy ezek elegyei. A reakciót bázis, például kálium-karbonát, nátrium-karbonát, nátrium-hidrid, kálium-hidroxid, trietil-amin és hasonló jelenlétében hajthatjuk végre. A reakciót 0-60°C közötti, előnyösen 0°C és szobahőmérséklet közötti hőmérsékleten végezhetjük. A reakcióidő 1-12 óra, előnyösen 1-4 óra.

A jelen találmány egy további megvalósítási módja, (VI) általános képletű új köztesanyaggal szolgál, ahol az általános képletben R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyeken belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Z jelentése kén-, oxigénatom, =CH képletű vagy NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport; Y^1 jelentése =O vagy =S képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, aminocsoport, =O, =S képletű csoport, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos

amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; Y^2 és Y^3 , ha szomszédos szénatomon helyezkednek el, együtt alkothatnak helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmazva.

A (VI) általános képletű új köztesanyagot az alábbi lépéseken keresztül állítjuk elő:

- (i) a (III) általános képletű - ahol minden jelölés jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet (IV) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport, például halogénatom, alkoxi-, szulfonilcsoport és hasonló; R^2 és R^3 jelentése a fentiekben meghatározott - vegyülettel reagáltatjuk az (V) általános képletű - ahol Y^1, Y^2, Y^3, R^2, R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve; és
- (ii) az (V) általános képletű vegyületet redukáljuk, a (VI) általános képletű - ahol Y^1, Y^2, Y^3, R^2, R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyülethez jutva.

A (III) és (IV) általános képletű vegyületeknek (V) általános képletű vegyületet eredményező reakcióját bázis, például kálium-hidroxid, nátrium-hidroxid, kálium-karbonát, nátrium-karbonát, nátrium-hidrid, kálium-hidrid, trietil-amin, diizopropil-etil-amin és hasonló jelenlétében hajtjuk végre. A reakcióhoz használhatunk oldószert, ami lehet DMSO, DMF, THF, acetonitril, kloroform és hasonló vagy ezek elegyei. A reakciót végezhetjük közömbös gáztérben, például nitrogéngázban vagy argongázban. A reakció hőmérséklete 20-100°C, előnyösen szobahőmérséklet és 80°C közötti. A reakcióidő 1-15 óra, előnyösen 6-12 óra.

Az (V) általános képletű vegyület (VI) általános képletű vegyületté történő redukcióját hidrogéngázzal végezhetjük katalizátor jelenlétében, ami lehet szénen, alu-

mínium-oxidon, azbeszten és hasonló szilárd hordozón lévő rubídium, palládium, ródium, platina vagy nikkel. A redukció történhet oldószer jelenlétében, ami lehet dioxán, ecetsav, etil-acetát, THF, alkohol, például metanol, etanol és hasonló vagy ezek elegyei. Az alkalmazott nyomás légköri és 60 psi közötti. A reakciót 25-60°C hőmérsékleten, előnyösen szobahőmérsékleten végezhetjük. A reakcióidő 2-48 óra. A redukciót végezhetjük ásványi savban lévő fémmel is, például ón/sósav, vas/sósav, cink/sósav, cink/ecetsav és hasonló kombinációkkal.

A jelen találmány további megvalósítási módja (X) általános képletű, új köztesanyaggal szolgál, ahol az általános képletben R^1 jelentése halogénatom, azido-, tioalkohol-, izotiocianátcsoporthoz, OR^4 , NHR^4 vagy $N(R^4)_2$ általános képletű csoport, ahol R^4 jelentése hidrogénatom vagy helyettesített vagy helyettesítetlen acil-, tioacil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, 3-6 szénatomos cikloalkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-karbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-karbonil-, aril-oxi-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-tiokarbonil-, aril-oxi-tiokarbonil-csoport, $-C(=O)-C(=O)$ -alkil, $-C(=O)-C(=O)$ -aril, $-C(=O)-C(=O)$ -alkoxi, $-C(=O)-C(=O)$ -aril-oxi, $-(C=S)-S$ -alkil, $-(C=S)-NH_2$, $-(C=S)-NH$ -alkil, $-(C=S)-N$ -(alkil) $_2$, $-(C=S)-NH$ -alkenil, $(C=S)-(C=O)$ -alkoxi, $(C=S)-(C=O)$ -aril-oxi, $-C(=S)-O-(C=O)$ -alkil, $-C(=S)-C(=S)$ -alkil, $-C(=S)-C(=S)$ -aril általános képletű csoport, tiomorfolinil-tiokarbonil- vagy pirrolidinil-tiokarbonil-csoport; R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyeken belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ képletű vagy NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szén-

atomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport; Y^1 jelentése =O vagy =S képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, aminocsoport, =O, =S képletű csoport, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; Y^2 és Y^3 , ha szomszédos szénatomon helyezkednek el, együtt alkothatnak helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmazva.

A (X) általános képletű új köztesanyagot az alábbi lépéseken keresztül állíthatjuk elő:

- (i) a (III) általános képletű vegyületet - ahol valamennyi jelölés a fentiekben meghatározott - a (IV) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport, például halogénatom, alkoxi-, szulfonilcsoport és hasonló; R^2 és R^3 jelentése a fentiekben meghatározott - vegyülettel reagáltatjuk, az (V) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve;
- (ii) az (V) általános képletű vegyületet (VI) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületté redukáljuk;



(iii) a (VI) általános képletű vegyületet a (IX) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 vagy $N(R^4)_2$ általános képletű csoport, ahol R^4 jelentése hidrogénatom vagy helyettesített vagy helyettesítetlen acil-, tioacil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, 3-6 szénatomos cikloalkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-karbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-karbonil-, aril-oxi-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-tiokarbonil-, aril-oxi-tiokarbonil-csoport, $-C(=O)-C(=O)$ -alkil, $-C(=O)-C(=O)$ -aril, $-C(=O)-C(=O)$ -alkoxi, $-C(=O)-C(=O)$ -aril-oxi, $-(C=S)-S$ -alkil, $-(C=S)-NH_2$, $-(C=S)-NH$ -alkil, $(C=S)-N$ -(alkil) $_2$, $-(C=S)-NH$ -alkenil, $(C=S)-(C=O)$ -alkoxi, $(C=S)-(C=O)$ -aril-oxi, $-C(=S)-O-(C=O)$ -alkil, $-C(=S)-C(=S)$ -alkil, $-C(=S)-C(=S)$ -aril általános képletű csoport, tiomorfolinil-tiokarbonil- vagy pirrolidinil-tiokarbonil-csoport -

vegyülettel reagáltatjuk, a (X) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve.

A (III) általános képletű és a (IV) általános képletű vegyületnek (V) általános képletű vegyületet eredményező reakcióját bázis, például kálium-hidroxid, nátrium-hidroxid, kálium-karbonát, nátrium-karbonát, nátrium-hidrid, kálium-hidrid, trietil-amin, diizopropil-etil-amin és hasonló jelenlétében hajthatjuk végre. A reakcióhoz használhatunk oldószert, például DMSO-t, DMF-t, THF-t, acetonitrilt, kloroformot és hasonlót vagy ezek elegyeit. A reakciót végezhetjük semleges gáztérben, például nitrogéngázban vagy argonágzban. A reakciót 20-100°C, előnyösen szobahőmérséklet és 80°C közötti hőmérsékleten hajthatjuk végre. A reakcióidő 1-15 óra, előnyösen 6-12 óra.

Az (V) általános képletű vegyület (VI) általános képletű vegyületté történő redukcióját hidrogéngázzal végezhetjük katalizátor jelenlétében, ami lehet szénen, alumínium-oxidon, azbeszten és hasonló szilárd hordozón lévő rubídium, palládium, ródi-um, platina vagy nikkel. A redukció történhet oldószer jelenlétében, ami lehet dioxán,

ecetsav, etil-acetát, THF, alkohol, például metanol, etanol és hasonló vagy ezek elegyei. Az alkalmazott nyomás légköri és 60 psi közötti. A reakciót 25-60°C hőmérsékleten, előnyösen szobahőmérsékleten végezhetjük. A reakcióidő 2-48 óra. A redukciót végezhetjük ásványi savban lévő fémmel is, például ón/sósav, vas/sósav, cink/sósav, cink/ecetsav és hasonló kombinációkkal.

A fentiekben meghatározott (VI) általános képletű vegyületnek a fentiekben meghatározott (IX) általános képletű vegyülettel való reakcióját bázis, például kálium-karbonát, nátrium-hidrid, kálium-terc-butoxid és hasonlóak jelenlétében vagy távollétében hajthatjuk végre. A reakciót végezhetjük oldószer, például toluol, DMF, THF, acetonitril jelenlétében. Ugyancsak végezhetjük a reakciót Lewis-sav jelenlétében is, DCE-ben, DMF-ben, THF-ban vagy hasonló oldószerben vagy ezek elegyében. A Lewis-sav lehet például bór-trifluorid-dietil-éterát, cink-klorid, titán(IV)-izopropoxid, lantanidfémkomplex és hasonló. A reakciót végezhetjük 0-120°C, előnyösen 0-100°C hőmérsékleten. A reakcióidő 3-24, előnyösen 4-12 óra.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja a (XVI) általános képletű, új köztesanyagot nyújtja, ahol az általános képletben R^c jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport, például metil-, etil-, propil-, benzil-, allilcsoport és hasonló; R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyeken belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Z jelentése kén-, oxigénatom, =CH képletű vagy NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-



csoport; Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, aminocsoport, $=O$, $=S$ képletű csoport, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; Y^2 és Y^3 , ha szomszédos szénatomon helyezkednek el, együtt alkothatnak helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmazva.

A (XVI) általános képletű új köztesanyagot az alábbi lépéseken keresztül állíthatjuk elő:

- (i) a (VII) általános képletű - ahol valamennyi jelölés jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet a (XIV) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport, például halogénatom, alkoxi-, szulfonilcsoport és hasonló - vegyülettel reagáltatjuk, a (XV) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve; és
- (ii) a (XV) általános képletű vegyület acetonidcsoportját a szokásos módszerekkel hidrolizáljuk, a (XVI) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyülethez jutva.

A (VII) általános képletű és a (XIX) általános képletű vegyületek (XV) általános képletű vegyületet eredményező reakcióját végezhetjük bázis jelenlétében, ami lehet

kálium-karbonát, nátrium-hidrid, kálium-terc-butoxid, LDA és hasonló. A reakció történhet oldószerben, például DMF-ban, THF-ban, DMSO-ban, etanolban és hasonlóban. A reakció hőmérséklete -78°C és 120°C , előnyösen -78°C és 100°C közötti lehet. A reakcióidő 2-24 óra, előnyösen 2-20 óra.

A (XV) általános képletű vegyületnek (XVI) általános képletű vegyületté történő hidrolízisét végezhetjük híg ásványi savval, ami lehet sósav, kénsav és hasonló, szerves savval, ami lehet vizes ecetsav, p-toluolszulfonsav, kámforszulfon-sav, trifluor-ecetsav és hasonló. A reakciót végezhetjük alkalmas oldószerben, például vízben, metanolban, THF-ban, dioxánban és hasonlóban vagy ezek elegyeibe. A reakció történhet $30-100^{\circ}\text{C}$, előnyösen $30-60^{\circ}\text{C}$ hőmérsékleten. A reakcióidő 10 perc és 5 óra, előnyösen 30 perc és 2,5 óra közötti.

A jelen találmány egy másik megvalósítási módja a (XVIII) általános képletű új köztesanyaggal szolgál, ahol az általános képletben R^{c} jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport, például metil-, etil-, propil-, benzil-, allilcsoport és hasonló; R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^{a} , NR^{a} , OR^{a} általános képletű csoport, melyeken belül R^{a} jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Z jelentése kén-, oxigénatom, $=\text{CH}$ képletű vagy NR^{b} általános képletű csoport, melyen belül R^{b} jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport; Y^1 jelentése $=\text{O}$ vagy $=\text{S}$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, aminocsoport, $=\text{O}$, $=\text{S}$ képletű csoport, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szén-

atomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; Y^2 és Y^3 , ha szomszédos szénatomon helyezkednek el, együtt alkothatnak helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmazva.

A (XVIII) általános képletű új köztesanyag előállításánál a (VII) általános képletű vegyületet - ahol a jelölések jelentése a fentiekben meghatározott - a (XVII) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport, például halogénatom, alkoxi-, szulfonilcsoport és hasonló - vegyülettel reagáltatjuk, a (XVIII) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve.

A fentiekben meghatározott (VII) általános képletű vegyületnek a fentiekben meghatározott (XVII) általános képletű képletű vegyülettel történő reagáltatását végezhetjük bázis, például nátrium-hidrid, nátrium-metoxid, kálium-karbonát, n-butil-lítium, LDA és hasonló jelenlétében. A reakcióhoz használhatunk oldószert, például DMF-t, THF-t, DMSO-t, benzolt és hasonlót vagy ezek elegyeit. A reakciót végezhetjük -78°C és 70°C , előnyösen -78°C és 50°C közötti hőmérsékleten. A reakcióidő 1-15 óra, előnyösen 1-10 óra.

Nyilvánvaló, hogy a fent említett reakciókban a vegyületek bármelyik reaktív csoportját a szokásos módon védhetjük. A hidroxilcsoport vagy a fenolos hidroxilcsoport alkalmas védőcsoportja lehet a terc-butil-dimetil-szilil-, metoxi-metil-,



trifenil-metil-, benzil-oxi-karbonil-, tetrahidropirán-csoport (THP), stb.; az amino- vagy anilincsoport védhető az N-terc-butoxi-karbonil(N-Boc), N-benzil-oxi-karbonil(N-Cbz), N-9-fluorenil-metoxi-karbonil(N-FMOC), benzofenonimin-, propargil-oxi-karbonil-csoporttal (POC), stb.; az aldehidcsoport acetálcsoportként, a ketoncsoport ketálcsoportként védhető. A védőcsoportok felhelyezése és eltávolítása a védendő molekulának megfelelő, szokásos módszerekkel történik.

Az enantiomerek előállításánál a reaktáns magában álló enantiomerjét használjuk, ahol az lehetséges, vagy a reakciót a reagensek vagy katalizátorok magában álló enantiomer alakjának jelenlétében hajtjuk végre. Az egyes enantiomerekhez hozzájuthatunk a racém keverék szokásos módszerekkel végrehajtott rezolválásával is. A jelen találmány részét képező vegyületek sztereoizomerjeit előállíthatjuk a reaktánsok önmagukban álló enantiomer alakjának felhasználásával, ahol az lehetséges, vagy a reakciót a reagensek vagy katalizátorok önmagában álló enantiomer alakjainak jelenlétében hajtjuk végre. A sztereoizomerek keverékének szokásos módon elvégzett rezolválása is elvégezhető. Az előnyös eljárások közé tartozik a mikrobiológiai rezolválás, a királis savakkal, például mandulasavval, kámforszulfonsavval, borkőssavval, tejsavval és hasonlókkal történő sóképzés; a királis bázisokkal, például brucinnal, cinkona-alkaloidokkal és származékaikkal és hasonlókkal történő sóképzés. Az általánosan alkalmazott módszerekkel foglalkoznak Jaques és munkatársai az „Enantiomers, Racemates and Resolution” című munkájukban (Wiley Interscience, 1981). Ahol arra lehetőség van, az (I) általános képletű vegyületek rezolválhatók királis aminosavakkal, aminosavakból származó aminoalkoholokkal reagáltatva; a savnak amiddá való átalakítására a szokásos reakciókörülményeket alkalmazhatjuk; a diasztereomereket frakcionált kristályosítással vagy kromatografálással



választhatjuk el, és az (I) általános képletű vegyületek sztereoizomerjeihez az amid tiszta diasztereomerjének hidrolízisével juthatunk.

A gyógyászati szempontból alkalmazható sók előállításánál az (I) általános képletű vegyületet oldószerben, például dietil-éterben, THF-ban, metanolban, terc-butanolban, dioxánban, izopropanolban, etanolban és hasonlóban 1-4 egyenértéktömegnyi bázissal, például nátrium-hidroxiddal, nátrium-metoxiddal, nátrium-hidriddel, kálium-terc-butoxiddal, kalcium-hidroxiddal, magnézium-hidroxiddal és hasonlókkal reagáltatjuk. Használhatunk oldószerkelegyeket is. Alkalmazhatunk szerves bázisokat is, mint amilyen a lizin, arginin, dietanol-amin, kolin, trometamin, quanidin, ezek származékai, stb. Ettől eltérő módon, ahol arra mód van, savaddíciós sókat is előállíthatunk savval, mint amilyen a sósav, bróm-hidrogénsav, salétromsav, kénsav, foszforsav, p-toluolszulfonsav, metánszulfonsav, ecetsav, citromsav, maleinsav, szalicilsav, hidrox-naftoesav, aszkorbinsav, palmitinsav, borostyánkősav, benzoésav, benzolszulfonsav, borkősav és hasonló. A reakcióhoz használt oldószer lehet az etil-acetát, dietil-éter, alkoholok, aceton, THF, dioxán, stb. Alkalmazhatunk oldószerkelegyeket is. Az aminosavakkal vagy más típusú vegyületekkel képzett sókat úgy állíthatjuk elő, hogy az (I) általános képletű vegyületet oldószerben, például alkoholban, ketonban, éterben és hasonlóban vagy ezek elegyeiben reagáltatjuk a megfelelő vegyülettel.

Az (I) általános képletű vegyület különféle polimorfjait - melyek részét képezik a jelen találmánynak - az (I) általános képletű vegyületnek különféle körülmények között végrehajtott kristályosításával állíthatjuk elő. Alkalmazhatunk például eltérő oldószerkeket vagy oldószerkelegyeket az átkristályosításhoz; végezhetjük a kristályosítást különféle hőmérsékleten, eltérő lehűtési körülmények között, a nagyon gyorstól a nagyon lassúig változtatva. A vegyület melegítését vagy megolvasztását követő fokozatos vagy



gyors lehűtéssel ugyancsak polimorfokhoz juthatunk. A polimorfok meglétét a szilárd állapotban végzett NMR, IR spektroszkópiával, differenciál letapogató kalorimetriával, por alakban felvett Röntgen-diffrakciós vizsgálatokkal és más technikákkal határozhatjuk meg.

A jelen találmány gyógyszerkészítményekkel is szolgál, melyek az (I) általános képletű vegyület, származékát, analógját, sztereoizomerjét, polimorfját, gyógyászati szempontból alkalmazható sóját, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátját, gyógyászati szempontból alkalmazható vivőanyag, hígító és hasonló kíséretében tartalmazzák. A jelen találmány szerinti gyógyszerkészítmények felhasználhatók bakteriális fertőzések kezelésére. Ugyancsak használhatók a több hatóanyaggal szemben ellenálló bakteriális fertőzések kezelésére is.

Az (I) általános képletű vegyület gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjának - melyek részét képezik a jelen találmánynak - előállításánál a szokásos eljárásokat alkalmazzuk, például az (I) általános képletű vegyületet oldószerben, például vízben, metanolban, etanolban, előnyösen vízben oldjuk és különféle kristályosítási technikákkal kikristályosítjuk őket.

A gyógyszerkészítmények a szokásos alakokban lehetnek, azaz készíthetünk tablettákat, kapszulákat, porokat, szirupokat, oldatokat, szuszpenziókat és hasonlókat. A készítmények tartalmazhatnak aromásítókat, édesítőket, stb. az alkalmas szilárd vagy folyékony vívő- vagy közeganyagban. A készítmény lehet injektálható steril oldat vagy szuszpenzió alakjában. Ezek a készítmények általában 1-20 %, előnyösen 1-10 % (tömeg) hatóanyagot tartalmaznak, a többi részt a gyógyászati szempontból alkalmazható vivőanyag, közeganyag vagy oldószer teszi ki.

Az alkalmas gyógyászati szempontból alkalmazható vivőanyagokhoz tartoznak a szilárd töltelékanyagok vagy hígítóanyagok és a steril vizes vagy szerves oldatok. A

gyógyszerkészítményben a hatóanyag olyan mennyiségben van, ami biztosítja a fentebb leírt dózistartományt. Orális alkalmazáshoz a vegyületeket alkalmas szilárd, folyékony vivőanyaggal vagy közeganyaggal kombináljuk kapszulát, tablettát, port, szirupot, oldatot, szuszpenziót és hasonló képezve. Ha szükséges, a készítmény további adalékanyagokat is tartalmazhat, például aromát, édesítőt, kötőanyagot és hasonlót. A parenterális bevitelhez a hatóanyagot injektálható oldatot vagy szuszpenziót képző steril vizes vagy szerves közeghez adjuk. Az oldat készülhet például szezám- vagy földimogyoró-olajban, vizes propilénglikolban; a vízoldékony sav- vagy bázisaddíciós sók vizes közegben. Az így készült injektálható oldatok beadhatók intravénásan, intraperitoneálisan, szubkután vagy - embernél előnyösen - intramuszkulárisan.

A jelen találmány szerinti gyógyszerkészítmények az (I) általános képletű vegyület mellett tartalmazhatnak még egy vagy több más ismert hatóanyagot is, vagy beadhatók ezekkel együtt. Ezeket a hatóanyagokat más, klinikailag alkalmazott antibakteriális ágensek közül választhatjuk ki, mint amilyenek a β -laktámok vagy az amino-glikozidok. Ide tartoznak a penicillinek, például az oxacillin flukloxacillin és karbapének, például a meropenem vagy imifenem. Ezzel szélesítjük a hatóanyagok terápiás hatását, például a meticillin-rezisztens *Staphylococcus*okra kiterjedően. A készítmények tartalmazhatnak még, vagy az (I) általános képletű vegyülettel beadhatunk még baktericid/permeabilitást fokozó proteint (BPI) vagy effluxpumpagátlókat, hogy ezzel javítsuk a gram-negatív baktériumokkal szembeni aktivitást és csökkentjük a baktériumok ellenállóképességét.

Az (I) általános képletű vegyületeket az emlősöknek, beleértve az embert, a klinikai alkalmazásnál bejuttathatjuk szájon át vagy parenterálisan. Az orális alkalmazás az előnyösebb és kényelmesebb, mivel elkerüljük az injekció okozta fájdalmat és irritációt. Abban az esetben azonban, amikor a beteg nem képes lenyelni a gyógyszert

vagy betegség vagy más ok miatt a szájon át bevett gyógyszer felszívódása rossz, fontos a gyógyszer parenterális alkalmazása. Bármelyik beviteli módnál a napi dózis 5-20 mg/testtömegkilogramm tartományba esik, ami beadható egyetlen vagy osztott adagban. Az optimális dozirozást természetesen egyénenként határozzuk meg, tekintettel a beteg reagálására. Általában az alacsonyabb dózisokkal kezdjük a kezelést és ezt követően emeljük a legkedvezőbb dózusra.

Az antibakteriális hatás in vivo adatai:

A minimális gátlási koncentráció (MIC) meghatározását táptalaj mikrohígítási technikával és az 5. kiadású Approved Standards, NCCLS document M7-A6 Vol 20 - No 2, 2000 (Villanova, PA) által leírt protokoll szerint határozzuk meg.

A vizsgálati vegyület kezdő törzsoldatát dimetil-szulfoxidban készítjük el. A következő kétszeres hígításokat steril Mueller Hinton Broth (Difco) (MHB) tápközzel hajtjuk végre.

A lefagyasztott tenyésztettel 250 ml Erlen-Meyer lombikokban lévő 50 ml steril MHB táptalajt oltunk be.

Az MHB összetétele:

2,0 g/l marhahúskivonat,

17,5 g/l savval lebontott kazein,

1,5 g/l oldható keményítő,

a készítmény végső kémhatása $\text{pH} = 7,3 \pm 0,1$ értékre beállítva.

A lombikokat 150 rpm körforgású rázógépen inkubáljuk 35°C hőmérsékleten 1-5 órán át. Az oltóanyag elkészítéséhez a tenyészetet steril MHB tápközzel hígítjuk 0,5 McFarland értékű zavarosodásig. Ez $1-2 \times 10^6$ CFU/ml értéknek felel meg. Az 1-10



vájatokba bemérünk 50 µl fenti hígított inokulumot. A lemezeket 37°C hőmérsékleten inkubáljuk egy éjszakán át.

A MIC értéként azt a legalacsonyabb koncentrációt adjuk meg, melynél a vizsgálati vegyület szabad szemmel megállapíthatóan teljes mértékben gátolja a mikroorganizmus növekedését.

A használt mikroorganizmusok:

mikroorganizmus	törzsszám	DRCC szám
Staphylococcus aureus	ATCC 33591	019
Staphylococcus aureus	ATCC 49951	213
Staphylococcus aureus	ATCC 29213	035
Enterococcus faecalis	ATCC 29212	034
Enterococcus faecalis	NCTC 12201	153
Enterococcus faecium	NCTC 12202	154
Escherichia coli	ATCC 25922	018

ATCC: American Type Culture Collection, USA

NCTC: National Collections of Type Cultures, Colindale, UK

DRCC: Dr. Reddy's Culture Collection, Hyderabad, India.

1. T á b l á z a t

A vegyületek in vitro aktivitása gram-pozitív és gram-negatív

baktériumokkal szemben

példa- szám	MIC (µl/ml)						
	Staphylococcus aureus			Enterococcus sp.			E.coli
	019 MRSA	213 Smith S	035 S	034 S	153 R	154 R	18 S
60.	0,8	4,0	8,0	16,0	8,0	8,0	32,0
82.	2,0	1,0	4,0	-	8,0	8,0	32,0



96.	2,0	2,0	4,0	4,0	4,0	4,0	>32,0
99.	2,0	2,0	4,0	4,0	8,0	8,0	32,0
108.	1,0	1,0	2,0	2,0	2,0	2,0	>32,0
109.	4,0	4,0	4,0	8,0	8,0	8,0	>32,0
119.	2,0	2,0	2,0	2,0	2,0	2,0	>32,0
120.	0,5	0,5	0,5	1,0	1,0	1,0	32,0
127.	2,0	4,0	4,0	8,0	4,0	4,0	32,0
130.	0,5	0,5	0,5	1,0	1,0	1,0	32,0
133.	2,0	4,0	4,0	4,0	4,0	8,0	32,0
144.	0,25	0,25	0,5	0,5	0,25	0,5	-
145.	0,25	0,25	0,5	0,5	0,25	0,5	-
147.	0,5	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0	-

Az elmondottak szemléltetésére az alábbiakban példákat adunk meg. A példák kizárólag szemléltető célzatúak, a találmány oltalmi körét nem korlátozzák.

Az 1-9. példa általános előállítási eljárása

A megfelelő nitrovegyületet, például 4-fluor-nitro-benzolt vagy hasonlót, két heteroatomot - ami lehet oxigén-, nitrogén- vagy kénatom - tartalmazó, =O vagy =S képletű csoporttal helyettesített öttagú heterociklusos csoportot tartalmazó vegyületet, ahol a heterociklusos gyűrű kondenzált lehet egy helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoporttal (1,1 egyenérték) és vízmentes kálium-karbonátot (2,0 egyenérték) vízmentes dimetil-formamidban kevertetünk 0-100°C hőmérsékleten (a szubsztráttól függően) egy éjszakán át. A reakciókeverékhez hideg vizet adunk, és a keletkezett szilárd anyagot kiszűrjük. A kiszűrt anyagot megszáritva, hozzájutunk a tiszta vegyülethez. Hozam: 50-85 %-os.

1. példa

(1) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,25 d, $J = 9,2$ Hz, 2H), 7,72 (d, $J = 9,2$ Hz, 2H), 4,57 (t, $J = 7,3$ Hz, 2H), 4,18 (t, $J = 7,3$ Hz, 2H). TS (CI módszer): 209.

2. példa

(2) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,12-7,93 (m, 3H), 4,56 (t, $J = 7,3$ Hz, 2H), 4,23 (t, $J = 7,3$ Hz, 2H). TS (CI módszer): 227.

3. példa

(3) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,92 (d, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,64 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,07 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H). TS (CI módszer): 245, 215.

4. példa

(4) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,00 (m, 1H), 7,15 (m, 2H), 4,56 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,06 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H). TS (CI módszer): 226, 180, 164, 152, 135, 109, 94.

5. példa

(5) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,64-8,48 (m, 2H), 7,69 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 4,60 (t, $J = 7,3$ Hz, 2H), 4,01 (t, $J = 7,3$ Hz, 2H). TS (CI módszer): 276, 232, 217, 171, 144.

6. példa

(6) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,14-8,04 (m, 2H), 7,90 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 4,76 (t, $J = 8,4$ Hz, 2H), 4,23 (t, $J = 8,4$ Hz, 2H). TS (CI módszer): 242, 223, 167, 121, 94.

7. példa

(7) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,14-8,07 (m, 2H), 7,72 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 4,43 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,57 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H).

8. példa

(8) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,11-8,02 (m, 2H), 7,96 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 4,09-3,83 (2t, 4H), 3,27 (s, 2H). TS (CI módszer): 225, 236, 209, 190.

9. példa

(9) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,23 (m, 2H), 7,81 (t, $J = 7,4$ Hz, 1H), 7,22 (t, $J = 7,4$ Hz, 1H), 7,03 (d, $J = 8,4$ Hz, 1H). TS (CI módszer): 288, 258, 243, 197, 94.

10. példa

N1-(2-Amino-etil)-4-nitro-anilin (10) képletű vegyület

5 g (35,4 mmól) 4-fluor-nitro-benzol 250 ml acetonitrilben készült oldatát argongáz alatt szobahőmérsékleten kevertetjük egy éjszakán át. A reakciókeveréket leszűrjük, és a szűrletet bepároljuk. A kapott maradékot petroléterben szuszpendáljuk és kiszűrjük. 4,1 g (64 %) nitrovegyületet kapunk sárga kristályok alakjában.

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, $\text{DMSO} + \text{CDCl}_3$), δ : 7,97 (d, $J = 9,3$ Hz, 2H), 7,09 (széles s, 1H), 6,62 (d, $J = 9,3$ Hz, 2H), 2,80-3,40 (m, 6H). TS (CI): 181, 152, 135, 105.

11. példa

1-(4-Nitro-fenil)-2-imidazolidinon (11) képletű vegyület

4 g (22 mmól) a 10. példában leírtak szerint kapott diamin és 7,6 ml (55 mmól) trietil-amin 100 ml diklór-metánban készült, 0°C hőmérsékletű oldatához argongáz alatt cseppenként hozzáadunk 13 ml 20 %-os toluolos foszgén-oldatot (26,5 mmól). Ezen a

hőmérsékleten kevertetjük a reakciókeveréket 1 órán át, majd vízhez öntjük, és 4x150 ml diklór-metánnal extrahálunk. Az egyesített szerves extraktumot vízzel, sóoldattal mossuk és szárítjuk. A kapott bepárlási maradékot szilikagéloszlopon kromatografálva tisztítjuk, 3 g (66 %) terméket nyerve sárga szilárd anyag alakjában.

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,17 (d, $J = 9,3$ Hz, 2H), 7,75 (d, $J = 9,2$ Hz, 2H), 7,07 (széles s, 1H), 4,00 (t, $J = 8,8$ Hz, 2H), 3,59 (t, $J = 8,8$ Hz, 2H). TS (CI): 207, 151, 105.

12. példa

1-Metil-3-(4-nitro-fenil)-2-imidazolidinon (12) képletű vegyület

138 mg (5,3 mmól) 60 %-os olajos nátrium-hidrid szuszpenzióhoz adagonként hozzáadjuk 1 g (4,8 mmól) a 11. példában leírtak szerint előállított nitro vegyület 15 ml vízmentes dimetil-formamidban készült oldatát 0°C hőmérsékleten és argongáz alatt. A reakciókeveréket ugyanezen a hőmérsékleten kevertetjük 15 percen át, majd 0,68 g (4,8 mmól) metil-jodidot adunk hozzá és további 1 órán át kevertetjük. A reakciókeverékhez jégdarabkákat adunk, a keletkezett szilárd anyagot kiszűrjük, 900 mg (84 %) terméket nyerve sárga kristályos anyag alakjában.

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,19 (d, $J = 9,3$ Hz, 2H), 7,70 (d, $J = 9,3$ Hz, 2H), 3,88 (t, $J = 8,8$ Hz, 2H), 3,54 (t, $J = 8,8$ Hz, 2H), 2,93 (s, 3H). TS (CI): 222.

13. példa

1-(3-Fluor-4-nitro-fenil)-4-imidazolidinon (13) képletű vegyület

9,5 g (110,5 mmól) 4-imidazolidinon, 12,2 ml (110,5 mmól) 3,4-difluor-nitro-benzol és 28,6 ml (165 mmól) diizopropil-etil-amin 80 ml vízmentes dimetil-formamidban készült oldatát 60°C hőmérsékleten argongáz alatt melegítjük egy éjszakán át. A reakciókeveréket hagyjuk szobahőmérsékletre hűlni és jégdarabkákat adunk hozzá. A ke-

letkezett szilárd anyagot kiszűrjük és vízzel mossuk. A szilárd terméket levegőn szárítjuk, 19,5 g (78,5 %) nitrovegyületet nyerve sárga kristályok alakjában.

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO-d_6), δ : 8,81 (széles s, 1H), 8,07-7,96 (m, 2H), 6,82 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 4,97 (s, 2H), 4,06 (s, 2H). TS (Cl): 226, 185, 152.

14. példa

N1-Fenil-2-azido-acetamid (14) képletű vegyület

5 g (53,7 mmól) anilin és 18,7 ml (134,3 mmól) trietil-amin 150 ml diklór-metánban készült, 0°C hőmérsékletű oldatához argongáz alatt cseppenként hozzáadunk 5,1 ml (64,5 mmól) klór-acetil-kloridot. Miután a reakció teljes (vékonyréteg-kromatográfiával követjük nyomon), a reakciókeveréket 300 ml diklór-metánnal meghígítjuk. A kapott keveréket vízzel, sóoldattal mossuk és szárítjuk. A bepárlás után kapott maradékot 40 ml vízmentes dimetil-formamidban felvesszük, és 6,15 g (94,6 mmól) nátrium-azidot adunk hozzá. A reakciókeveréket 80°C hőmérsékleten kevertetjük 2 órán át, majd etil-acetáttal meghígítjuk és vízzel, majd sóoldattal mossuk és szárítjuk. Az oldószer elpárlása után kapott maradékot szilikagélen kromatografálva tisztítjuk, 6 g (63 %) azidot nyerve.

15. példa

N1-Fenil-2-(2-fluor-4-nitro-anilino)-acetamid (15) képletű vegyület

6 g (34 mmól) a 14. példában leírtak szerint kapott azidot 60 ml metanolban felvesszük és a kapott oldatot 10 %-os palládium/szén (2,5 g) katalizátor jelenlétében egy éjszakán át hidrogénezzük. A reakciókeveréket celitrétegen átszűrjük és a szűrletet bepároljuk. A maradékot 40 ml vízmentes dimetil-formamidban felvéve, az oldathoz hozzáadunk 16,7 ml (93,8 mmól) diizopropil-etil-amint és 3,8 ml (37,5 mmól) 3,4-difluor-nitro-benzolt. A kapott oldatot 80°C hőmérsékleten tartjuk egy éjszakán át, fo-

lyamatosan nyomonkövetve a reakció előrehaladtát vékonyrétegekromatográfiával. A reakciókeverékhez jéghideg vizet adunk, a kivált szilárd anyagot kiszűrjük, 6 g (61 %) nitro vegyületet nyerve sárga szilárd anyag alakjában.

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO + CDCl_3), δ : 9,74 (széles s, 1H), 7,84-8,00 (m, 2H), 7,58 (d, $J = 8,3$ Hz, 2H), 7,30 (d, $J = 8,3$ Hz, 2H), 7,08 (m, 1H), 6,66 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 6,45 (széles s, 1H), 4,09 (d, $J = 5,4$ Hz, 2H). TS (CI): 290.

16. példa

N1-(2-Anilino-etil)-2-fluor-4-nitro-amin (16) képletű vegyület

4,5 g (15,5 mmól) a 15. példában leírtak szerint nyert nitro vegyület 30 ml vízmentes tetrahidrofuránban készült, 0°C hőmérsékletű oldatához argongáz alatt csepenként hozzáadunk 45 ml (45 mmól) 1 mól/l koncentrációjú BH_3 .THF oldatot. A reakciókeveréket szobahőmérsékleten kevertetjük egy éjszakán át, majd víz hozzáadásával folyamatosan lebontjuk a borán felesleget. Csökkentett nyomáson eltávoíltjuk a reakciókeverékből az illékony komponenseket, a maradékot 400 ml etil-acetátban felvesszük. A szerves fázist vízzel, sóoldattal mossuk és szárítjuk. A bepárlásnál nyert maradékot oszlopon átengedve, 4 g (93 %) terméket nyerünk.

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,02-7,86 (m, 2H), 7,26-7,18 (m, 2H), 6,82-6,62 (m, 4H), 4,94 (széles s, 1H), 3,83 (széles s, 1H), 3,51 (s, 4H). TS (CI): 274.

17. példa

1-(2-Fluor-4-nitro-fenil)-3-fenil-2-imidazolidinon (17) képletű vegyület

4 g (14,5 mmól) a 16. példában leírtak szerint nyert diamin és 5,6 ml (40,4 mmól) trieti-amin 50 ml diklór-metánban készült, 0°C hőmérsékletű oldatához argongáz alatt csepenként hozzáadunk 7,4 ml (14,7 mmól) 20 %-os toluolos foszgén-oldatot. A reakciókeveréket ezen a hőmérsékleten kevertetjük 2 órán át, majd 300 ml

diklór-metánnal meghígítjuk, vízzel és sóoldattal mossuk és szárítjuk. Az oldat bepárlásával kapott kristályos terméket petroléterben szuszpendáljuk és szűrjük. 4 g (91,4 %) terméket nyerünk sárga kristályok alakjában.

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,10-7,11 (m, 8H), 4,22-4,00 (m, 4H). TS (CI): 302, 106.

18. példa

1-(2-Fluor-4-nitro-fenil)-3-hidroxi-metil-4-imidazolidinon (18) képletű vegyület

4 g (40 mmól) a 13. példában leírtak szerint előállított 1-(3-fluor-4-nitro-fenil)-4-imidazolidinon és 100 ml 40 %-os formaldehid keverékét visszafolyató hűtő alatt forraljuk 4 órán át. A reakciókeveréket hagyjuk szobahőmérsékletre hűlni, és jeges vizet adunk hozzá. A kivált szilárd anyagot kiszűrjük, szárítjuk, 8,5 g (83 %) terméket nyerve sárga szilárd anyag alakjában.

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO-d_6), δ : 8,10-7,95 (m, 2H), 6,90-6,80 (m, 1H), 6,20 (t, $J = 6,8$ Hz, 1H), 5,13 (d, $J = 2,9$ Hz, 2H), 4,77 (d, $J = 7,3$ Hz, 2H), 4,19 (s, 2H). TS (CI): 226.

19. példa

1-(2- Fluor-2-nitro-fenil)-3-hidroxi-metil-4-imidazolidinon (19) képletű vegyület

6,7 g (26,2 mmól) a 18. példában leírtak szerint nyert 1-(2-fluor-4-nitro-fenil)-3-hidroxi-metil-imidazolidinon, 65 mg (0,39 mmól) piridínium-p-toluolszulfonát (PPTS) és 3,6 (39,4 mmól) 3,4-dihidro-2H-pirán 100 ml diklór-metánban készült oldatát argongáz alatt szobahőmérsékleten kevertetjük egy éjszakán át. A reakciókeveréket 400 ml diklór-metánnal meghígítjuk, 2x100 ml félig telített sóoldattal mossuk és szárítjuk. A bepárlás után kapott maradékot szilikagéloszlopon kromatografálva tisztítjuk, 7 g (79 %) terméket nyerve sárga szilárd anyag alakjában.

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,05-7,85 (m, 2H), 6,60-6,45 (m, 1H), 5,30-4,70 (m, 5H), 4,17 (s, 2H), 4,20-3,30 (m, 4H), 2,00-1,40 (m, 6H). TS (CI): 340, 256, 237.

20. példa

Általános eljárás az 1. ábrán bemutatott átalakításhoz, ahol az általános képletekben Ox jelentése két heteroatomot - ami lehet oxigén-, nitrogén- vagy kénatom - tartalmazó, =O vagy =S képletű csoporttal helyettesített, ötagú heterociklusos csoport, mely kondenzált lehet egy helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoporttal; Ar jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoport.

A nitro vegyület tetrahidrofuránban készült oldatát katalitikus mennyiségű 10 %-os palládium/szén katalizátor jelenlétében hidrogénezzük egy éjszakán át. Amikor a kiindulási anyag teljesen felhasználódott, 5 %-os vizes oldatként 2,2 egyenértéktömeg nátrium-karbonátot, majd 1,2 egyenértéktömeg benzil-klór-formiátot adunk 0°C hőmérsékleten a reakciókeverékhez, majd 3 órán át kevertetjük szobahőmérsékleten. A keveréket celitrétegen átszűrjük, a kiszűrt anyagot etil-acetáttal mossuk. A szűrlet szerves fázisát elválasztjuk, vízzel kétszer, majd sóoldattal mossuk. A szerves extraktumot bepároljuk, és a terméket szilikagéloszlopon tisztítjuk.

A 21-163. példák vegyületeit a (A) - (L) általános eljárások szerint állítjuk elő.

A) Általános eljárás a 2. ábrán bemutatott átalakításhoz, ahol az általános képletekben Ox jelentése két heteroatomot - ami lehet oxigén-, nitrogén- vagy kénatom - tartalmazó =O vagy =S képletű csoporttal helyettesített, ötagú heterociklusos csoport, mely kondenzált lehet helyettesítetlen vagy helyettesített fenilcsoporttal, és Ar jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoport.

A kiindulási anyag vízmentes tetrahidrofuránban készült, -78°C hőmérsékletű oldatához argongáz alatt cseppenként hozzáadunk 1,2 egyenértéktömeg 1,6 mól/l koncentrációjú butil-lítiumot. A reakciókeveréket ugyanezen a hőmérsékleten kevertetjük 45 percen át, majd 1,2 egyenértéktömeg R-glicidil-butirátot adunk hozzá. A reak-



ciókeveréket -78°C hőmérsékleten kevertetjük 1 órán át, majd a hűtőfürdőt eltávolítjuk, és a reakció előrehaladtát vékonyrétegkromatográfiával ellenőrizzük. 3-12 óra elmúltával a reakciót telített ammónium-klorid-oldat hozzáadásával kioltjuk, és etil-acetáttal extrahálunk. Az egyesített szerves extraktumot vízzel, sóoldattal mossuk és szárítjuk. A bepárlásnál kapott maradékot szilikagéloszlopon kromatografálva tisztítjuk, hozzájutva a kívánt termékhez.

A 21-39. példa vegyületeit az (A) általános eljárással állítjuk elő.

21. példa

(21) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO-d_6), δ : 7,68-7,50 (m, 2H), 7,38 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 5,23 (t, $J = 5,8$ Hz, 1H), 4,73-4,72 (m, 1H), 4,47 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,14-3,80 (m, 4H), 3,68-3,56 (m, 2H).

22. példa

(22) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,73 (d, $J = 11,6$ Hz, 1H), 7,52 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 7,29 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 4,89 (széles s, 1H), 4,76 (t, $J = 2$ Hz), 4,17 (t, $J = 8,8$ Hz, 2H), 3,93-3,68 (m, 4H).

23. példa

(23) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,70 (dd, $J = 12,7$ és $2,2$ Hz, 1H), 7,44-7,26 (m, 2H), 4,75-4,68 (m, 2H), 4,37 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,04-3,56 (m, 4H), 3,48 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H).

24. példa

(24) képletű vegyület



^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,62 (dd, $J = 2,4$ és $12,7$ Hz, 1H), 7,47 (t, $J = 8,4$ Hz, 1H), 7,24-7,20 (m, 1H), 4,77-4,69 (m, 1H), 4,10-3,81 (m, 5H), 3,77-3,68 (m, 4H), 3,23 (s, 3H).

25. példa

(25) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,85-7,79 (m, 1H), 7,58 (t, $J = 8,0$ Hz, 1H), 7,46-7,42 (m, 1H), 7,30-7,18 (m, 4H), 6,90-6,87 (m, 1H), 4,90-4,75 (m, 1H), 4,15-4,07 (m, 3H), 3,87-3,81 (m, 1H).

26. példa

(26) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,76 (dd, $J = 2,4$ Hz és $12,2$ Hz, 1H), 7,53-7,26 (m, 2H), 7,11 (s, 1H), 6,97 (d, $J = 7,8$ Hz, 1H), 6,72 (d, $J = 7,8$ Hz, 1H), 4,81-4,56 (m, 1H), 4,09-3,82 (m, 4H), 2,41 (s, 3H), 2,09 (váll. 1H).

27. példa

(27) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,77 (d, $J = 10,4$ Hz, 1H), 7,57-7,26 (m, 3H), 6,96 (d, $J = 7,8$ Hz, 1H), 6,64 (s, 1H), 4,82-4,71 (m, 1H), 4,14-4,05 (m, 3H), 3,84-3,78 (m, 2H), 2,35 (s, 3H).

28. példa

(28) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,92-7,89 (m, 2H), 7,44 (d, $J = 7,8$ Hz, 1H), 7,80-7,71 (m, 1H), 4,54 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,08-3,89 (m, 6H), 2,16 (s, 1H).

29. példa

(29) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,69-7,48 (m, 2H), 7,23 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 4,81-4,72 (m, 1H), 4,54 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,13-3,69 (m, 6H).

30. példa**(30) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,29 (d, $J = 10,8$ Hz, 2H), 4,80-4,73 (m, 1H), 4,57 (t, $J = 15,6$ Hz, 2H), 4,00-3,73 (m, 8H).

31. példa**(31) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,59 (s, 4H), 5,24 (t, $J = 5,4$ Hz, 1H), 4,67 (széles s, 1H), 4,45 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,13-4,02 (m, 3H), 3,88-3,54 (m, 3H).

32. példa**(32) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,79 (d, $J = 9,2$ Hz, 2H), 7,72 (d, $J = 9,2$ Hz, 2H), 7,59-7,03 (m, 4H), 5,18 (t, $J = 5,8$ Hz, 1H), 4,80-4,71 (m, 1H), 4,18-4,02 (m, 2H), 3,98-3,68 (m, 2H).

33. példa**(33) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 2,9 (s, 3H), 4,1 (t, 1H), 3,9 (m, 6H), 4,7 (m, 1H), 4,8 (s, 2H), 6,8 (t, 1H), 7,2 (d, 1H).

34. példa**(34) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,4 (dd, $J = 2$ Hz és 15,4 Hz, 1H), 7,2 (d, $J = 8,8$ Hz, 2H), 7,0 (d, $J = 9,4$ Hz, 1H), 6,85 (d, $J = 8,4$ Hz, 2H), 6,5 (t, $J = 9,2$ Hz, 1H), 4,75 (s, 3H), 4,50 (s, 2H), 3,95 (m, 6H), 3,8 (s, 3H).

35. példa

(35) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,55 (dd, $J = 2,4$ Hz és 13,4 Hz, 1H), 7,45 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 7,10 (dd, $J = 2,2$ Hz és 13,0 Hz, 1H), 4,66 (m, 1H), 3,81 (m, 6H), 3,47 (t, 2H), 2,8 (s, 3H).

36. példa

(36) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 2,8 (s, 3H), 3,4 (m, 3H), 4,7 (m, 1H), 7,5 (m, 4H).

37. példa

(37) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,2-7,2 (m, 9H), 4,8-4,6 (m, 1H), 4,5 (s, 2H), 4,1-3,7 (m, 6H), 3,4 (t, $J = 8,8$ Hz, 2H).

38. példa

(38) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,5-7,7 (m, 4H), 7,3-7,4 (m, 2H), 7,2 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 7,1 (t, 4H), 4,7 (m, 1H), 3,9-4,1 (m, 6H), 3,9 (s, 1H), 3,7 (m, 1H).

39. példa

(39) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,5 (m, 4H), 7,2 (m, 1H), 7,0 (m, 2H), 4,7 (m, 2H), 4,0 (m, 7H), 3,8 (m, 1H).



B) Általános eljárás a 3. ábrán bemutatott átalakításhoz, ahol az általános képletekben Ox jelentése két heteroatomot - ami lehet oxigén-, nitrogén- vagy kénatom - tartalmazó =O vagy =S képletű csoporttal helyettesített, ötagú heterociklusos csoport, mely kondenzált lehet helyettesítetlen vagy helyettesített fenilcsoporttal, és Ar jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoport.

Az alkohol, trietil-amin (2,2 egyenértéktömeg) vízmentes diklór-metánban készült oldatához 0°C hőmérsékleten argongáz alatt hozzáadunk 1,1 egyenértéktömeg metánszulfonil-kloridot. A reakciókeveréket 2 óra alatt hagyjuk szobahőmérsékletre melegedni, majd diklór-metánnal meghígítjuk. A szerves fázist vízzel, sóoldattal mossuk és szárítjuk. A bepárlásnál nyert maradékot vízmentes dimetil-formamidban felvesszük, és szobahőmérsékleten 1,5 egyenértéktömeg nátrium-azidot adunk hozzá. A reakciókeveréket 80°C hőmérsékleten tartjuk 2-5 órán át, mialatt a reakció előrehaladtát vékonyrétegkromatográfiával követjük nyomon. A szobahőmérsékletre hűlt reakciókeverékhez vizet adunk, és etil-acetáttal extrahálunk. Az egyesített szerves extraktumot háromszor vízzel, majd sóoldattal mossuk és szárítjuk. A bepárlási maradékot oszlopon átengedve, megkapjuk a kívánt azidot.

A 40-51. példák vegyületeit a (B) általános eljárás szerint állítjuk elő.

40. példa

(40) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO- d_6), δ : 7,67-7,52 (m, 2H), 7,38 (d, $J = 8, 8$ Hz, 1H), 4,95-4,88 (m, 1H), 4,47 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,16 (t, $J = 9,4$ Hz, 1H), 4,02-3,64 (m, 5H).

41. példa

(41) képletű vegyület



^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,62 (dd, $J = 2,4$ Hz és $12,7$ Hz, 1H), 7,48 (t, $J = 8,4$ Hz, 1H), 7,22-7,17 (m, 1H), 4,85-4,73 (m, 1H), 4,16-3,52 (m, 8H), 3,22 (s, 3H).

42. példa

(42) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,75 (dd, $J = 2,0$ Hz és $12,2$ Hz, 1H), 7,54 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 7,40-7,26 (m, 1H), 7,10 (s, 1H), 6,97 (d, $J = 7,8$ Hz, 1H), 6,71 (d, $J = 6,8$ Hz, 1H), 4,87-4,79 (m, 1H), 4,17-3,57 (m, 4H), 2,41 (s, 3H).

43. példa

(43) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,81 (d, 1H), 7,54 (t, 1H), 7,45-7,01 (m, 3H), 6,67 (s, 1H), 4,91-4,79 (m, 1H), 3,95-3,47 (m, 4H), 2,38 (s, 3H).

44. példa

(44) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,89 (d, $J = 7,4$ Hz, 2H), 7,43 (d, $J = 9,4$ Hz, 1H), 4,87-4,80 (m, 1H), 4,54 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,12 (t, $J = 8,8$ Hz, 2H), 3,97-3,55 (m, 4H).

45. példa

(45) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,71-7,50 (m, 2H), 7,17 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 4,89-4,75 (m, 1H), 4,52 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,47-3,55 (m, 6H).

46. példa

(46) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,31 (s, 2H), 4,83-4,81 (m, 1H), 4,57 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,09-3,55 (m, 6H).

**47. példa****(47) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO- d_6), δ : 7,64 (s, 4H), 4,98-4,89 (m, 1H), 4,50 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,25-4,07 (m, 4H), 3,88-3,70 (m, 2H).

48. példa**(48) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,75 (d, $J = 9,2$ Hz, 2H), 7,59 (d, $J = 9,2$ Hz, 2H), 7,48-7,03 (m, 4H), 4,89-4,81 (m, 1H), 4,16 (t, $J = 9,2$ Hz, 1H), 3,98-3,58 (m, 3H).

49. példa**(49) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,5-7,4 (dd, 1H), 7,1 (dd, 1H), 6,5 (t, 1H), 4,9 (s, 2H), 4,8-4,7 (m, 1H), 4,1-3,5 (m, 6H), 3,0 (s, 3H).

50. példa**(50) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,6 (m, 4H), 7,35 (t, 2H), 7,0-7,2 (m, 2H), 4,8 (m, 1H), 4,1 (m, 1H), 4,0 (s, 4H), 3,9 (m, 1H), 3,7 (m, 2H).

51. példa**(51) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,6 (m, 4H), 7,2 (m, 1H), 7,0 (m, 2H), 4,8 (m, 1H), 4,1 (m, 1H), 4,0 (s, 4H), 3,9 (m, 1H), 3,6 (m, 2H).

C) Általános eljárás a 4. ábrán bemutatott átalakításhoz, ahol az általános képletekben Ox jelentése két heteroatomot - ami lehet oxigén-, nitrogén- vagy kénatom - tartalmazó =O vagy =S képletű csoporttal helyettesített, ötagú heterociklusos csoport,



mely kondenzált lehet helyettesítetlen vagy helyettesített fenilcsoporttal, és Ar jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoport.

(i) Eljárás:

Az azid tetrahidrofurán/metanol 1:3 arányú elegyében készült oldatát 10 %-os palládium/szén katalizátor jelenlétében hidrogénezzük egy éjszakán át. A reakciókeveréket szűrjük, és a szűrletet bepároljuk. A maradékot metanolban kristályosítva, megkapjuk az amint.

(ii) Eljárás:

1,3 egyenértéktömeg trifenil-foszfint adagonként hozzáadunk az azid vízmentes tetrahidrofuránban készült oldatához, és a kapott reakciókeveréket szobahőmérsékleten kevertetjük 6 órán át. Néhány csepp vizet adunk a reakciókeverékhez, majd 60°C hőmérsékleten tartjuk egy éjszakán át. A reakciókeveréket bepárolva, a maradékot szilikagéloszlopon kromatografáljuk, hozzájutva a kívánt aminhoz.

Az 52-57. példák vegyületeit a (C) általános eljárás szerint állítjuk elő.

52. példa

(52) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO- d_6), δ : 7,66-7,50 (m, 2H), 7,37 (d, $J = 9,4$ Hz, 1H), 4,66-4,60 (m, 1H), 4,47 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,12-3,83 (m, 6H), 2,91-2,80 (m, 2H). Op.: 147°C.

53. példa

(53) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,63-7,55 (dd, $J = 2,0$ Hz és 13,0 Hz, 1H), 7,49-7,22 (m, 2H), 4,63-4,60 (m, 1H), 4,09 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 4,03-3,73 (m, 4H), 3,32 (m, 3H), 3,08 (s, 3H).

**54. példa****(54) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,02 (s, 2H), 7,87-7,83 (m, 2H), 7,64 (s, 1H), 7,50 (d, $J = 8,2$ Hz, 1H), 4,84 (s, 1H), 4,54 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,20-3,90 (m, 6H).

55. példa**(55) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO-d_6), δ : 7,57 (s, 4H), 4,63-4,61 (m, 1H), 4,44 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,08-3,82 (m, 4H), 2,86-2,82 (m, 2H).

56. példa**(56) képletű vegyület**

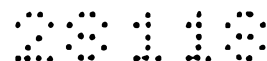
$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,6-7,4 (dd, 1H), 7,1 (dd, 1H), 6,6 (t, 1H), 4,9 (s, 2H), 4,6 (m, 1H), 4,1-3,7 (m, 4H), 3,2-2,8 (m, 4H).

57. példa**(57) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,62-7,40 (m, 3H), 7,3 (s, 5H), 4,7 (m, 1H), 4,5 (s, 2H), 4,1 (t, 1H), 3,9-3,8 (m, 4H), 3,4 (t, 2H).

D) Általános eljárás az 5. ábrán bemutatott átalakításhoz, ahol az általános képletekben Ox jelentése két heteroatomot - ami lehet oxigén-, nitrogén- vagy kénatom - tartalmazó $=\text{O}$ vagy $=\text{S}$ képletű csoporttal helyettesített, öttagú heterociklusos csoport, mely kondenzált lehet helyettesítetlen vagy helyettesített fenilcsoporttal, és Ar jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoport.

Az amin metil-formiátban készült oldatát 80°C hőmérsékleten melegítjük egy éjszakán át. Csökkentett nyomáson eltávolítjuk az illékony alkotórészeket, a kapott maradékot oszlopon átengedve, igen tiszta formiáthoz jutunk.



Az 58. és 59. példák vegyületeit a (D) általános eljárás szerint állítjuk elő.

58. példa

(58) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,28 (s, 1H), 7,66-7,49 (m, 2H), 7,15 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 6,15 (széles, s 1H), 4,82 (m, 1H), 4,52 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,48-4,02 (m, 3H).

59. példa

(59) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,27 (s, 1H), 7,26-7,23 (m, 2H), 6,32 (széles s, 1H), 4,82 (széles s, 1H), 4,58 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,21-3,68 (m, 6H).

E) Általános eljárás a 6.ábrán bemutatott átalakításhoz, ahol az általános képletekben Ox jelentése két heteroatomot - ami lehet oxigén-, nitrogén- vagy kén-atom - tartalmazó, =O vagy =S képletű csoporttal helyettesített, ötagú heterociklusos csoport, mely kondenzált lehet egy helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoporttal, Ar jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoport és R^{4a} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 2-6 szénatomos alkenil-, halogénezett 1-6 szénatomos alkil-, aril-oxi-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-, aril-oxi-karbonil- vagy 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport.

1 egyenértéktömeg amin vízmentes diklór-metánban készült, 0°C hőmérséketű oldatához argongáz alatt hozzáadunk 2,5 egyenértéktömeg trietil-amint, majd csep-penként 1,2 egyenértéktömeg megfelelő sav-kloridot. A reakciókeveréket szobahő-mérsékleten kevertetjük 1-6 órán át, a reakció előreahaladtát vékonyrétegkro-matográfiával követve nyomon. A reakciókeveréket diklór-metánnal meghígítjuk, két-szer vízzel, majd sóoldattal mossuk. A szerves extraktumot szárítjuk, bepároljuk és a maradékot oszlopon átengedve, hozzájutunk az acilezett termékhez.



A 60-90. példák vegyületeit az (E) általános eljárás szerint állítjuk elő.

60. példa

(60) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,62 (dd, $J = 2,60$ Hz és $13,4$ Hz, 1H), 7,52 (d, $J = 8,6$ Hz, 1H), 7,13-7,17 (m, 1H), 5,96-5,99 (m, 1H), 4,82-4,76 (m, 1H), 4,52 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,01-4,09 (m, 3H), 3,62-3,81 (m, 3H), 2,02 (s, 3H).

61. példa

(61) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,66-7,49 (m, 2H), 7,16 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 6,03 (széles s, 1H), 4,82-4,78 (m, 1H), 4,52 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,09-4,0 (m, 3H), 3,83-3,65 (m, 3H), 2,24 (q, $J = 7,8$ Hz, 2H), 1,13 (t, $J = 7,8$ Hz, 3H). Op.: 203°C .

62. példa

(62) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,66-7,49 (m, 2H), 7,15 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 6,01 (széles s, 1H), 4,81-4,75 (m, 1H), 4,52 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,09-4,01 (m, 3H), 3,83-3,65 (m, 3H), 2,19 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 1,65-1,58 (m, 2H), 0,98 (t, $J = 7,4$ Hz, 3H). Op.: 211°C .

63. példa

(63) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,66-7,49 (m, 2H), 7,15 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 4,82-4,76 (m, 1H), 4,52 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,09-4,01 (m, 2H), 3,83-3,65 (m, 3H), 2,21 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 1,57-1,49 (m, 2H), 1,38-1,20 (m, 2H), 0,98 (t, 3H). Op.: 187°C .

64. példa

(64) képletű vegyület



- $^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,68-7,52 (m, 2H), 7,17 (d, 8,6 Hz, 1H), 5,96 (váll, 1H),
- 4,81 (váll, 1H), 4,54 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,11-3,67 (m, 6H), 2,22 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 1,60 (széles s, 3H), 0,87 (s, 3H). Op.: 131°C .

65. példa

(65) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, $\text{CDCl}_3 + \text{DMSO-d}_6$), δ : 7,97 (széles s, 1H), 7,6-7,40 (m, 2H), 7,10 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 6,35-6,15 (m, 2H), 5,63 (dd, $J = 4,0$ Hz és 8,3 Hz, 1H), 4,79-4,86 (m, 1H), 4,53 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,05 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,89-3,56 (m, 4H). Op.: 196°C .

66. példa

(66) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, $\text{CDCl}_3 + \text{DMSO-d}_6$), δ : 9,38 (széles s, 1H), 7,67-7,5 (m, 2H), 7,20 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 4,88-4,87 (m, 1H), 4,53 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,16-4,02 (m, 3H), 3,89-3,70 (m, 1H), 3,67-3,65 (m, 2H). Op.: 194°C .

67. példa

(67) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,66-7,49 (m, 2H), 7,15 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 4,85-4,83 (m, 1H), 5,55-4,47 (m, 2H), 4,37-4,31 (m, 2H), 4,14-3,90 (m, 3H), 3,88-3,60 (m, 3H), 1,42 (t, 3H). Op.: 160°C .

68. példa

(68) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,75-7,05 (m, 3H), 6,05 (széles, 1H), 4,95-4,62 (m, 2H), 4,52 (t, 1H), 4,30-3,32 (m, 6H), 2,023 (s, 3H).

69. példa**(69) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,5 (d, $J = 7,81$ Hz, 2H), 7,3 (d, $J = 7,81$ Hz, 2e H), 4,8 (s, 1H), 4,4 (s, 4H), 4,1 (t, 1H), 3,8 (t, 1H), 3,5 (s, 1H), 3,23 (s, 1H), 2,0 (s, 3H).

70. példa**(70) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,99 (váll, 1H), 7,73 (d, $J = 13,0$ Hz, 1H), 7,43 (d, $J = 8,0$ Hz, 1H), 7,31 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 4,83 (váll, 1H), 4,42 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 4,15-3,89 (m, 3H), 3,62-3,55 (m, 4H), 2,0 (s, 3H). Op.: 220°C .

71. példa**(71) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,61 (dd, $J = 2,6$ Hz és $12,7$ Hz, 1H), 7,48 (t, $J = 8,4$ Hz, 1H), 7,19 (dd, $J = 2,6$ Hz, és $8,8$ Hz, 1H), 6,15 (t, $J = 2,6$ Hz és $8,8$ Hz, 1H), 6,15 (t, $J = 8,4$ Hz, 1H), 4,79-4,77 (m, 1H), 4,05 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 3,97-3,88 (m, 2H), 3,81-3,74 (m, 3H), 3,69-3,61 (m, 2H), 3,23 (s, 3H), 2,03 (s, 3H). Op.: 171°C .

72. példa**(72) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,76 (dd, $J = 2,2$ Hz és $12,0$ Hz, 1H), 7,53 (t, $J = 8,4$ Hz, 1H), 7,37-7,14 (m, 4H), 6,82 (t, $J = 3,4$ Hz, 1H), 6,03 (t, $J = 5,4$ Hz, 1H), 4,83-4,80 (m, 1H), 4,10 (t, $J = 9,0$ Hz, 1H), 3,88-3,80 (m, 1H), 3,71-3,66 (m, 2H), 2,04 (s, 3H).

73. példa**(73) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,74 (dd, $J = 2,6$ Hz és $12,2$ Hz, 1H), 7,53 (t, $J = 8,4$ Hz, 1H), 7,49-7,26 (m, 2H), 7,10-6,95 (m, 2H), 6,72-6,68 (m, 1H), 6,09-6,01 (m, 1H), 4,84



(széles s, 1H), 4,10 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 3,88-3,66 (m, 3H), 2,41 (s, 3H), 2,04 (s, 3H).

Op.: 213°C.

74. példa

(74) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,80-6,94 (m, 4H), 6,63 (s, 1H), 6,0 (széles s, 1H), 4,82-4,90 (m, 1H), 4,11 (t, $J = 9,2$ Hz, 1H), 3,89-3,66 (m, 3H), 2,35 (s, 3H), 2,09 (s, 3H).

Op.: 202°C.

75. példa

(75) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,93 (s, 1H), 7,76 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 7,42 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 6,57 (széles s, 1H), 4,79 (széles s, 1H), 4,52 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,11-3,60 (m, 6H), 1,99 (s, 3H). Op.: 143°C.

76. példa

(76) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,93-7,79 (m, 2H), 7,43 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 6,12 (széles s, 1H), 4,82-4,78 (m, 1H), 4,53 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,09 (t, $J = 9,4$ Hz, 1H), 3,96-3,66 (m, 5H), 2,30-2,07 (m, 2H), 1,20 (t, $J = 9,4$ Hz, 3H). Op.: 143°C.

77. példa

(77) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,91 (s, 1H), 7,78 (d, $J = 8,2$ Hz, 1H), 6,26 (széles s, 1H), 4,80 (széles s, 1H), 4,52 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,06 (t, $J = 9,4$ Hz, 1H), 3,95-3,67 (m, 5H), 2,47-2,05 (m, 4H), 1,83-1,54 (m, 6H), 0,83-0,78 (m, 4H). Op.: higroszkópos.

78. példa

(78) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,92 (s, 1H), 7,85 (d, $J = 8,2$ Hz, 1H), 7,45 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 6,40-6,07 (m, 3H), 5,75 (d, $J = 10,4$ Hz, 1H), 4,89 (váll, 1H), 4,56 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,13 (t, $J = 9,2$ Hz, 1H), 3,98-3,78 (m, 5H). Op.: 191°C .

79. példa**(79) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,65-7,41 (m, 2H), 7,23 (d, $J = 7,2$ Hz, 1H), 6,12 (széles s, 1H), 4,80 (széles s, 1H), 4,52 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,47-4,00 (m, 3H), 3,81-3,59 (m, 3H), 2,05 (s, 3H). Op.: 120°C .

80. példa**(80) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,27 (d, $J = 9,8$ Hz, 2H), 6,01 (váll, 1H), 4,80 (váll, 1H), 4,57 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,06-3,67 (m, 6H), 2,03 (s, 3H). Op.: 219°C .

81. példa**(81) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, $\text{CDCl}_3 + \text{DMSO}-d_6$), δ : 7,32-7,26 (m, 2H), 7,09 (váll, 1H), 4,81 (váll, 1H), 4,58 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,05-3,62 (m, 6H), 2,25-2,18 (m, 2H), 1,11 (t, $J = 7,8$ Hz, 3H). Op.: 224°C .

82. példa**(82) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, $\text{CDCl}_3 + \text{DMSO}-d_6$), δ : 7,64 (s, 2H), 7,55 (s, 2H), 7,09-7,25 (m, 1H), 4,70-4,85 (m, 1H), 4,46 (t, 2H), 4,13-3,81 (m, 4H), 3,57 (széles s, 2H), 1,96 (s, 3H). Op.: 231°C .

83. példa**(83) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,70 (d, $J = 8,8$ Hz, 2H), 7,54 (d, $J = 8,8$ Hz, 2H), 7,24-6,99 (m, 4H), 6,19 (széles s, 1H), 4,80 (m, 1H), 4,09 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 3,85 (t, $J = 7,0$ Hz, 1H), 3,69-3,63 (m, 2H), 2,02 (s, 3H). Op.: 229°C.

84. példa**(84) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,10 (d, 1H), 6,6 (t, 1H), 6,0 (m, 1H), 4,90 (s, 2H), 4,9 (m, 1H), 4,0 (s, 3H), 3,80 (m, 3H), 3,0 (s, 3H), 2,0 (s, 3H). Op.: 230°C.

85. példa**(85) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,26-7,46 (m, 6H), 7,01 (d, 1H), 6,63 (t, 1H), 6,05 (s, 1H), 4,71-4,89 (m, 2H), 4,77 (s, 1H), 4,60 (s, 2H), 3,94-4,04 (m, 3H), 3,61-3,76 (m, 3H), 2,01 (s, 3H).

86. példa**(86) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,50 (m, 2H), 7,10 (d, $J = 8,4$ Hz, 1H), 6,18 (t, 1H), 4,7 (m, 1H), 4,0 (t, $J = 9,4$ Hz, 1H), 3,6 (m, 7H), 2,9 (s, 3H), 2,0 (s, 3H). Op.: 182°C.

87. példa**(87) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 2,0 (s, 3H), 2,8 (s, 3H), 4,0 (t, 1H), 3,4-3,8 (m, 5H), 4,8 (m, 1H), 6,2 (m, 3H), 7,6 (m, 4H).

88. példa

(88) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,6-7,3 (m, 9H), 6,2 (széles t, 1H), 4,8-4,7 m, 1H), 4,5 (s, 2H), 4,06 (t, $J = 9,3$ Hz, 1H), 3,90-3,3 (m, 6H), 2,0 (s, 3H). Op.: 204°C.

89. példa**(89) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,70-7,50 (m, 4H), 7,40-7,30 (t, 2H), 7,2 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 7,1 (t, 1H), 4,80 (m, 5H), 4,0 (m, 5H), 3,8 (m, 1H), 3,6 (m, 2H), 2,0 (s, 3H). Op.: 182°C.

90. példa**(90) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,3 (m, 1H), 7,6 (m, 4H), 7,3 (m, 1H), 7,2 (t, 2H), 4,7 (m, 1H), 4,1 (t, 1H), 3,8-4,0 (m, 4H), 3,7 (t, 1H), 3,0 (m, 2H), 1,8 (s, 3H). Op.: 194°C.

F) Általános eljárás a 7. átalakításhoz, ahol az általános képletekben Ox jelentése két heteroatomot - ami lehet oxigén-, nitrogén- vagy kénatom - tartalmazó, =O vagy =S képletű csoporttal helyettesített, ötagú heterociklusos csoport, mely kondenzált lehet egy helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoporttal, Ar jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoport és R^{4b} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett 1-6 alkil-, (=O)-(1-6 szénatomos)-alkoxi-, -C(=S)-aril-oxi-, -C(=S)-(1-6 szénatomos)alkil- vagy -C(=S)-aril általános képletű csoport.

1 egyenértéktömeg amid és 0,6 egyenértéktömeg Lawesson-féle reagens vízmentes dioxánban készült oldatát 55-90°C hőmérsékleten melegítjük 3-10 órán át, a reakció előrehaladtát vékonyrétegkromatográfiával nyomonkövetve. A reakciókeveréket hagyjuk szobahőmérsékletre hűlni, majd etil-acetáttal meghígítjuk. A kapott keve-

- réket négyszer vízzel, majd sóoldattal mossuk és szárítjuk. A bepárlás után kapott maradékot szilikagéloszlopon átengedve, megkapjuk a kívánt tioacetátot.

A 91-100. példa vegyületeit az F) általános eljárás szerint állítjuk elő.

91. példa

(91) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,94 (széles s, 1H), 7,66-7,52 (m, 2H), 7,16 (d, $J = 7,8$ Hz, 1H), 5,20-4,85 (m, 1H), 4,54 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,25-3,82 (m, 6H), 2,61 (s, 3H).
Op.: 171°C .

92. példa

(92) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, $\text{CDCl}_3 + \text{DMSO-d}_6$), δ : 10,51 (s, 1H), 7,64-7,47 (m, 2H), 7,16 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 5,01 (széles s, 1H), 4,53 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,29-3,89 (m, 4H), 3,63 (s, $J = 10,2$ Hz, 2H). Op.: 165°C .

93. példa

(93) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,90 (széles s, 1H), 7,61 (dd, $J = 2,4$ Hz és $12,8$ Hz, 1H), 7,50 (t, $J = 8,2$ Hz, 1H), 7,19 (dd, $J = 2,4$ Hz és $12,8$ Hz, 1H), 7,19 (dd, $J = 2,4$ Hz és $12,8$ Hz, 1H), 5,0 (m, 1H), 4,25-3,74 (m, 8H), 3,24 (s, 3H), 2,6 (s, 3H). Op.: 111°C .

94. példa

(94) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,87-7,74 (m, 2H), 7,57 (t, $J = 8,2$ Hz, 1H), 7,39-7,18 (m, 4H), 6,87-6,85 (m, 1H), 5,08-5,05 (m, 1H), 4,37-4,27 (m, 1H), 4,23-4,06 (m, 2H), 3,94 (t, $J = 6,8$ Hz, 1H), 2,62 (s, 3H). Op.: 137°C .

95. példa**(95) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,1 (s, 1H), 7,9 (s, 1H), 7,8 (d, $J = 8,7$ Hz, 1H), 7,4 (d, $J = 8,79$ Hz, 1H), 5,0 (s, 1H), 4,6 (t, 2H), 4,0 (m, 6H), 2,6 (s, 3H). Op.: 154°C.

96. példa**(96) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, $\text{CDCl}_3 + \text{DMSO-d}_6$), δ : 10,37 (széles s, 1H), 7,50 (d, $J = 10,8$ Hz, 2H), 4,98 (széles s, 1H), 4,55 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,23-3,78 (m, 6H), 2,50 (s, 3H). Op.: 108°C.

97. példa**(97) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,86 (széles t, 1H), 7,28 (d, $J = 9,6$ Hz, 2H), 5,02-4,99 (m, 1H), 4,58 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,24-3,80 (m, 6H), 2,71 (q, $J = 7,4$ Hz, 2H), 1,29 (t, $J = 7,8$ Hz, 3H). Op.: 168°C.

98. példa**(98) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,86 (váll, 1H), 7,25 (d, $J = 9,6$ Hz, 2H), 5,02-4,99 (m, 1H), 4,58 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,24-3,80 (m, 6H), 2,71 (q, $J = 7,4$ Hz, 2H), 1,29 (t, $J = 7,8$ Hz, 3H). Op.: 195°C.

99. példa**(99) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 8,4 (1H), 7,5 (m, 2H), 7,0 (d, $J = 8,8$ Hz, 2H), 4,9 (m, 1H), 3,9 (m, 6H), 3,5 (t, $J = 8,8$ Hz, 2H), 2,9 (s, 3H), 2,5 (s, 3H). Op.: 168°C.

100. példa**(100) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,6 (m, 4H), 7,4 (m, 2H), 7,2 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 7,0 (t, 1H), 5,0 (m, 1H), 4,0 (m, 8H), 2,6 (s, 3H). Op.: 165°C .

G) Általános eljárás a 8. ábrán bemutatott átalakításhoz, ahol az általános képletekben Ox jelentése két heteroatomot - ami lehet oxigén-, nitrogén- vagy kénatom - tartalmazó $=\text{O}$ vagy $=\text{S}$ képletű csoporttal helyettesített, ötagú heterociklusos csoport, mely kondenzált lehet egy helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoporttal; és Ar jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoport.

1 egyenértéktömeg amin, 2,2 egyenértéktömeg trietil-amin vízmentes diklór-metánban készült, 0°C hőmérsékletű oldatához argongáz alatt hozzáadunk 1,2 egyenértéktömeg metil-klór-formiátot. A reakciókeveréket szobahőmérsékleten kevertetjük egy éjszakán át, majd diklór-metánnal meghígítjuk, vízzel és sóoldattal mossuk. A bepárlás után kapott szerves fázist szárítás után oszlopon átengedve, megkapjuk a kívánt karbamátot.

A 101-105. példák vegyületeit a G) általános eljárás szerint állítjuk elő.

101. példa**(101) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,68-7,49 (m, 2H), 7,16 (d, $J = 8,4$ Hz, 1H), 5,16 (széles s, 1H), 4,78 (széles s, 1H), 4,52 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,09-4,0 (m, 3H), 3,84-3,55 (m, 6H). Op.: 153°C .

102. példa**(102) képletű vegyület**



- ^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,9 (m, 2H), 7,4 (d, $J = 8,3$ Hz, 1H), 5,2 (s, 1H), 4,8 (s, 1H), 4,5 (t, 1H), 4,0 (m, 9H). Op.: 148°C .

103. példa

(103) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,27 (d, $J = 6,8$ Hz, 2H), 5,16 (széles s, 1H), 4,84-4,80 (m, 1H), 4,58 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,07-3,60 (m, 9H). Op.: 157°C .

104. példa

(104) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, $\text{CDCl}_3 + \text{DMSO}-d_6$), δ : 7,57 (s, 4H), 6,98 (széles s, 1H), 4,96-4,76 (m, 1H), 4,51 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,47 (m, 3H), 3,91-3,84 (m, 1H), 3,65 (s, 1H), 3,51 (széles s, 3H). Op.: 195°C .

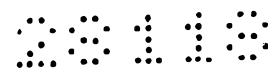
105. példa

(105) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 3,0 (s, 3H), 3,8 (m, 6H), 4,8 (m, 1H), 4,9 (s, 2H), 5,1 (m, 1H), 6,6 (t, 1H). Op.: 226°C .

H) Általános eljárás a 9. ábrán bemutatott átalakításhoz, ahol az általános képletekben Ox jelentése két heteroatomot - ami lehet oxigén-, nitrogén- vagy kénatom - tartalmazó, =O vagy =S képletű csoporttal helyettesített, ötagú heterociklusos csoport, mely kondenzált lehet egy helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoporttal, Ar jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoport és R^{4c} jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport.

1 egyenértéktömeg amin, 2 egyenértéktömeg trietil-amin és néhány csepp víz jéghideg etanolban készült keverékéhez argongáz alatt hozzáadunk 1 egyenértéktömeg szén-diszulfidot. A reakciókeveréket szobahőmérsékleten kevertetjük egy éjsza-



kán át, majd etanolban 1,1 egyenértéktömeg metil-jodidot adunk hozzá és a kevertét 12 órán át folytatjuk. Az illékony alkotórészeket eltávolítva, a maradékot etil-acetátban felvesszük, a szerves keveréket nátrium-hidrogén-karbonát telített oldattal, vízzel és sóoldattal mossuk, majd szárítjuk. A bepárlási maradékot oszlopon átengedve hozzájutunk a kívánt termékhez.

A 106. és 107. példák vegyületeit a H) általános eljárás szerint állítjuk elő.

106. példa

(106) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, $\text{CDCl}_3 + \text{DMSO-d}_6$), δ : 9,98 (széles t, 1H), 7,55 (s, 4H), 5,05-5,02 (m, 1H), 4,50 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,12-3,87 (m, 6H), 2,60 (s, 3H). Op.: 161°C .

107. példa

(107) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO-d_6), δ : 7,26 (s, 1H), 6,15 (d, $J = 10,2$ Hz, 2H), 4,56-4,49 (m, 3H), 4,27-3,83 (m, 5H), 3,26-3,15 (m, 1H), 2,54 (s, 3H). Op.: 147°C .

I) Általános eljárás

(i) Lépés a 10. ábrán bemutatott átalakításhoz, ahol az általános képletekben Ox jelentése két heteroatomot - ami lehet oxigén-, nitrogén- vagy kénatom - tartalmazó, =O vagy =S képletű csoporttal helyettesített, ötagú heterociklusos csoport, mely kondenzált lehet egy helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoporttal, Ar jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoport.

1 egyenértéktömeg amin, 2,4 egyenértéktömeg trietil-amin vízmentes diklór-metánban készült, jeges fürdő hőmérsékletén lévő oldatához argongáz alatt cseppenként hozzáadunk 1,2 egyenértéktömeg tiofoszfént. A reakciókeveréket 3 óra alatt hagyjuk



szobahőmérsékletre melegedni, majd bepároljuk. A maradékot közvetlenül szilikagéloszlopra visszük, hozzájutva a kívánt termékhez.

(ii) Lépés a 11. ábrán bemutatott átalakításhoz, ahol az általános képletekben Ox jelentése két heteroatomot - ami lehet oxigén-, nitrogén- vagy kénatom - tartalmazó, =O vagy =S képletű csoporttal helyettesített öttagú heterociklusos csoport, mely kondenzált lehet egy helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoport, Ar jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoport, és R^{4d} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, fluoratómmal helyettesített $-(C=O)-(1-6 \text{ szénatomos})$ alkil általános képletű csoport, aril-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil- vagy 2-6 szénatomos alkenilcsoport.

Az izotiocianátot a megfelelő alkoholban 80-100°C hőmérsékleten melegítjük, a reakció előrehaladtát vékonyrétegkromatográfiával követve nyomon. Amint a kiindulási anyag teljesen felhasználódott, a reakciókeveréket hagyjuk szobahőmérsékletre hűlni. A keletkezett kristályos anyagot elválasztjuk, dietil-éterrel mossuk és csökkentett nyomáson szárítjuk, hozzájutva a tiszta termékhez.

A 108-144. példák vegyületeit az I) általános eljárásban leírtak szerint állítjuk elő.

108 példa

(108) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,67-7,56 (m, 2H), 7,16 (d, $J = 2,0 \text{ Hz}$, 1H), 6,72 (széles s, 1H), 4,94 (széles s, 1H), 4,52 (t, $J = 7,8 \text{ Hz}$, 2H), 4,12-3,83 (m, 9H). Op.: 137°C.

109 példa

(109) képletű vegyület



¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃), δ: 7,66-7,50 (m, 2H), 7,15 (d, J = 7,4 Hz, 1H), 6,66 (...
1H), 4,94 (széles s, 1H), 4,56-4,43 (m, 4H), 4,12-3,84, (m, 6H), 1,32 (t, J = 6,8 Hz,
3H). Op.: 208°C.

110. példa

(110) képletű vegyület

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃ + DMSO-d₆), δ: 8,45 (széles s, 1H), 7,65-7,46 (m, 2H), 7,17
(d, J = 8,8 Hz, 1H), 4,81 (széles s, 1H), 4,53 (t, J = 7,4 Hz, 2H), 4,09-3,99 (m, 3H),
3,84-3,55 (m, 3H), 3,13 (q, J = 10,4 Hz, 2H). Op.: 184°C.

111. példa

(111) képletű vegyület

¹H-NMR (200 MHz, DMSO-d₆), δ: 9,54 (m, 1H), 7,57 (s, 4H), 4,90-4,80 (m, 2H), 4,44 (t,
J = 7,4 Hz, 2H), 4,21-4,01 (m, 4H), 3,88-3,77 (m, 3H), 3,56-3,53 (m, 1H), 1,23-0,97 (m,
6H). Op.: 153°C.

112. példa

(112) képletű vegyület

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃), δ: 8,2 (m, 1H), 7,7 (d, J = 10,74 Hz, 1H), 7,5 (t, 1H), 7,3 (d,
J = 8,79 Hz, 1H), 5,0 (m, 1H), 4,70 (t, 2H), 4,1 (m, 9H). Op.: 197°C.

113. példa

(113) képletű vegyület

¹H-NMR (200 MHz, CDCl₃), δ: 7,02 (dd, J = 2,4 Hz és 12,8 Hz, 1H), 7,49 (t, J = 8,8 Hz
és 12,8 Hz, 1H), 7,20 (dd, J = 2,4 Hz és 12,8 Hz, 1H), 6,63 (széles s, 1H), 4,93 (m,
1H), 4,54-4,44 (q, J = 7,4 Hz, 2H), 4,13-3,72 (m, 8H), 3,24 (s, 3H), 1,32 (t, J = 7,0 Hz,
3H). Op.: 197°C.

**114. példa****(114) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,62 (dd, $J = 2,4$ Hz és 12,6 Hz, 1H), 7,49 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 7,20 (dd, $J = 2,4$ Hz és 12,6 Hz, 1H), 6,65 (széles s, 1H), 4,94 (m, 1H), 4,38 (t, $J = 8,8$ Hz, 2H), 4,13-3,73 (m, 8H), 3,24 (s, 3H), 1,78-1,63 (m, 2H), 0,99 (t, 3H).

Op.: $> 200^\circ\text{C}$.

115. példa**(115) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,62 (dd, $J = 2,4$ Hz és 12,7 Hz, 1H), 7,49 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 7,20 (dd, $J = 2,4$ Hz és 12,7 Hz, 1H), 6,70 (széles s, 1H), 4,94 (m, 1H), 4,13-3,72 (m, 11H), 3,24 (s, 3H). Op.: 179°C .

116. példa**(116) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,62 (dd, $J = 2,4$ Hz és 12,7 Hz, 1H), 7,49 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 7,20 (dd, $J = 2,4$ Hz és 13,0 Hz, 1H), 6,55 (széles s, 1H), 5,58-5,49 (heptett, 1H), 4,92 (m, 1H), 4,13-3,73 (m, 8H), 3,24 (s, 3H), 1,39-1,25 (m, 6H). Op.: 183°C .

117. példa**(117) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,9 (m, 2H), 7,5 (d, $J = 8,79$ Hz, 1H), 6,7 (s, 1H), 5,0 (s, 1H), 4,5 (t, 2H), 4,0 (m, 9H). Op.: 146°C .

118. példa**(118) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,8 (m, 2H), 7,4 (d, $J = 8,79$ Hz, 1H), 6,7 (s, 1H), 5,0 (s, 1H), 4,5 (m, 4H), 4,0 (m, 6H), 1,3 (m, 3H). Op.: 157°C .

119. példa**(119) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,29-7,24 (m, 2H), 6,73 (váll, 1H), 4,96 (váll, 1H), 4,58 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,08-3,83 (m, 9H). Op.: 182°C .

120. példa**(120) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,52 (s, 4H), 6,81 (széles s, 1H), 4,91 (váll, 1H), 4,49 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,13-3,82 (m, 9H). Op.: 153°C .

121. példa**(121) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,5 (s, 4H), 6,7 (s, 1H), 4,9 (s, 1H), 4,5 (m, 4H), 4,0 (m, 6H), 1,3 (t, $J = 6,8$ Hz, 3H). Op.: 168°C .

122. példa**(122) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,54 (s, 4H), 6,7 (s, 1H), 4,9 (m, 1H), 4,4 (m, 4H), 4,0 (m, 6H), 1,7 (m, 2H), 0,95 (t, $J = 7,4$ Hz, 3H). Op.: 176°C .

123. példa**(123) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,52 (s, 4H), 7,26 (széles s, 1H), 4,96-4,77 (m, 3H), 4,50 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,15-3,80 (m, 6H). Op.: 181°C .

124. példa**(124) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 9,2-8,9 (m, 1H), 7,5 (s, 4H), 5,0-4,8 (m, 1H), 4,6-4,4 (m, 4H), 4,2-3,5 (m, 8H). Op.: 141°C .

125. példa**(125) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,54 (s, 4H), 6,81 (széles t, 1H), 4,91 (m, 1H), 4,67-4,58 (m, 2H), 4,50 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,13 -3,82 (m, 6H), 3,68-3,63 (m, 2H), 3,38 (s, 3H).
Op.: 149°C.

126. példa**(126) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,55 (s, 4H), 7,26 (s, 2H), 6,7 (s, 1H), 5,93 (m, 1H), 5,29 (m, 2H), 4,9 (m, 3H), 4,5 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,0 (m, 6H). Op.: 150°C.

127. példa**(127) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,54 (s, 4H), 6,57 (s, 1H), 5,5 (m, 1H), 4,92 (m, 1H), 4,5 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,0 (m, 6H), 1,31 (dd, $J = 10,2$ Hz és 13,8 Hz, 6H). Op.: 140°C.

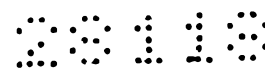
128. példa**(128) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,72 (d, $J = 9,2$ Hz, 2H), 7,31-7,01 (m, 4H), 6,77 (széles s, 1H), 4,97-4,96 (m, 1H), 4,19-3,91 (m, 7H). Op.: 141°C.

129. példa**(129) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,73 (d, $J = 8,8$ Hz, 2H), 7,56 (d, $J = 8,8$ Hz, 2H), 7,31-7,01 (m, 4H), 6,70 (széles s, 1H), 4,97 (m, 1H), 4,55-4,44 (q, $J = 6,8$ Hz, 2H), 4,19-3,92 (m, 4H), 1,32 (t, $J = 7,0$ Hz, 3H). Op.: 147°C.

130. példa

**(130) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 2,8 (s, 3H), 4,8 (t, 1H), 3,6 (m, 8H), 6,8 (t, 1H), 7,2 (d, 1H), 7,5 (dd, 1H). Op.: 218°C.

131. példa**(131) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 1,5 (s, 3H), 2,9 (s, 3H), 3,6 (t, 2H), 4,9 (m, 1H), 6,8 (m, 1H), 7,8 (d, 2H). Op.: 209°C.

132. példa**(132) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 9,5 (széles s, 1H), 7,4 (d, $J = 8,8$ Hz, 2H), 6,6 (d, $J = 8,8$ Hz, 2H), 4,90-4,80 (m, 1H), 4,7 (s, 2H), 4,2-3,4 (m, 9H), 2,9 (s, 3H). Op.: 205°C.

133. példa**(133) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,5 (m, 2H), 7,1 (m, 1H), 6,9 (s, 1H), 4,9 (m, 1H), 3,8 (m, 9H), 3,4 (t, $J = 8,8$ Hz, 2H), 2,9 (s, 3H). Op.: 146°C.

134. példa**(134) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,6-7,2 (m, 9H), 6,7 (széles t, 1H), 5,04-4,8 (m, 1H), 4,5 (s, 2H), 4,2-3,6 (m, 9H), 3,4 (t, $J = 8,8$ Hz, 2H). Op.: 170°C.

135. példa**(135) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,6-7,2 (m, 9H), 6,7 (széles t, 1H), 5,0-4,8 (m, 1H), 4,6-4,4 (m, 4H), 4,2-3,6 (m, 6H), 3,7 (t, $J = 8,3$ Hz, 2H), 1,3 (t, $J = 6,8$ Hz, 3H). Op.: 160°C.

136. példa**(136) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 9,5 (m, 1H), 7,6 (m, 4H), 7,4 (m, 3H), 7,0 (m, 1H), 4,9 (m, 1H), 4,2 (m, 1H), 3,8-4,0 (m, 7H), 3,3 (s, 3H). Op.: 174°C.

137. példa**(137) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 9,5 (m, 1H), 7,6 (m, 4H), 7,3 (m, 3H), 7,1 (t, 1H), 4,8 (m, 1H), 4,4 (m, 2H), 4,2 (m, 1H), 3,7-4,1 (m, 5H), 3,5 (m, 2H), 1,2 (t, 3H). Op.: 195°C.

138. példa**(138) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,5 (m, 4H), 7,0 (m, 4H), 4,9 (m, 1H), 4,0 (11H). Op.: 208°C.

139. példa**(139) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,6 (m, 4H), 7,0-7,2 (m, 3H), 4,9 (m, 2H), 4,5 (m, 2H), 4,0 (m, 8H), 1,3 (t, 3H). Op.: 215°C.

140. példa**(140) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,5 (m, 4H), 7,0 (m, 3H), 5,5 (m, 1H), 4,9 (m, 1H), 4,0 (m, 8H), 1,3 (t, 6H). Op.: 220°C.

141. példa**(141) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 9,60-9,40 (m, 1H), 7,57 (s, 4H), 5,00-4,75 (m, 1H), 4,44-3,40 (m, 12H), 2,16 (s, 6H). Op.: 161°C.

142. példa**(142) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,40 (dd, $J = 17,6$ Hz, 2,4 Hz, 1H), 7,24 (d, $J = 9,7$ Hz, 2H), 7,04 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 6,89 (d, $J = 8,8$ Hz, 2H), 6,78 (széles t, 1H), 6,58-6,49 (m, 1H), 5,00-4,80 (m, 1H), 4,75 (s, 2H), 4,54 (s, 2H), 4,20-3,60 (m, 9H), 3,81 (s, 3H).

Op.: 158°C.

143. példa**(143) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO-d_6), δ : 9,50-9,35 (m, 1 H), 7,60-6,60 (m, 8H), 5,50-5,30 (m, 1H), 4,95-4,70 (m, 1H), 4,74 (s, 2H), 4,55 (s, 2H), 4,20-3,25 (m, 6H), 1,40-1,10 (széles d, 6H). Op.: 192°C.

144. példa**(144) képletű vegyület**

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO-d_6), δ : 9,55-9,35 (m, 1H), 7,45 (d, $J = 18,1$ Hz, 1H), 7,15 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 6,90-6,80 (m, 1H), 6,09 (t, $J = 6,8$ Hz, 1H), 4,87 (s, 2H), 4,90-4,75 (m, 1H), 4,71 (d, $J = 6,8$ Hz, 2H), 4,20-3,10 (m, 9H). Op.: 184°C.

J) Általános eljárás a 12. ábrán bemutatott átalakításhoz, ahol Ar jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen fenilgyűrű.

360 mg (7,5 mmól) nátrium-hidridet hozzáadunk 300 mg (0,75 mmól) kiindulási anyag 30 ml vízmentes tetrahidrofuranban készült oldatához, és a kapott szuszpenziót szobahőmérsékleten kevertetjük egy éjszakán át. A reakciókeveréket 150 ml etil-acetáttal meghígítjuk, vízzel, sóoldattal mossuk és szárítjuk. A bepárlás után kapott maradékot szilikagéloszlopon átengedve, hozzájutunk 150 mg (54 %) termékhez színtelen szilárd anyag alakjában.



A 145. példa vegyületet az J) általános eljárás szerint állítjuk elő.

145. példa

(145) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, DMSO- d_6), δ : 9,60-9,40 (m, 1H), 8,62 (s, 1H), 7,45 (d, $J = 16,2$ Hz, 1H), 7,16 (d, $J = 8,6$ Hz, 1H), 6,90-6,80 (m, 1H), 4,90-4,75 (m, 1H), 4,73 (s, 2H), 4,20-3,40 (m, 9H). Op.: 223°C.

K) Általános eljárás a 13. ábrán bemutatott átalakításhoz, ahol Ar jelentése helyettesített fenilgyűrű, és R^b jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy aralkilcsoport.

1 egyenértéktömeg kiindulási anyag vízmentes dimetil-formamidban készült, 0°C hőmérsékletű oldatához argongáz alatt hozzáadunk 1,2 egyenértéktömeg nátrium-hidridet, majd ezt követően 1,2 egyenértéktömeg megfelelő alkil-halogenidet vagy aralkil-halogenidet. A reakciókeveréket 2-6 órán át kevertetjük, a reakció előrehaladtát vékonyrétegkromatográfiával követve nyomon. Amint a kiindulási anyag teljesen felhasználódott, a reakciókeveréket etil-acetáttal hígítjuk, vízzel, sóoldattal mossuk és szárítjuk. A bepárlás után kapott maradékot szilikagéloszlopon átengedve, hozzájutunk a kívánt termékhez.

A 146-149. példák vegyületeit a K) általános eljárás szerint állítjuk elő.

146. példa

(146) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, DMSO- d_6), δ : 9,60-9,40 (m, 1H), 7,49 (dd, $J = 15,6, 2,4$ Hz, 1H), 7,18 (d, $J = 9,1$ Hz, 1H), 6,95-6,80 (m, 1H), 5,17 (s, 2H), 4,95-4,70 (m, 1H), 4,42 (s, 2H), 4,20-3,40 (m, 7H). Op.: 195°C.

147. példa

(147) képletű vegyület



- $^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,46 (dd, $J = 15,1, 2,4$ Hz, 1H), 7,10 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H),
- 6,77 (széles t, 1H), 6,65-6,56 (m, 1H), 4,97 (s, 2H), 4,97-4,80 (m, 1H), 4,84 (s, 2H), 4,20-3,55 (m, 9H), 3,37 (s, 3H). Op.: 160°C .

148. példa

(148) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, $\text{CDCl}_3 + \text{DMSO-d}_6$), δ : 9,95-9,25 (m, 1H), 7,55-7,25 (m, 6H), 7,45 (d, $J = 15,4$ Hz, 1H), 6,63-6,54 (m, 1H), 5,00-4,80 (m, 1 H), 4,77 (s, 2H), 4,60 (s, 2H), 4,20-3,75 (m, 9H). Op.: 176°C .

149. példa

(149) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,50-7,20 (m, 6H), 7,04 (d, $J = 8,6$ Hz, 1H), 6,78 (széles t, 1H), 6,58-6,49 (m, 1H), 5,00-4,35 (m, 7H), 4,20-3,60 (m, 6H), 1,31 (t, $J = 7,0$ Hz, 3H). Op.: 184°C .

L) Általános eljárás a 14. ábrán bemutatott átalakításhoz, ahol az általános képletekben Ox jelentése két heteroatomot - ami lehet oxigén-, nitrogén- vagy kénatom - tartalmazó, $=\text{O}$ vagy $=\text{S}$ képletű csoporttal helyettesített, öttagú heterociklusos csoport, mely kondenzált lehet egy helyettesített vagy helyettesítetlen fenilgyűrűvel, Ar jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen fenilgyűrű, R' jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, helyettesített vagy helyettesítetlen aralkil-, heteroaralkil-, 1-6 szénatomos alkilcsoport, és R' jelentése hidrogénatom vagy alkilcsoport, vagy az R' és R'' együtt egy öt- vagy hattagú gyűrűs szerkezetet alkot, mely egy vagy két heteroatomot tartalmaz.

Az izotiocianát tetrahidrofuránban készült, -10°C hőmérsékletű oldatán ammóniagázt (vagy a megfelelő amint) buborékolatunk át 20 percen át. A reakciókeveréket



- szobahőmérsékleten kevertetjük 1 órán át, majd etil-acetáttal meghígítjuk. A szerves fázist kétszer vízzel, majd sóoldattal mossuk és szárítjuk. A bepárlás után kapott maradékot szilikagéloszlopon átengedve, hozzájutunk a kívánt termékhez.

A 150-163. példák vegyületeit a L) általános eljárás szerint állítjuk elő.

150. példa

(150) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,51 (s, 4H), 4,98-4,95 (m, 1H), 4,49 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,17-3,88 (m, 8H), 3,71-3,69 (m, 3H), 1,93-1,78b (m, 4H). Op.: 159°C.

151. példa

(151) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, DMSO-d_6), δ : 7,63 (s, 1H), 7,57 (s, 4H), 4,94-4,91 (m, 1H), 4,44 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,17-3,75 (m, 6H), 3,66-3,56 (q, $J = 6,8$ Hz, 4H), 1,07 (t, $J = 6,8$ Hz, 6H). Op.: 103°C.

152. példa

(152) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, DMSO-d_6), δ : 7,79 (széles s, 1H), 7,57 (s, 4H), 5,80-5,75 (m, 1H), 5,15-5,01 (m, 2H), 4,86 (m, 1H), 4,44 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,17-4,01 (m, 5H), 3,85 (m, 2H). Op.: 171°C.

153. példa

(153) képletű vegyület

^1H -NMR (200 MHz, DMSO-d_6), δ : 8,05 (széles s, 1H), 7,86 (széles s, 1H), 7,57 (s, 4H), 7,25 (s, 5H), 4,88-4,84 (m, 1H), 4,67 (s, 2H), 4,44 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,16-4,01 (m, 3H), 3,89-3,86 (m, 3H). Op.: 181°C.

154. példa**(154) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, DMSO- d_6), δ : 8,00 (széles s, 1h), 7,80 (széles s, 1h), 7,57 (s, 4H), 7,19-7,15 (d, $J = 8,4$ Hz, 2H), 6,84-6,80 (d, $J = 8,2$ Hz, 2H), 4,86 (széles s, 1H), 4,57 (széles s, 2H), 4,44 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,08-4,01 (m, 3H), 3,88-3,85 (m, 3H), 3,70 (s, 3H). Op.: 169°C.

155. példa**(155) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, DMSO- d_6), δ : 8,50-8,48 (d, $J = 3,8$ Hz, 1H), 8,16 (m, 2H), 7,69 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 7,57 (s, 4H), 7,26-7,22 (d, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,88 (m, 1H), 4,75 (széles s, 2H), 4,44 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,18-4,01 (m, 3H), 3,89-3,82 (m, 3H). Op.: 165°C.

156. példa**(156) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, DMSO- d_6), δ : 7,77 (széles s, 1H), 7,57 (s, 5H), 4,86 (m, 1H), 4,44 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,17-4,01 (m, 3H), 3,81-3,33 (m, 3H), 2,83 (széles s, 3H). Op.: 175°C.

157. példa**(157) képletű vegyület**

^1H -NMR (200 MHz, DMSO- d_6), δ : 7,86 (váll, 1H), 7,66 (váll, 1H), 7,57 (s, 4H), 4,78-4,68 (m, 2H), 4,43 (t, $J = 7,2$ Hz, 2H), 4,12-4,01 (m, 3H), 3,83 (széles s, 3H), 3,46-3,33 (m, 4H). Op.: 161°C.

158. példa**(158) képletű vegyület**



- $^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO- d_6), δ : 8,05 (váll, 1H), 7,57 (s, 4H), 4,95 (m, 1H), 4,43 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 4,08-3,89 (m, 8H), 2,57 (s, 4H), 2,49 (s, 4H). Op.: 159°C.

159. példa

(159) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO- d_6), δ : 12,06 (széles s, 1H), 10,76 (s, 1H), 8,14-8,11 (d, J = 5,0 Hz, 1H), 7,77 (t, J = 8,2 Hz, 1H), 7,52 (s, 4H), 7,17-7,13 (d, J = 3,2 Hz, 1H), 7,04 (t, J = 5,8 Hz, 1H), 5,05-5,03 (m, 1H), 4,43 (t, J = 7,4 Hz, 2H), 4,22 (t, J = 9,2 Hz, 1H), 4,07-3,84 (m, 5H). Op.: 189°C.

160. példa

(160) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3 + DMSO- d_6), δ : 8,07 (széles s, 1H), 7,62-7,40 (m, 2H), 7,16 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 6,65 (széles s, 1H), 4,85 (széles s, 1H), 4,48 (t, J = 8,0 Hz, 2H), 4,04-3,96 (m, 6H). Op.: 178°C.

161. példa

(161) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3 + DMSO- d_6), δ : 7,68-7,19 (m, 5H), 4,92 (váll, 1H), 4,53 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 4,08-3,98 (m, 6H), 3,10 (s, 3H). Op.: 144°C.

162. példa

(162) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO- d_6), δ : 8,10 (széles s, 1H), 7,35 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,58 (széles s, 1H), 4,91-4,89 (m, 1H), 4,58 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 4,54-3,87 (m, 6H). Op.: 92°C.

163. példa

(163) képletű vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, CDCl_3), δ : 7,26 (s, 2H), 6,39 (váll, 2H), 4,93 (váll, 1H), 4,60 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 4,21-3,93 (m, 6H), 2,99 (d, $J = 4,8$ Hz, 3H). Op.: 113°C .

164. példa**N1-((5S)-3-{3-Fluor-4-[3-benzil-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxa-zolan-5-il-metil)-etil-tiokarbamát-hidroklorid (164) képletű vegyület**

Az 141. példában leírtak szerint kapott N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-benzil-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tio-karbamátot metanolban felvesszük és sósavgázt buborékolatunk át az oldaton 30 percen keresztül. Ezután a metanolt elpároljuk, a kapott maradékot dietil-éterrel kétszer mossuk, 100 %-os hozammal hozzájutva a cím szerinti vegyülethez. Op.: 100°C (higroszkópos).

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, DMSO-d_6), δ : 10,60 (széles s, 1H), 9,85-9,65 (m, 1H), 7,58 (s, 4H), 5,00-4,65 (m, 3H), 4,44 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 4,25-3,40 (m, 8H), 2,81 (s, 3H), 2,79 (s, 3H).

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése halogénatom, azido-, tioalkohol-, izotiocianát, OR^4 , NHR^4 vagy $N(R^4)_2$ általános képletű csoport, ahol R^4 jelentése hidrogénatom vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: acil-, tioacil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, 3-6 szénatomos cikloalkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-karbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-karbonil-, aril-oxi-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-tiokarbonil-, aril-oxi-tiokarbonil-csoport, $-C(=O)C(=O)$ -alkil, $-C(=O)-C(=O)$ -aril, $-C(=O)-C(=O)$ alkoxi, $-C(=O)-C(=O)$ -aril-oxi, $-(C=S)-S$ -alkil, $-(C=S)-NH_2$, $-(C=)-NH$ -alkil, $-C(=S)-N$ -alkil₂, $-C(=S)-NH$ -alkenil, $(C=S)-(C=O)$ -alkoxi, $-(C=S)-(C=O)$ -aril-oxi, $-C(=S)-O-(C=O)$ -alkil, $C(=S)-C(=S)$ -alkil, $-C(=S)-C(=S)$ -aril általános képletű csoport, tiomorfolinil-tiokarbonil- vagy pirrolidinil-tiokarbonil-csoport;

R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;



- Y^1 jelentése =O vagy =S képletű csoport;
- Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, =O, =S képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sója, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátja.

2. Az 1. igénypont szerinti vegyület, ahol R^4 jelentése halogénatom, hidroxil-, amino-, monoalkil-amino-, dialkila-mino-, ciano-, nitro-, alkoxi-, aril-, hidroxil-aril-, piridil-, hidroxil-alkil-, alkoxil-aril- vagy karboxilcsoport és ennek származékai.

3. Az 1. igénypont szerinti vegyület, ahol R^b jelentése halogénatom, hidroxil-, pirrolidinil-tiokarbonil-, nitro-, amino-, alkoxi-, karboxil- vagy cianocsoport.

4. Az 1. igénypont szerinti vegyület, ahol az Y^2 vagy Y^3 csoporton lévő szubsztituens hidroxil-, nitro-, ciano-, amino-, terc-butildimetil-szilil-oxi (TBSO), halo-

- gén-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 3-6 szénatomos cikloalkil-, aril-, benzil-oxi-, acil-, karboxil- vagy acil-oxi-csoport.

5. Az 1. igénypont szerinti vegyület, ahol Y^2 és Y^3 által képzett gyűrűs szerkezet helyettesített vagy helyettesítetlen benzol-, piridin-, pirrolidin-, furán-, tiofén-, morfolin-, piperazin- vagy pirrolgyűrűs szerkezet.

6. Az 1. igénypont szerinti alábbi (I) általános képletű vegyület:

(5R)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-3-[3-fluor-4-(2-tioxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-3-[3-fluor-4-(2-tioxo-1,3-tiazolan-3-il)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxazolan-2-on,

3-{2-fluor-4-[(5R)-5-hidoxi-metil-2-oxo-1,3-oxazolan-3-il]-fenil}-2,3-dihidrobenzo[d][1,3]oxazol-2-on,

3-{2-fluor-4-[(5R)-5-hidoxi-metil-2-oxo-1,3-oxazolan-3-il]-fenil}-6-metil-2,3-dihidrobenzo[d][1,3]oxazol-2-on,

3-{2-fluor-4-[(5R)-5-hidoxi-metil-2-oxo-1,3-oxazolan-3-il]-fenil}-5-metil-2,3-dihidrobenzo[d][1,3]oxazol-2-on,

(5R)-5-hidroxi-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-3-[2-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-3-[3,5-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxazolan,
 -2-on,

(5R)-5-hidroxi-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-3-on,
 3-{4-[(5R)-5-hidroxi-metil-2-oxo-1,3-oxazolan-3-il]-fenil}-2,3-dihidrobenco-
 [d][1,3]-oxazol-2-on,

(5R)-3-[3-fluor-4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxa-
 zolan-2-on,

(5R)-3-{3-fluor-4-[3-(4-metoxi-benzil)-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-5-hidroxi-
 -metil-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxa-
 zolan-2-on,

(5R)-5-hidroxi-metil-3-[4-(3-metil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxazolan-
 -2-on,

(5R)-5-hidroxi-metil-3-[4-(3-benzil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxazolan-
 -2-on,

(5R)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-3-fenil-1-imidazolidinil)-fenil]-5-hidroxi-metil-1,3-oxa-
 zolan-2-on,

(5R)-3-{3-fluor-4-[3-(fluor-fenil)-2-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-5-hidroxi-metil-
 -1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-azido-metil-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-
 -on,

(5R)-azido-metil-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxa-
 zolan-2-on,

3-{4-[(5R)-5-azido-metil-2-oxo-1,3-oxazolan-3-il]-2-fluor-fenil}-6-metil-2,3-di-
 hidro-benzo[d][1,3]oxazol-2-on,



3-{4-[(5R)-5-azido-metil-2-oxo-1,3-oxazolan-3-il]-2-fluor-fenil}-5-metil-2,3-dihidrobenzo[d][1,3]oxazol-2-on,
 (5R)-5-azido-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,
 (5R)-5-azido-metil-3-[2-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,
 (5R)-azido-metil-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,
 (5R)-5-azido-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,
 3-{4-[(5R)-5-azido-metil-2-oxo-1,2-oxazolan-3-il]-fenil}-2,3-dihidrobenzo[d][1,3]oxazol-2-on,
 (5R)-5-azido-metil-3-[3-fluor-4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,
 (5R)-5-azido-metil-3-[3-fluor-4-(3-fenil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,
 (5R)-5-azido-metil-3-{3-fluor-4-[3-(4-fluor-fenil)-2-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-1,3-oxazolan-2-on,
 (5R)-amino-metil-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,
 (5R)-amino-metil-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,
 (5R)-5-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,
 (5R)-5-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,
 (5R)-5-amino-metil-3-[3-fluor-4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5R)-5-amino-metil-3-[3-fluor-4-(3-benzil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

N-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metánamid,

N-((5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metánamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-acetamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-propánamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-butánamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-pentánamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-heptánamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-akrilamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-2,2,2-trifluor-acetamid,

etil-(5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil-karbamoil-metanoát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-tioxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-acetamid,

- N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-tioxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil}-
-acetamid,
- N1-((5S)-2-oxo-3-[3-fluor-4-(2-tioxo-1,3-tiazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-
-5-il-metil}-acetamid,
- N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-
-5-il-metil}-acetamid,
- N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-2,3-dihidrobenczo[d][1,3]oxazol-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-
-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,
- N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(6-metil-2-oxo-2,3-dihidrobenczo[d][1,3]oxazol-3-il)-fenil]-
-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,
- N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(5-metil-2-oxo-2,3-dihidrobenczo[d][1,3]oxazol-3-il)-fenil]-
-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,
- N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-
-5-il-metil}-acetamid,
- N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-
-5-il-metil}-propánamid,
- N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-
-5-il-metil}-heptánamid,
- N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-
-5-il-metil}-akrilamid,
- N1-((5S)-3-[2-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-
-metil}-acetamid,
- N1-((5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-
-il-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-propánamid,

N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,

N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-2,3-dihidrobencod[1,3]oxazol-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-benzil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-[4-(3-metil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-[4-(3-benzil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-fenil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil}-acetamid,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-(4-fluor-fenil)-2-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-acetamid,

(5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-(1-tioxo-etil-amino-metil)-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-(3,3,3-trifluor-1-tioxo-propil-amino-metil)-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-5-(1-tioxo-etil-amino-metil)-1,3-oxazolan-2-on,

3-{2-fluor-4-[(5S)-2-oxo-5-(1-tioxo-etil-amino-metil)-1,3-oxazolan-3-il]-fenil}-2,3-dihidrobenzo[d][1,3]oxazol-2-on,

(5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-5-(1-tioxo-etil-amino-metil)-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-(1-tioxo-etil-amino-metil)-1,3-oxazolan-2-on

(5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-(1-tioxo-propil-amino-metil)-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-(1-tioxo-etil-amino-metil)-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-5-(1-tioxo-etil-amino-metil)-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[3-fluor-4-(3-fenil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-5-(1-tioxo-etil-amino-metil)-1,3-oxazolan-2-on,

N1-[(5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil]-metil-karbamát,

N1-[(5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil]-metil-karbamát,

N1-[(5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil]-metil-karbamát,

N1-[(5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil]-metil-karbamát,



N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-karbamát,

(5S)-5-metil-tioxi-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

N1-((5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-ditiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tiokabamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-trifluor-acetoxi-tiokarbamát,

(5S)-5-ciklohexil-oxi-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(2-tioxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-1-propil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-2-propil-tiokarbamát,



N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-3-trifluor-metil-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-1-propil-tiokarbamát,

(5S)-5-[2,2,2-trifluor-etil-oxi-(tioxo)-metil-amino-metil]-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-[2-hidroxi-etil-oxi-(tioxo)-metil-amino-metil]-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-[2-metoxi-etil-oxi-(tioxo)-metil-amino-metil]-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

N1-((5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-allil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolin-3-il)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-2-propil-tiokarbamát,

N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-2,3-dihydrobenzo[d][1,3]oxazol-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,



N1-((5S)-2-oxo-3-[4-(2-oxo-2,3-dihydrobenzo[d][1,3]oxazol-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[4-(3-metil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[4-(3-metil-4-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-metil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[4-(3-benzil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[4-(3-benzil-2-oxo-2-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tiokarbamát,

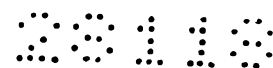
N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-fenil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-(3-fenil-2-oxo-1-imidazolidinil)-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-[3-(4-fluor-fenil)-2-oxo-1-imidazolidinil]-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-[3-(4-fluor-fenil)-2-oxo-1-imidazolidinil]-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-[3-fluor-4-[3-(4-fluor-fenil)-2-oxo-1-imidazolidinil]-fenil]-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-2-propil-tiokarbamát,



N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-metoxi-metil-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-benzil-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-benzil-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-etil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{4-[4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-(N,N-dimetil-amino)-etil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-(4-metoxi-benzil)-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolin-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-benzil-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-izopropil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[3-hidroxi-metil-4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-[4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

N1-((5S)-3-{3-fluor-4-(3-metil-4-tioxo-1-imidazolidinil)-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-metil-tiokarbamát,

(5S)-5-[(2S)-2-hidroxi-metil-azolan-1-il-(tioxo)-metil-amino-metil]-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-dietil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-allil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,



(5S)-5-benzil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-[4-metoxi-benzil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil]-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan,

(5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-[2-piridil-metil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-metil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-[2-hidroxi-etil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil]-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-[1,4-tizinan-4-il-(tioxo)-metil-amino-metil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-[2-piridil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-amino-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-3-[3-fluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-metil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil-1,3-oxazolan-2-on,

(5S)-5-amino-(tioxo)-metil-amino-metil-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-1,3-oxazolan-2-on, vagy sója,

(5S)-3-[3,5-difluor-4-(2-oxo-1,3-oxazolan-3-il)-fenil]-5-metil-amino-(tioxo)-metil-amino-metil-1,3-oxazolan-2-on,

N1-((5S)-3-{4-[4-oxo-1-imidazolidinil]-fenil}-2-oxo-1,3-oxazolan-5-il-metil)-(N,N-dimetil-amino)-etio-karokarbamát-hidroklorid



vagy ezek sói.

7. Az 1. vagy 6. igénypont szerinti vegyület, ahol a gyógyászati szempontból alkalmazható sók lítium-, nátrium-, kálium-, kalcium-, magnézium-, vas-, réz-, cink-, mangánsó; szerves bázissal, királis bázissal, természetes aminosavval, nem-természetes aminosavval, helyettesített aminosavval, guanidinnel, helyettesített guanidinnel; ammóniával, helyettesített ammóniával, alumíniummal képlett sók vagy savaddíciós sók.

8. Eljárás az (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, ahol R^4 jelentése hidrogénatom;

R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;

Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport;

Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, $=O$, $=S$ képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-

karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói vagy gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, mely abból áll, hogy

(i) a (III) általános képletű - ahol valamennyi csoport a fentiekben meghatározott - vegyületet (IV) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport, R^2 és R^3 jelentése azonos a korábbi meghatározásokkal - vegyülettel reagáltatjuk, az (V) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve;

(ii) az (V) általános képletű vegyületet redukáljuk a (VI) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve;

(iii) a (VI) általános képletű vegyületet alkil-klór-formiáttal reagáltatjuk, a (VII) általános képletű - ahol R^c jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport, Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve;

(iv) a (VII) általános képletű vegyületet bázis jelenlétében (VIII) általános képletű - ahol R_{12} jelentése 1-3 szénatomos alkilcsoport - vegyülettel reagáltatjuk, az (I) általános képletű, ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve;



(v) az (I) általános képletű vegyületet alkil-szulfonil-kloriddal vagy aril-szulfonil-kloriddal reagáltatjuk, az (I) általános képletű vegyületet nyerve, ahol R^1 jelentése alkil-szulfonil- vagy aril-szulfonil-csoport, amit nátrium-aziddal reagáltatva, megkapjuk az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése azidocsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet;

(vi) az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése azidocsoport - vegyületet redukáljuk, (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése hidrogénatom; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve.

9. Eljárás az (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése hidroxilcsoport;

R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;

Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport;

Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, $=O$, $=S$ képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénato-

mos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, ami abból áll, hogy

(i) a (VI) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fenti meghatározásokkal - vegyületet a (IX) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport - vegyülettel reagáltatjuk, a (X) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyület nyerve; és

(ii) a (X) általános képletű vegyületet alkalmas karbonilező szerrel karbonilezzük, az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport és Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a fentiekben meghatározott - vegyülethez jutva.

10. Eljárás az (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése azidocsoport;

R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános

- képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6
- szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;

Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport;

Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, $=O$, $=S$ képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, ami abból áll, hogy



- (i) a (VII) általános képletű - ahol R^c jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet (XI) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport - vegyülettel reagáltatjuk, a (XII) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet nyerve;
- (ii) a fentiekben meghatározott (XII) általános képletű vegyületet (XIII) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületté alakítjuk; és
- (iii) a fentiekben meghatározott (XIII) általános képletű vegyületet szerves vagy szervetlen aziddal reagáltatva, az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése azidocsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületté alakítjuk.

11. Eljárás az (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése azidocsoport;

R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;

Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport;



- Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, =O, =S képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, ami abból áll, hogy

- (i) a (VII) általános képletű - ahol R^c jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet (XVII) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport - vegyülettel reagáltatjuk, a (XVIII) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet nyerve;
- (ii) a fentiekben meghatározott (XVIII) általános képletű vegyületet szerves vagy szervetlen aziddal reagáltatva, (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése azidocsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározott - vegyületté alakítjuk.

12. Eljárás az (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése hidroxilcsoport;

R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;

Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport;

Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, $=O$, $=S$ képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -



- vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai,
- gyógyászati szempontból alkalmazható sói, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, ami abból áll, hogy
 - (i) a (VII) általános képletű - ahol R^c jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet (XIV) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport - vegyülettel reagáltatjuk, a (XV) általános képletű - ahol R^c jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet nyerve;
 - (ii) a (XV) általános képletű vegyület acetamid részét hidrolizáljuk, a (XVI) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet nyerve; és
 - (iii) a (XVI) általános képletű vegyületet bázissal vagy anélkül gyűrűvé zárjuk, megkapva az (I) általános képletű - ahol R^c jelentése hidroxilcsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet nyerve.

13. Eljárás az (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése acetyl csoport; R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;



- Y^1 jelentése =O vagy =S képletű csoport;
- Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, =O, =S képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

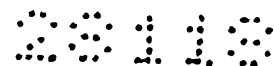
Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, ami abból áll, hogy

- (i) a (VII) általános képletű - ahol R^c jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet a (XIX) képletű vegyülettel reagáltatjuk, az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése acetyl csoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet nyerve.

14. Eljárás az (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyben belül R^4 jelentése formilcsoport;



- R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos
- alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;

Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport;

Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, $=O$, $=S$ képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói, gyógyászati szempontból alkalmazható

szolvátjai előállítására, ami abból áll, hogy az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése hidrogénatom és Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet alkil-formiáttal formilezzük.

15. Eljárás az (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése $-C(=O)-R^{4a}$ általános képletű csoport, ahol R^{4a} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 2-6 szénatomos alkenil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, aril-oxi-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-, aril-oxi-karbonil- vagy 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport; R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;

Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport;

Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, $=O$, $=S$ képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-

karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, ami abból áll, hogy az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése hidrogénatom; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet halogeniddel acetilezzük.

16. Eljárás az (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül

R^4 jelentése acetylcsopót;

R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;

Y^1 jelentése =O vagy =S képletű csoport;

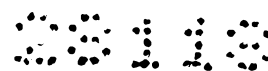
Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, =O, =S képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, ami abból áll, hogy az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése azidocsoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet tioecetsavval reagáltatjuk.

17. Eljárás az (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése $-C(=S)-R^{4b}$ általános képletű csoport, ahol R^{4b} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport, $-C(=O)-(1-6 \text{ szénatomos})\text{aloxi-}$, $-C(=O)\text{-aril-oxi-}$, $-C(=S)-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil-}$ vagy $-C(=S)\text{-aril}$ általános képletű csoport;



R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

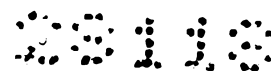
Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;

Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport;

Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, $=O$, $=S$ képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói, gyógyászati szempontból alkalmazható



szolvátjai előállítására, ami abból áll, hogy az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése $-C(=O)-R^{4b}$ általános képletű csoport, ahol R^{4b} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport, $-(=O)-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkoxi}$, $-C(=O)\text{-aril-oxi}$, $-C(=S)-(1-6 \text{ szénatomos})\text{alkil-}$ vagy $-C(=S)\text{-aril}$ általános képletű csoport; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet 2,4-bisz(metoxi-fenil)-1,3-ditia-2,4-difoszfetán-2,4-diszulfiddal (Lawesson reagens) reagáltatjuk.

18. Eljárás az (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése $-C(=S)-SR^{4c}$ általános képletű csoport, ahol R^{4c} jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport;

R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;

Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport;

Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, $=O$, $=S$ képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6

szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, ami abból áll, hogy az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése hidrogénatom; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet széndiszulfiddal, megfelelő alkil-halogeniddel és egy bázissal, ami lehet trietil-amin, diizopropil-etil-amin, kálium-karbonát, nátrium-hidrid vagy kálium-terc-butoxid, reagáltatjuk.

19. Eljárás az (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése $-C(=S)-OR^{4d}$ általános képletű csoport, ahol R^{4d} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, fluoratómmal helyettesített $-C(=O)-(1-6$ szénatomos)alkilcsoport, aril-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil- vagy 2-6 szénatomos alkenilcsoport;

R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános

képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;

Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport;

Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, $=O$, $=S$ képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, ami abból áll, hogy



- (i) az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése hidrogénatom; Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése azonos a fentebb tett meghatározásokkal - vegyületet tiofoszfénnel reagáltatva (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése izotiocianát-csoport és az összes többi jelölés a fentiekben meghatározott - vegyületté alakítjuk; és
- (ii) az (I) általános képletű vegyületet, ahol R^1 jelentése izotiocianát-csoport - vegyületet alkohollal reagáltatva, (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése $-C(=S)-OR^{4d}$ általános képletű csoport, ahol R^{4d} jelentése 1-6 szénatomos alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, fluoratómmal helyettesített $-(C=O)-(1-6 \text{ szénatomos})$ alkil általános képletű, aril-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil- vagy 2-6 szénatomos alkenilcsoport és az összes többi jelölés a fentiekben meghatározott - vegyületté alakítjuk.

20. Eljárás az (I) általános képletű - ahol

R^1 jelentése NHR^4 általános képletű csoport, melyben belül R^4 jelentése $-C(=S)-N(R'R'')$ általános képletű csoport, ahol R' jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, helyettesített vagy helyettesítetlen aralkil-, heteroaralkil-, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-csoport; R'' jelentése hidrogénatom vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport; vagy R' és R'' együtt egy 5- vagy 6 tagú gyűrűs szerkezetet képeznek, mely 1 vagy 2 heteroatomot tartalmaz;

R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyen belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport;

Z jelentése kén-, oxigénatom, =CH vagy NR^b képletű, illetve általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport;

Y^1 jelentése =O vagy =S képletű csoport;

Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, amino-, =O, =S képletű csoport vagy helyettesítetlen vagy helyettesített alábbi csoport: 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; vagy

Y^2 és Y^3 , amikor szomszédos szénatomokon helyezkedik el, együtt alkothatnak egy helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú, aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, mely adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmaz -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói, gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, ami abból áll, hogy az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése izotiocianát-csoport és az összes többi jelölés jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet ammóniagázzal vagy aminnal reagáltatjuk.

21. (VII) általános képletű, új köztesanyag, ahol a (VII) általános képletben R^c jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport; R^2 és R^3 egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyeken belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ képletű vagy NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport; Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, aminocsoport, $=O$, $=S$ képletű csoport, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; Y^2 és Y^3 ha szomszédos szénatomon helyezkednek el, együtt alkothatnak helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmazva.

22. Eljárás a 21. igénypont szerinti (VII) általános képletű - ahol Y^1, Y^2, Y^3, R^c , R^2, R^3 és Z jelentése azonos a 21. igénypontban tett meghatározásokkal - vegyület előállítására, ami abból áll, hogy

- (i) a (III) általános képletű - ahol Y^1, Y^2, Y^3 és Z jelentése a 21. igénypontban meghatározott - vegyületet (IV) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport; R^2 és R^3 jelentése a 21. igénypontban meghatározott - vegyülettel reagáltatjuk, az (V) általános képletű - ahol Y^1, Y^2, Y^3, R^2, R^3 és Z jelentése a 21. igénypontban meghatározott - vegyületet nyerve;
- (ii) az (V) általános képletű vegyületet (VI) általános képletű - ahol Y^1, Y^2, Y^3, R^2, R^3 és Z jelentése a 21. igénypontban meghatározott - vegyületté redukáljuk;
- (iii) a (VI) általános képletű vegyületet alkil-klór-formiáttal reagáltatjuk, a (VII) általános képletű - ahol R^c jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport, Y^1, Y^2, Y^3, R^2, R^3 és Z jelentése a 21. igénypontban meghatározott - vegyületet nyerve.

23. (VI) általános képletű, új köztesanyag, ahol a (VI) általános képletben R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a, NR^a, OR^a általános képletű csoport, melyeken belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ képletű vagy NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport; Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hid-roxil-,

aminocsoport, =O, =S képletű csoport, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; Y^2 és Y^3 , ha szomszédos szénatomon helyezkednek el, együtt alkothatnak helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmazva.

24. Eljárás a 23. igénypont szerinti (VII) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a 23. igénypontban meghatározott - vegyület előállítására, mely abból áll, hogy

(i) a (III) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 és Z jelentése a 23. igénypontban meghatározott - vegyületet (IV) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport; R^2 és R^3 jelentése a 23. igénypontban meghatározott - vegyülettel reagáltatjuk, az (V) általános képletű ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a 23. igénypontban meghatározott - vegyületet nyerve;

(ii) az (V) általános képletű vegyületet (VI) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a 23. igénypontban meghatározott - vegyületté redukáljuk.

25. (X) általános képletű, új köztesanyag, ahol a (X) általános képletben R^1 jelentése halogénatom, azido-, tialkohol-, izotiocianát-csoport, OR^4 , NHR^4 vagy $N(R^4)_2$ általános képletű csoport, ahol R^4 jelentése hidrogénatom vagy helyettesített vagy he-

- lyettesítetlen acil-, tioacil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, 3-6 szénatomos cikloalkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-karbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-karbonil-, aril-oxi-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-tiokarbonil-, aril-oxi-tiokarbonil-csoport, $\text{-C(=O)-C(=O)-alkil}$, -C(=O)-C(=O)-aril , $\text{-C(=O)-C(=O)-alkoxi}$, $\text{-C(=O)-C(=O)-aril-oxi}$, -(C=S)-S-alkil , -(C=S)-NH_2 , -(C=S)-NH-alkil , $\text{-(C=S)-N-(alkil)}_2$, -(C=S)-NH-alkil , $\text{(C=S)-(C=O)-alkoxi}$, $\text{(C=S)-(C=O)-aril-oxi}$, $\text{-C(=S)-O-(C=O)-alkil}$, $\text{-C(=S)-C(=S)-alkil}$, -C(=S)-C(=S)-aril általános képletű csoport, tiomorfolinil-tiokarbonil- vagy pirrolidinil-tiokarbonil-csoport; R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, cia-no-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyeken belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Z jelentése kén-, oxigénatom, =CH képletű vagy NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport; Y^1 jelentése =O vagy =S képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hid-roxil-, aminocsoport, =O , =S képletű csoport, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-,

di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; Y^2 és Y^3 , ha szomszédos szénatomon helyezkednek el, együtt alkothatnak helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmazva.

26. Eljárás a 25. igénypont szerinti (X) általános képletű - ahol R^1 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a 25. igénypontban meghatározott - vegyület előállítására, mely abból áll, hogy

(i) a (III) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 és Z jelentése a 25. igénypontban meghatározott - vegyületet (IV) általános képletű - ahol L leváló csoport; R^2 és R^3 jelentése a 25. igénypontban meghatározott - vegyülettel reagáltatjuk, az (V) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a 25. igénypontban meghatározott - vegyületet nyerve;

(ii) az (V) általános képletű vegyületet (VI) általános képletű - ahol Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a 25. igénypontban meghatározott - vegyületté redukáljuk; és

(iii) a (VI) általános képletű vegyületet (IX) általános képletű - ahol R^1 jelentése a 25. igénypontban meghatározott - vegyülettel reagáltatjuk.

27. (XVI) általános képletű, új köztesanyag, ahol a (XVI) általános képletben R^c jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport; R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyeken belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ képletű vagy NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyette-

sítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport; Y^1 jelentése =O vagy =S képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, aminocsoport, =O, =S képletű csoport, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport;

Y^2 és Y^3 , ha szomszédos szénatomon helyezkednek el, együtt alkothatnak helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmazva.

28. Eljárás a (XVI) általános képletű képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a 27 igénypontban meghatározott - vegyület előállítására, mely abból áll, hogy

- (i) a (VII) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a 27. igénypontban meghatározott - vegyületet (XIV) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport - vegyülettel reagáltatjuk, a (XV) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a 27. igénypontban meghatározott - vegyületet nyerve;

(ii) a (XV) általános képletű vegyület acetonid részét a szokásos módszerek alkalmazásával hidrolizáljuk, a (XVI) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a 27. igénypontban meghatározott - vegyületet nyerve.

29. (XVIII) általános képletű, új köztesanyag, ahol a (XVIII) általános képletben R^c jelentése 1-8 szénatomos alkilcsoport; R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyeken belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ képletű vagy NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport; Y^1 jelentése $=O$ vagy $=S$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, aminocsoport, $=O$, $=S$ képletű csoport, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; Y^2 és Y^3 , ha szomszédos szénatomon helyezkednek el, együtt alkothatnak helyettesített vagy helyettesítetlen,

5- vagy 6 tagú aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmazva.

30. Eljárás a 29. igénypont szerinti (XVIII) általános képletű vegyület - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a 29. igénypontban meghatározott - vegyület előállítására, mely abból áll, hogy a (VII) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a 29. igénypontban meghatározott - vegyületet (XVII) általános képletű - ahol L jelentése leváló csoport - vegyülettel reagáltatjuk, (XVIII) általános képletű - ahol R^c , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^2 , R^3 és Z jelentése a 29. igénypontban meghatározott - vegyületet nyerve.

31. Az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületet és gyógyászati szempontból alkalmazható vivőanyagot, közeganyagot, kötőanyagot vagy oldószert tartalmazó gyógyszerkészítmény.

32. A 31. igénypont szerinti gyógyszerkészítmény, mely tabletta, kapszula, por, szirup, oldat vagy szuszpenzió alakjában van.

33. Eljárás bakteriális fertőzés kezelésére, ami abból áll, hogy a rászoruló betegnek az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületet adjuk be.

34. Eljárás bakteriális fertőzés kezelésére, ami abból áll, hogy a rászoruló betegnek a 31. és 32. igénypont szerinti gyógyszerkészítményt adjuk be.

35. A 6. igénypont szerinti vegyületet és gyógyászati szempontból alkalmazható vivőanyagot, közeganyagot, kötőanyagot vagy oldószert tartalmazó gyógyszerkészítmény.

36. A 35. igénypont szerinti gyógyszerkészítmény, mely tabletta, kapszula, por, szirup, oldat vagy szuszpenzió alakjában van.

37. Eljárás bakteriális fertőzés kezelésére, ami abból áll, hogy a rászoruló betegnek a 6. igénypont szerinti vegyületet adjuk be.

38. Eljárás a bakteriális fertőzés kezelésére, ami abból áll, hogy a rászoruló betegnek a 35. és 36. igénypont szerinti gyógyszerkészítményt adjuk be.

39. Eljárás az (I) általános képletű - ahol Z jelentése NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom; Y^1 jelentése $=\text{O}$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom; R^1 jelentése halogénatom, azido-, izotiocianát-, tioalkoholcsoport, OR^4 , NHR^4 vagy $\text{N}(\text{R}^4)_2$ általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése hidrogénatom vagy helyettesített vagy helyettesítetlen acil-, tioacil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, 3-6 szénatomos cikloalkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-karbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-karbonil-, aril-oxi-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-tiokarbonil-, aril-oxi-tiokarbonil-csoport, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})$ -alkil, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})$ -aril, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})$ -alkoxi, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})$ -aril-oxi, $-\text{C}(=\text{S})-\text{S}$ -alkil, $-\text{C}(=\text{S})-\text{NH}_2$, $-\text{C}(=\text{S})-\text{NH}$ -alkil, $-\text{C}(=\text{S})-\text{N}(\text{alkil})_2$, $-\text{C}(=\text{S})-\text{NH}$ -alkenil, $-(\text{C}=\text{S})-(\text{C}=\text{O})$ -alkoxi, $-(\text{C}=\text{S})-(\text{C}=\text{O})$ -aril-oxi, $-\text{C}(=\text{S})-\text{O}-(\text{C}=\text{O})$ -alkil, $-\text{C}(=\text{S})-\text{C}(=\text{S})$ -alkil, $-\text{C}(=\text{S})-\text{C}(=\text{S})$ -aril, általános képletű csoport, tiomorfolinil-tiokarbonil- vagy pirrolidinil-tiokarbonil-csoport; R^2 és R^3 egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitrocsoporthoz, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyeken belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Z jelentése kén-, oxigénatom, $=\text{CH}$ képletű vagy NR^b általános képletű csoport, ahol R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-

- -karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport - vegyület,
- származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói vagy gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, ami abból áll, hogy az (I) általános képletű - ahol Z jelentése NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése az α -helyen hidroxilcsoporttal helyettesített, 1-6 szénatomos alkilcsoport, Y^1 jelentése $=\text{O}$ képletű csoport, Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom és az össze többi jelölés a fentiekben meghatározott - vegyületet egy bázissal reagáltatjuk.

40. Eljárás az (I) általános képletű - ahol Z jelentése NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil- vagy aralkilcsoport, Y^1 jelentése $=\text{O}$ képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom; R^1 jelentése halogénatom, azido-, izotiocianát-, tioalkoholcsoport, OR^4 , NHR^4 vagy $\text{N}(\text{R}^4)_2$ általános képletű csoport, melyen belül R^4 jelentése vagy helyettesített vagy helyettesítetlen acil-, tioacil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, 3-6 szénatomos cikloalkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-karbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-karbonil-, aril-oxi-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-tiokarbonil-, aril-oxi-tiokarbonil-csoport, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})$ -alkil, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})$ -aril, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})$ -alkoxi, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})$ -aril-oxi, $-\text{C}(=\text{S})$ -S-alkil, $-\text{C}(=\text{S})-\text{NH}_2$, $-\text{C}(=\text{S})-\text{NH}$ -alkil, $-\text{C}(=\text{S})-\text{N}(\text{alkil})_2$, $-\text{C}(=\text{S})-\text{NH}$ -alkenil, $-(\text{C}=\text{S})-(\text{C}=\text{O})$ -alkoxi, $-(\text{C}=\text{S})-(\text{C}=\text{O})$ -aril-oxi, $-\text{C}(=\text{S})-\text{O}-(\text{C}=\text{O})$ -alkil, $-\text{C}(=\text{S})-\text{C}(=\text{S})$ -alkil, $-\text{C}(=\text{S})-\text{C}(=\text{S})$ -aril, általános képletű csoport, tiomorfolinil-tiokarbonil- vagy pirrolidinil-tiokarbonil-csoport; R^2 és R^3 egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitrocsoport, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyeken belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-6 szénato-

mos alkilcsoport vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Z jelentése kén-, oxigénatom, =CH képletű vagy NR^b általános képletű csoport, ahol R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport - vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói vagy gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, ami abból áll, hogy az (I) általános képletű - ahol Z jelentése NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, Y^1 jelentése =O képletű csoport, Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom és az összes többi jelölés jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet bázissal és alkil-halogeniddel reagáltatjuk.

41. Az 1. igénypont szerinti vegyület, ahol az R^a szubsztituense halogénatom, hidroxil-, nitro-, amino-, alkoxi-, karboxil- vagy cianocsoport.

42. A 7. igénypont szerinti gyógyászati szempontból alkalmazható só, ahol a szerves bázissal képzett sóknál a szerves bázist az alábbiak közül választjuk ki: N,N'-diacetil-etilén-diamin, betain, koffein, 2-dietil-amino-etanol, 2-dimetil-amino-etanol, N-etil-morfolin, N-etil-piperidin, glükamin, glükóz-amin, hidrabamin, izopropil-amin, metil-glükamin, morfolin, piperazin, piperidin, prokain, purinok, teobromin, trietil-amin, trimetil-amin, tripropil-amin, trometamin, dietanol-amin, meglumin, etilén-diamin, N,N'-difenil-etilén-diamin, N,N'-dibenzil-etilén-diamin, N-benzil-fenil-etil-amin, kolin, kolin-hidroxid, diciklohexil-amin, metformin, benzil-amin, fenil-etil-amin, dialkil-amin, trialkil-amin, tiamin, amino-piridin, amino-pirimidin, purin, spermidin.

43. A 7. igénypont szerinti gyógyászati szempontból alkalmazható só, ahol a sót képező királis bázist az alábbiak közül választjuk ki: alkil-fenil-amin, glicinol, fenil-glicinol.

44. A 7. igénypont szerinti gyógyászati szempontból alkalmazható só, ahol a sót képező természetes aminosavat az alábbiak közül választjuk ki: glicin, alanin, valin, leucin, izoleucin, norleucin, tirozin, cisztin, cisztein, metionin, prolin, hidroxiprolin, hisztidin, ornitin, lizin, arginin, szerin, treonin, fenil-alanin.

45. A 7. igénypont szerinti gyógyászati szempontból alkalmazható só, ahol a sót képező nem-természetes aminosavat az alábbiak közül választjuk ki: D-izomerek, guanidin, szubsztituált guanidin, ahol a szubsztituens nitro-, amino-, alkilcsoport, például metil-, etil-, propilcsoport és hasonló; alkenilcsoport, például etanil-, propenil-, butenilcsoport és hasonló; alkinilcsoport, például etinil-, propinilcsoport.

46. A 7. igénypont szerinti gyógyászati szempontból alkalmazható só, ahol az addíciós só szulfát, nitrát, foszfát, perklorát, borát, halogenid, acetát, tartarát, maleát, citrát, szukcinát, palmoát, metánszulfonát, benzoát, szalicilát, hidroxinaftoát, benzolszulfonát, aszkorbát, glicerofoszfát, ketoglutarát.

47. Eljárás az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése halogénatom, R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyeken belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-6 szénatomos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Z jelentése kén-, oxigénatom, $=CH$ képletű vagy NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6

szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport; Y^1 jelentése =O vagy =S képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hid-roxil-, aminocsoport, =O, =S képletű csoport, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; Y^2 és Y^3 , ha szomszédos szénatomon helyezkednek el, együtt alkothatnak helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmazva - vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói vagy gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, mely abból áll, hogy az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése hidroxilcsoport és az összes többi jelölés jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet tetrahalogén-metánnal reagáltatjuk trifenil-foszfín (PPh_3) vagy trialkil-foszfín ($P(alkil)_3$) jelenlétében.

48. Eljárás az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése SH képletű csoport; R^2 és R^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, halogénezett, 1-6 szénatomos alkil-, ciano-, nitro-, SR^a , NR^a , OR^a általános képletű csoport, melyeken belül R^a jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-6 szénato-

mos alkil- vagy halogénezett, 1-6 szénatomos alkilcsoport; Z jelentése kén-, oxigén-atom, =CH képletű vagy NR^b általános képletű csoport, melyen belül R^b jelentése hidrogénatom, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aralkil-, aril-oxi-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-, aril-karbonil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil- vagy aril-oxi-karbonil-csoport; Y^1 jelentése =O vagy =S képletű csoport; Y^2 és Y^3 jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, ciano-, nitro-, formil-, hidroxil-, aminocsoport, =O, =S képletű csoport, helyettesített vagy helyettesítetlen, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-, karboxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, aril-karbonil-amino-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-(1-6 szénatomos)alkil-, 1-6 szénatomos amino-alkil-, 1-6 szénatomos monoalkil-amino-, di(1-6 szénatomos)alkil-amino-, aril-amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, aril-, aril-oxi-, aralkil-, heteroaril-, heteroaralkil-, heterociklusos vagy heterocikloalkil-csoport; Y^2 és Y^3 , ha szomszédos szénatomon helyezkednek el, együtt alkothatnak helyettesített vagy helyettesítetlen, 5- vagy 6 tagú aromás vagy nem-aromás gyűrűs szerkezetet, adott esetben egy vagy két heteroatomot tartalmazva -

vegyület, származékai, analógjai, tautomer alakjai, sztereoizomerjei, polimorfjai, gyógyászati szempontból alkalmazható sói vagy gyógyászati szempontból alkalmazható szolvátjai előállítására, mely abból áll, hogy

(i) az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése halogénatom - vegyületet bázissal és tioecetsavval reagáltatjuk, a (XX) általános képletű - ahol valamennyi jelölés jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve;

(ii) a (XX) általános képletű vegyületet bázissal reagáltatjuk, az (I) általános képletű - ahol R^1 jelentése SH képletű csoport és az összes többi jelölés jelentése a fentiekben meghatározott - vegyületet nyerve.

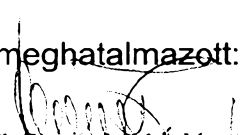
49. Az (I) általános képletű vegyület felhasználása bakteriális fertőzés kezelésére, ami abból áll, hogy az arra rászoruló betegnek az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyület terápiásan hatásos mennyiségét adjuk be.

50. Egy vegyület felhasználása bakteriális fertőzés kezelésére, ami abból áll, hogy az arra rászoruló betegnek a 31. és 32. igénypont szerinti gyógyszerkészítményt adjuk be.

51. Az (I) általános képletű vegyület felhasználása bakteriális fertőzés kezelésére, ami abból áll, hogy az arra rászoruló betegnek a 6. igénypont szerinti, (I) általános képletű vegyület terápiásan hatásos mennyiségét adjuk be.

52. Egy vegyület felhasználása bakteriális fertőzés kezelésére, ami abból áll, hogy az arra rászoruló betegnek a 35. és 36. igénypont szerinti gyógyszerkészítményt adjuk be.

A meghatalmazott:


ifj. Szentpéteri Ádám

szabadalmi ügyvivő
az S.B.G. & K. Szabadalmi Ügyvivői Iroda
tagja

H-1062 Budapest, Andrássy út 113.
Telefon: 461-1000 Fax: 461-1099

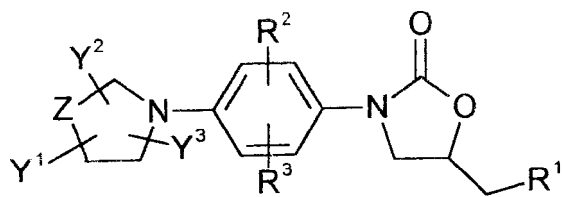
37 oldal rajzzal

2003. 09. 08.

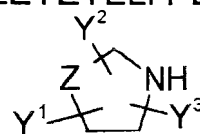
JK

A2

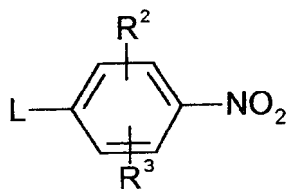
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



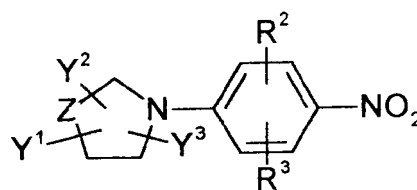
(I)



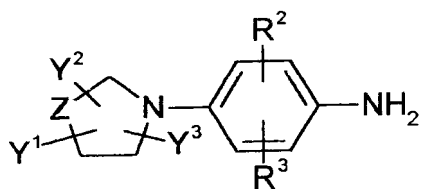
(III)



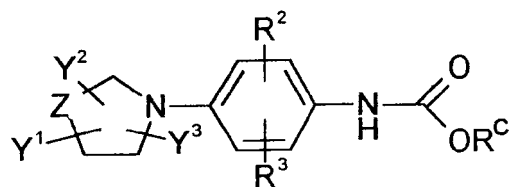
(IV)



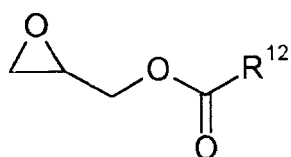
(V)



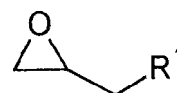
(VI)



(VII)

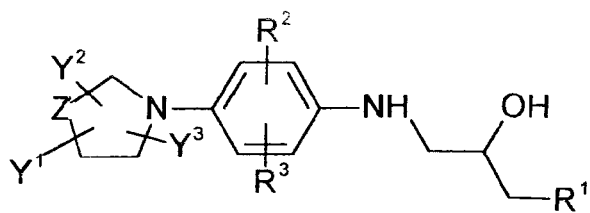


(VIII)

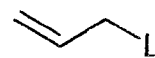


(IX)

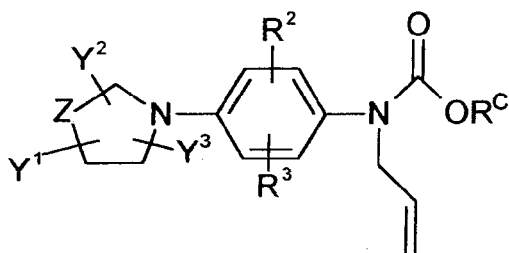
A2



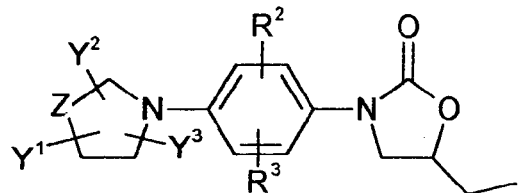
(X)



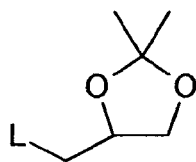
(XI)



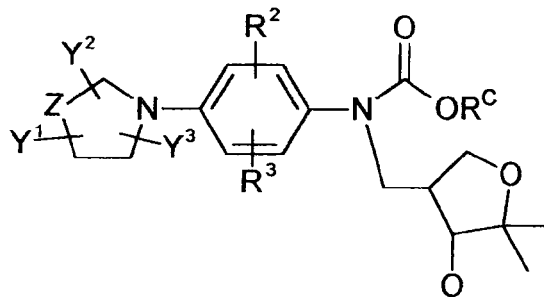
(XII)



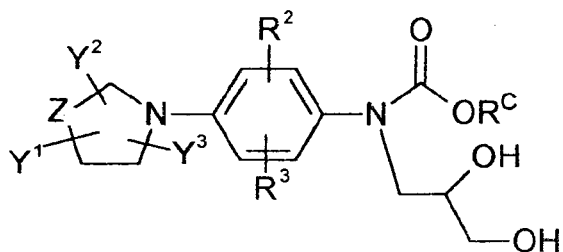
(XIII)



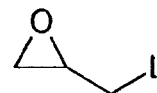
(XIV)



(XV)



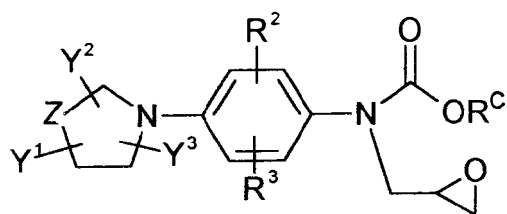
(XVI)



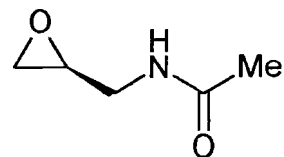
(XVII)

P0302580

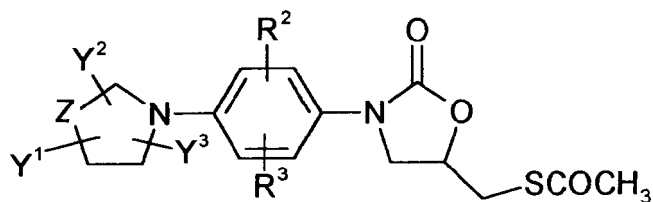
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



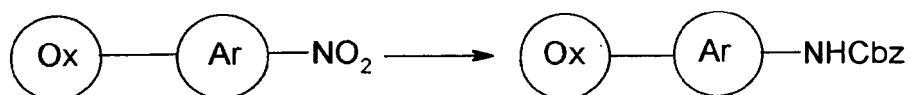
(XVIII)



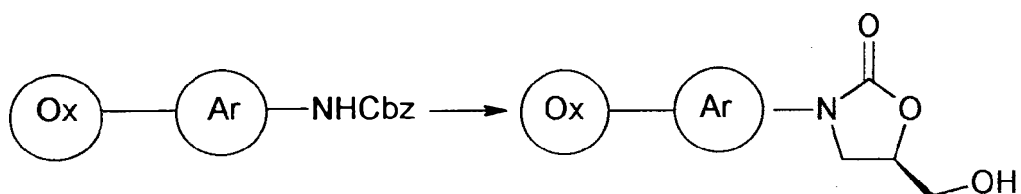
(XIX)



(XX)

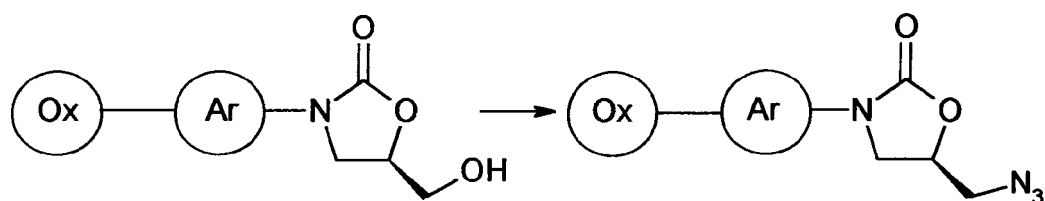


1. ábra

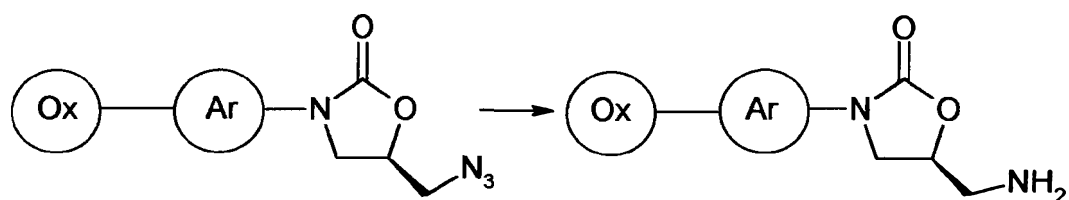


2. ábra

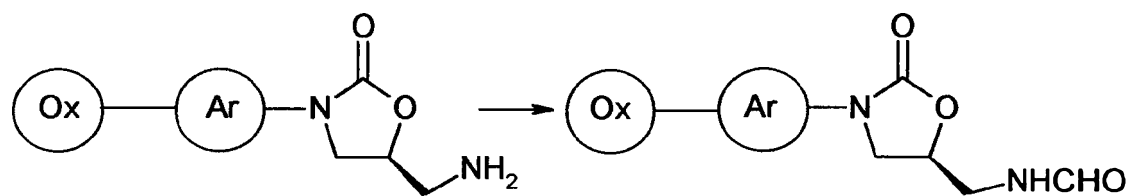
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



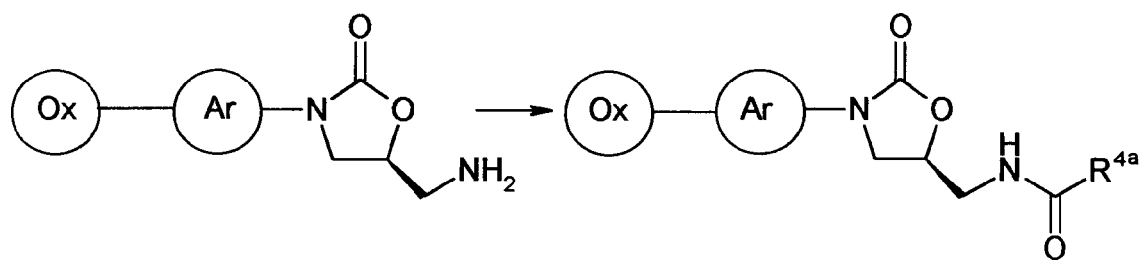
3. ábra



4. ábra

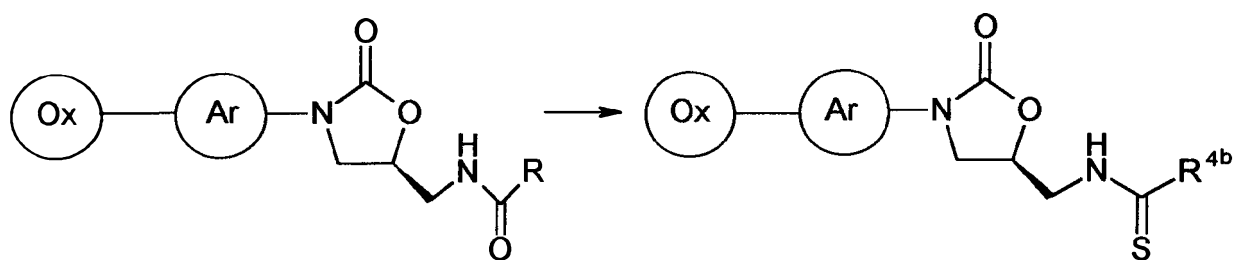


5. ábra

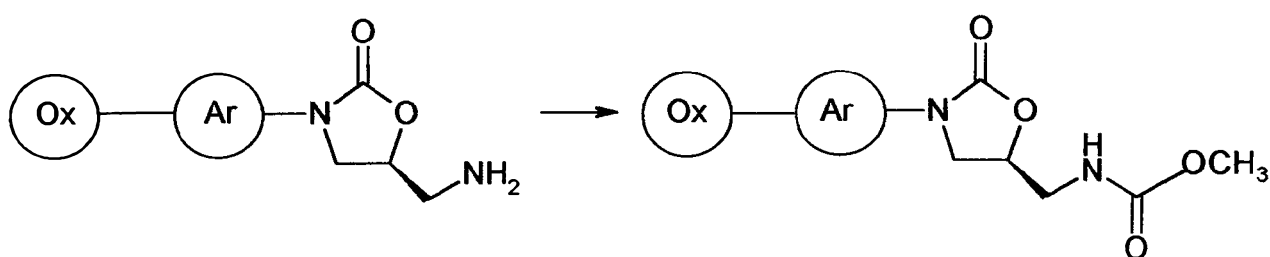


6. ábra

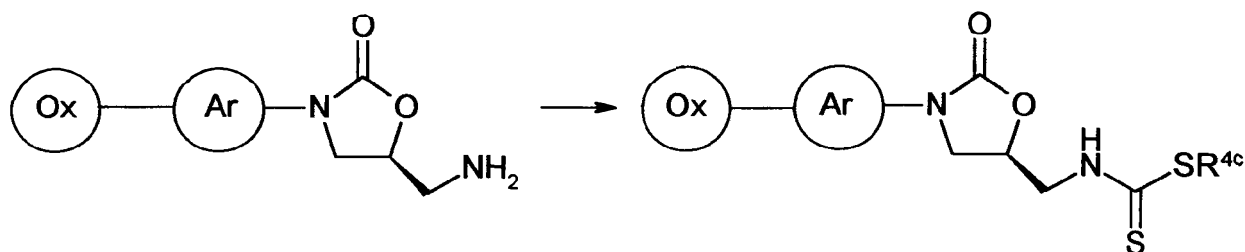
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



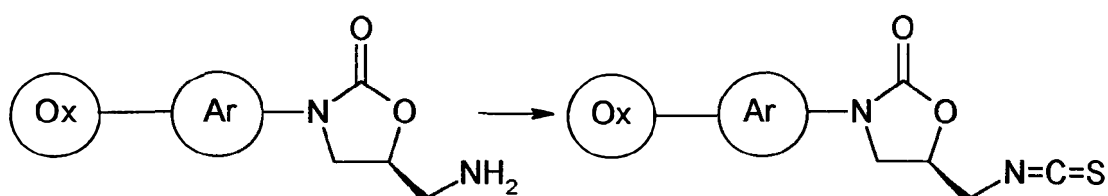
7. ábra



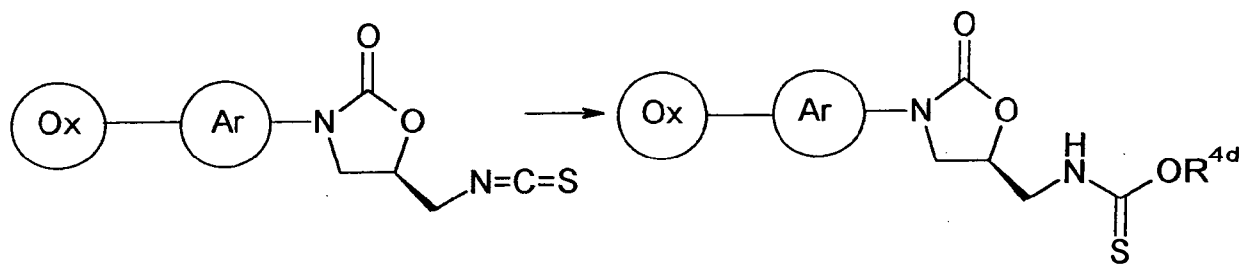
8. ábra



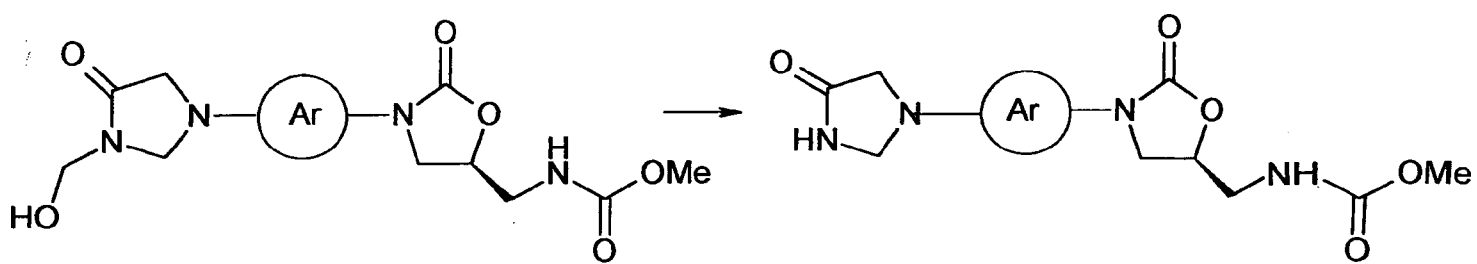
9. ábra



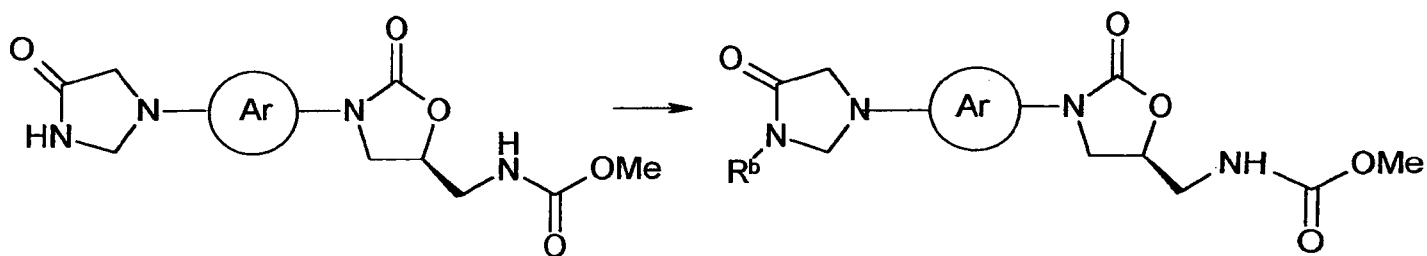
10. ábra



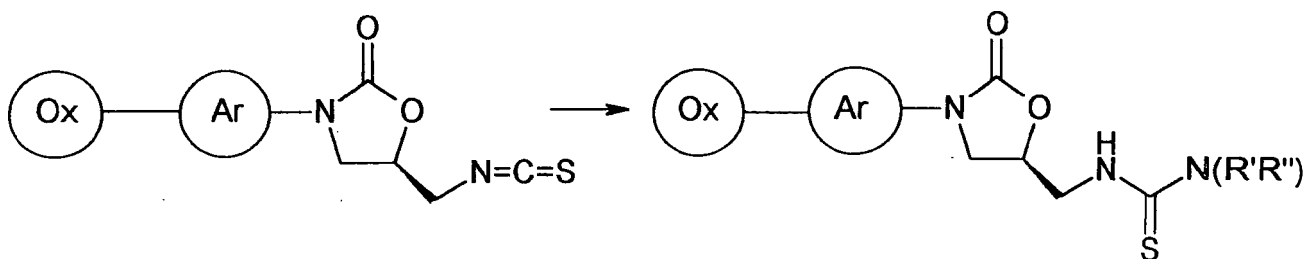
11. ábra



12. ábra

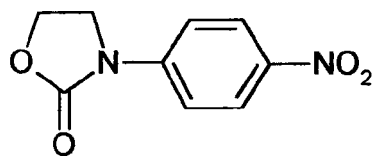


13. ábra

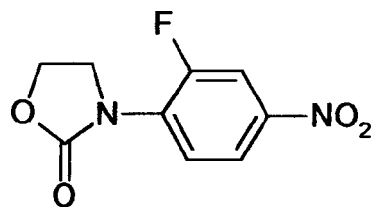


14. ábra

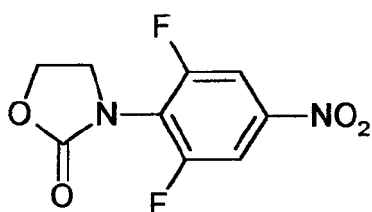
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



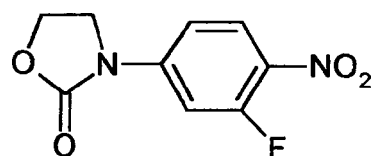
(1)



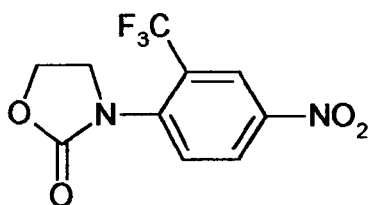
(2)



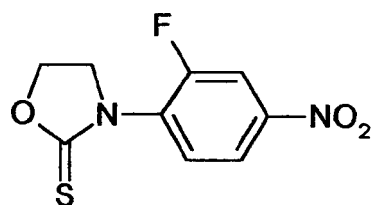
(3)



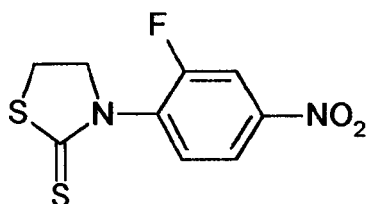
(4)



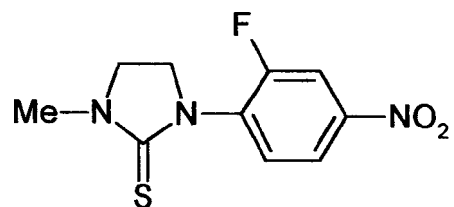
(5)



(6)

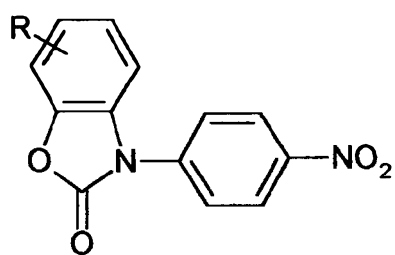


(7)



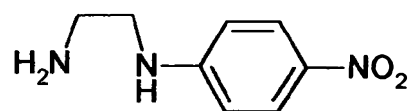
(8)

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

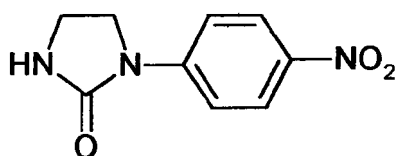


R=4-Me

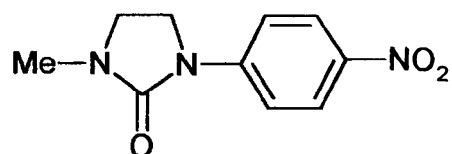
(9)



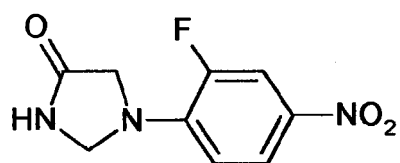
(10)



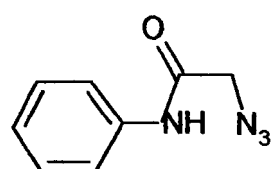
(11)



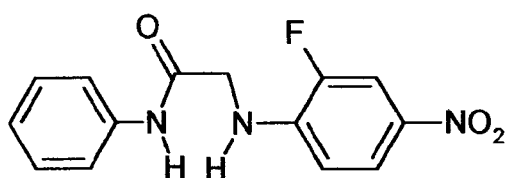
(12)



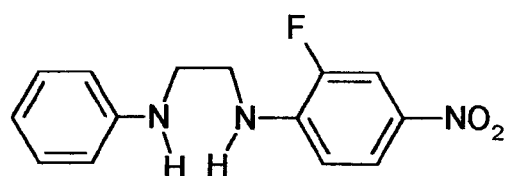
(13)



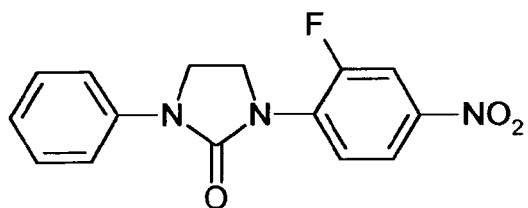
(14)



(15)

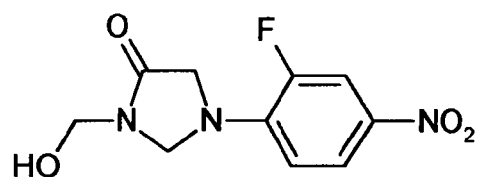


(16)

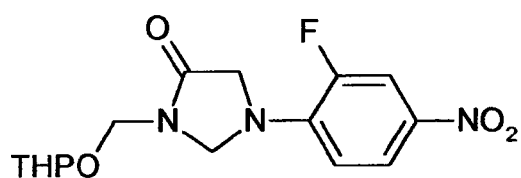


(17)

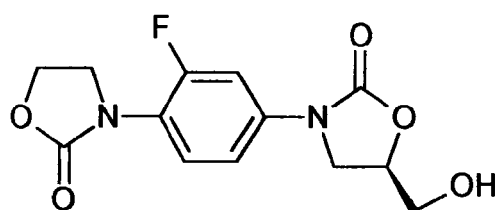
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



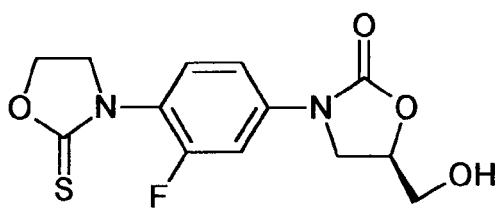
(18)



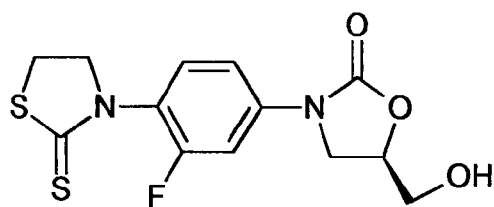
(19)



(21)



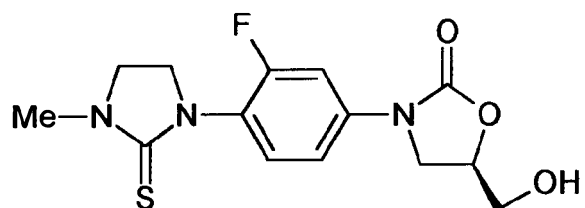
(22)



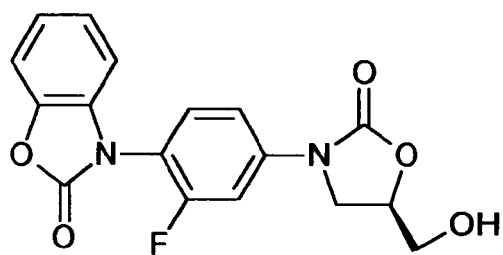
(23)

P03 02 5 80

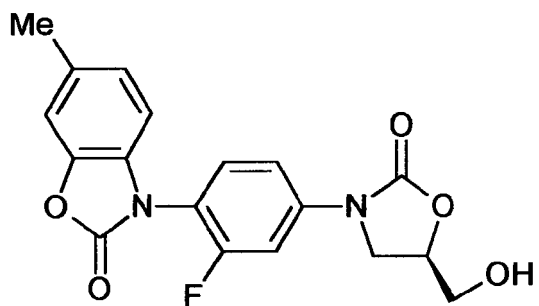
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



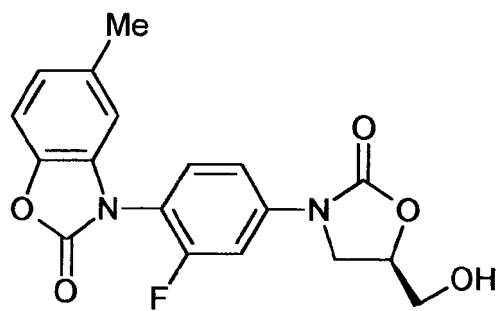
(24)



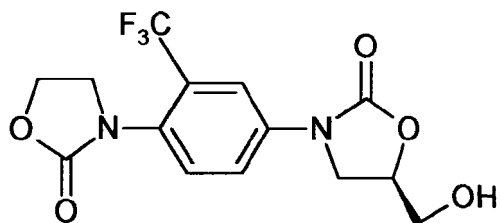
(25)



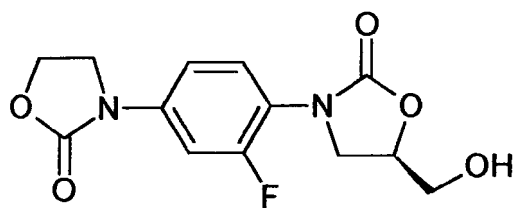
(26)



(27)

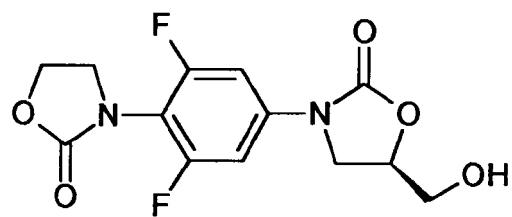


(28)

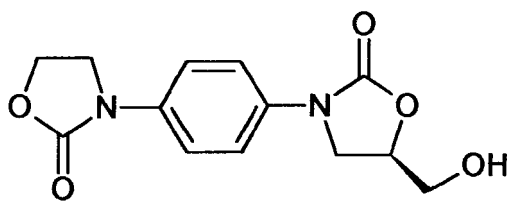


(29)

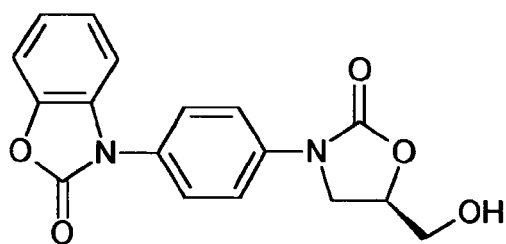
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



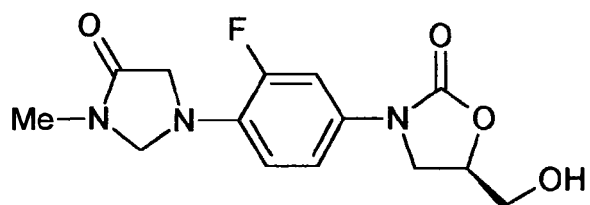
(30)



(31)

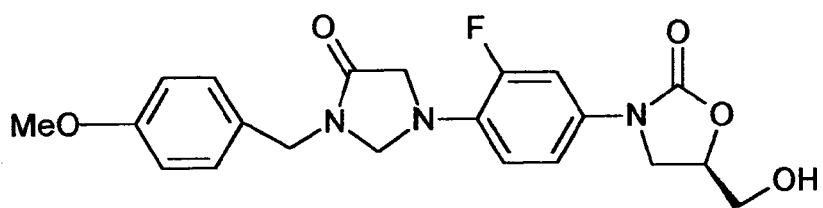


(32)

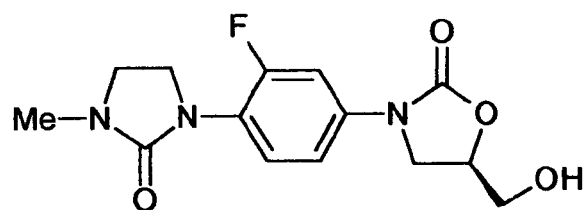


(33)

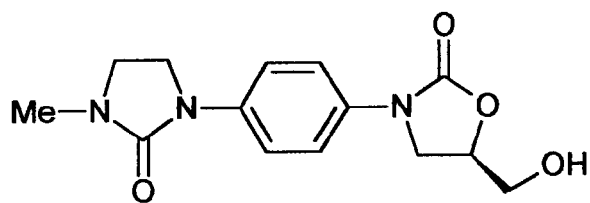
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



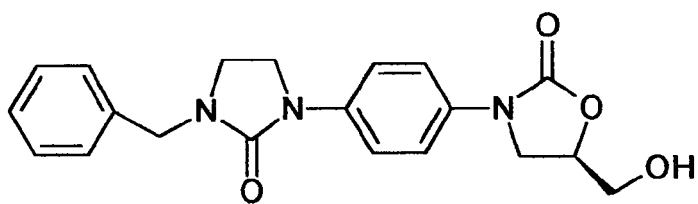
(34)



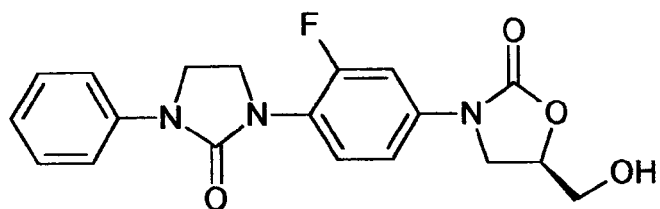
(35)



(36)

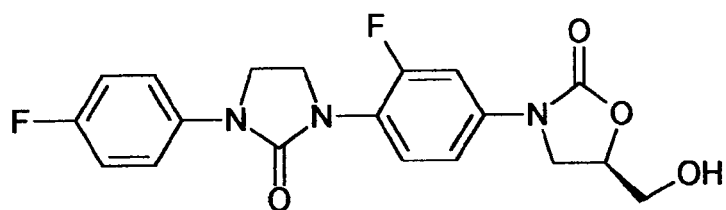


(37)

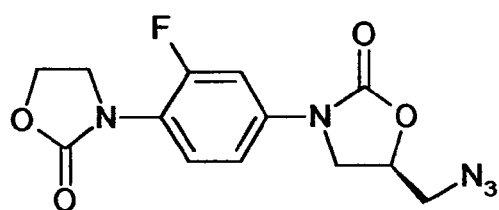


(38)

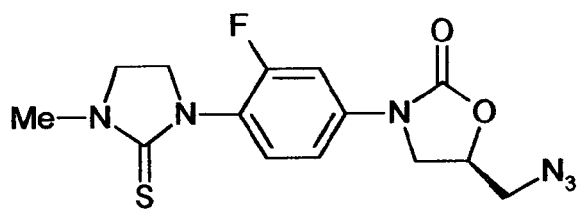
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



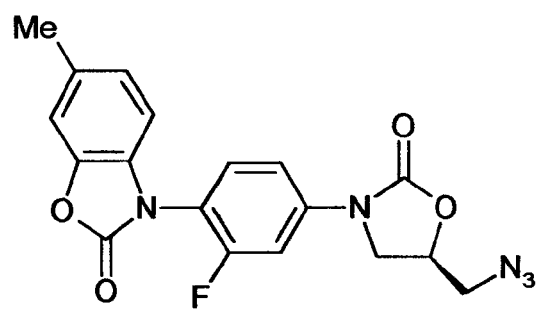
(39)



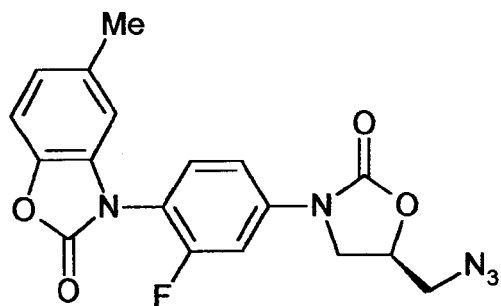
(40)



(41)



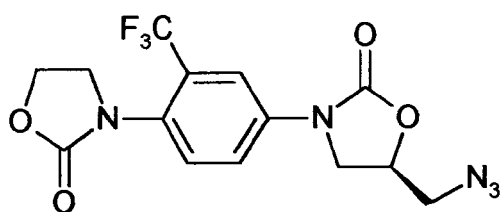
(42)



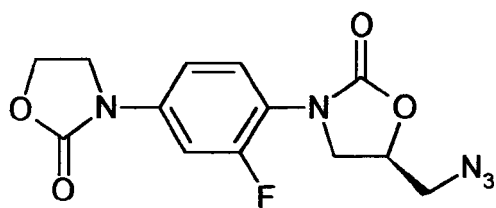
(43)

P0302580

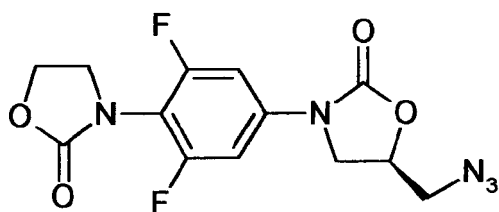
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



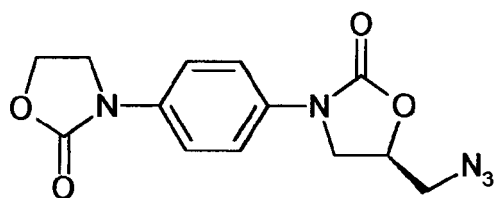
(44)



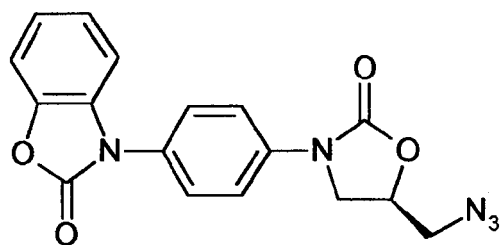
(45)



(46)

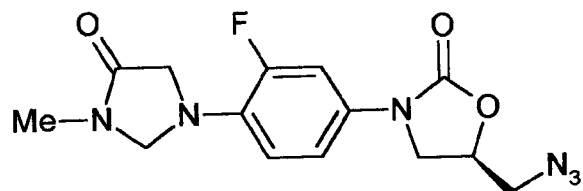


(47)

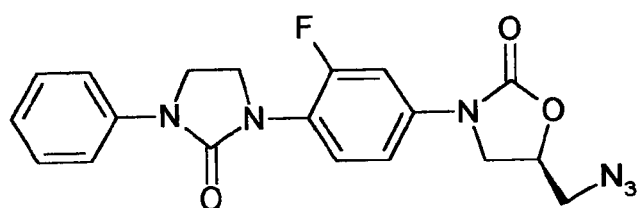


(48)

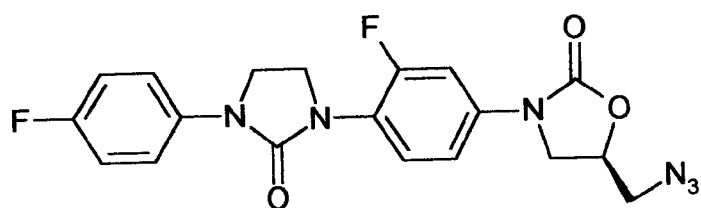
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



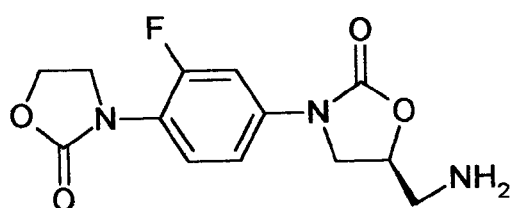
(49)



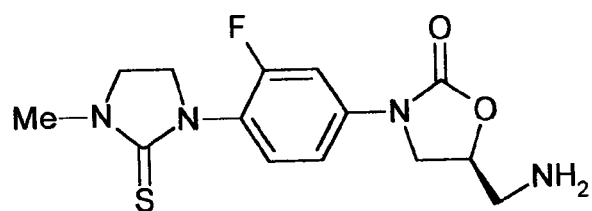
(50)



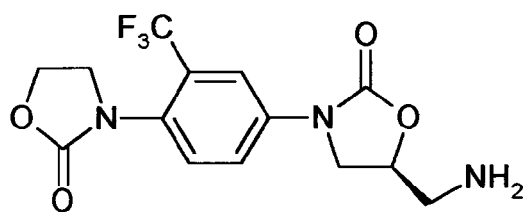
(51)



(52)

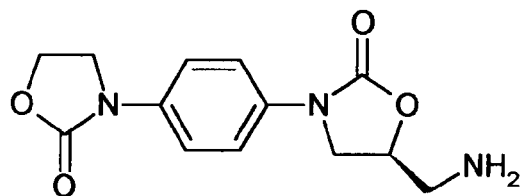


(53)

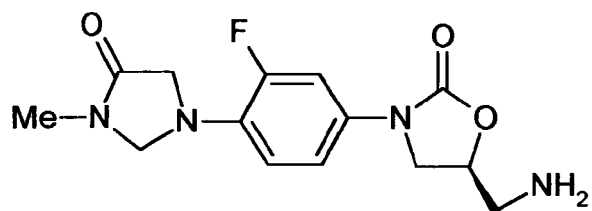


(54)

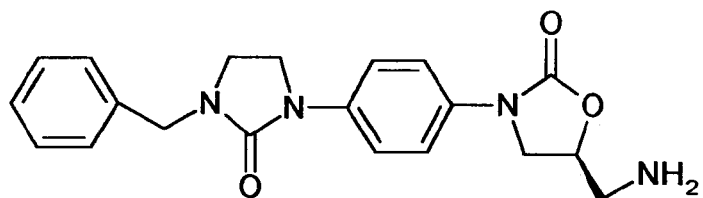
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



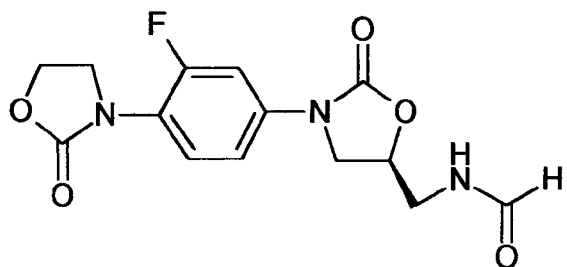
(55)



(56)



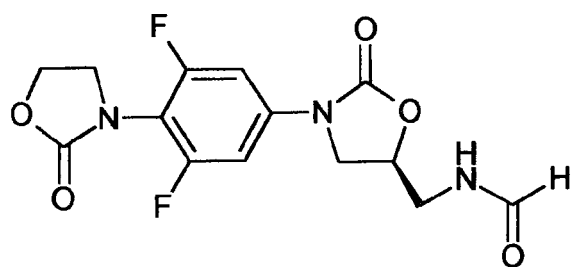
(57)



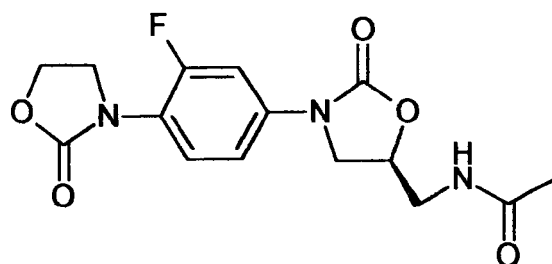
(58)

P0302580

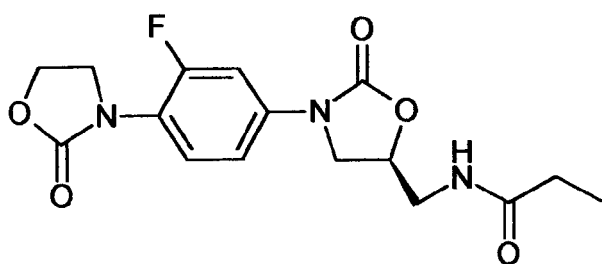
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



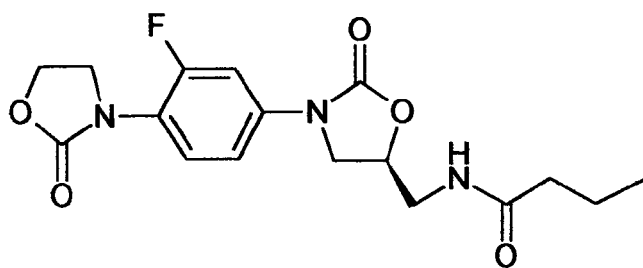
(59)



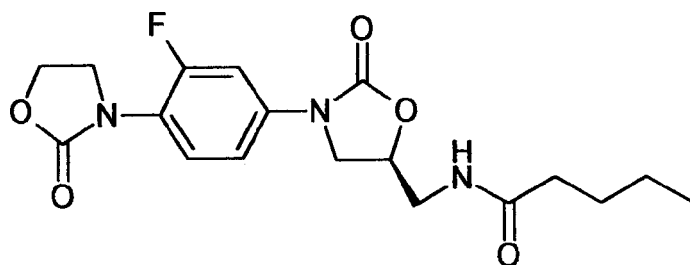
(60)



(61)

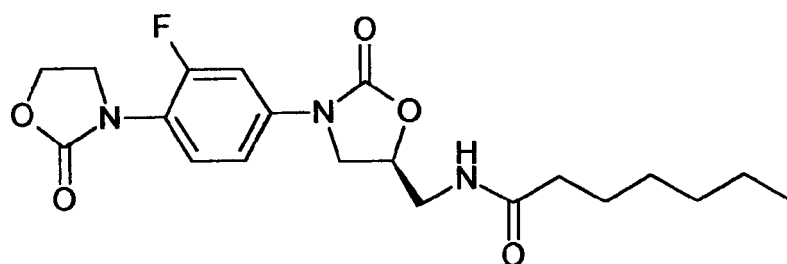


(62)

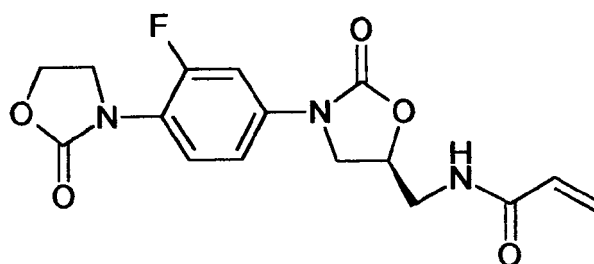


(63)

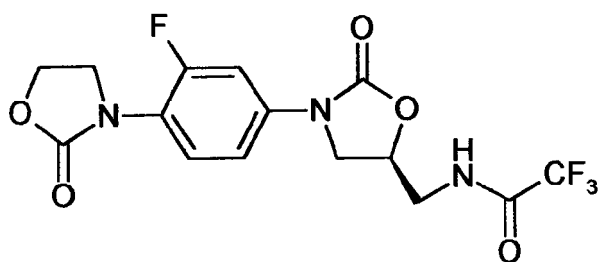
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



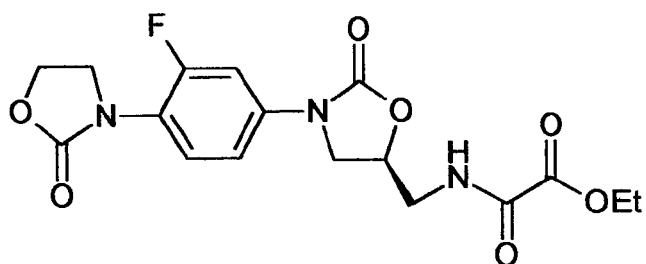
(64)



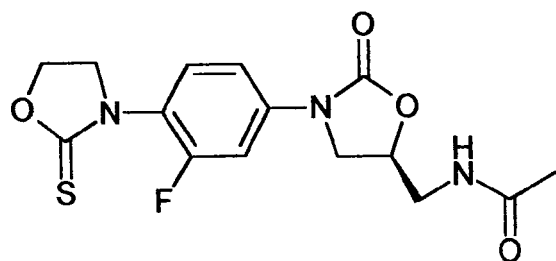
(65)



(66)



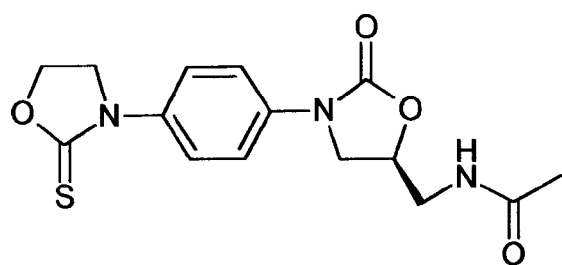
(67)



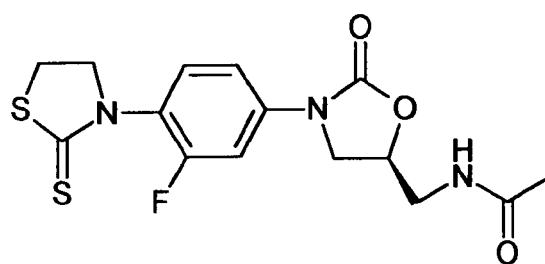
(68)

P0302580

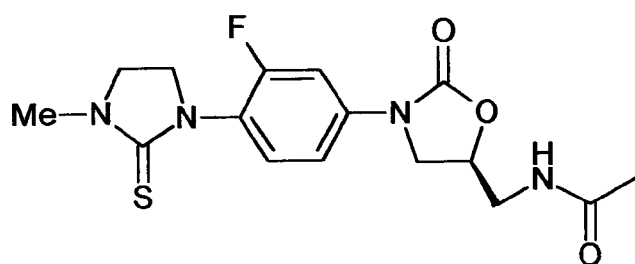
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



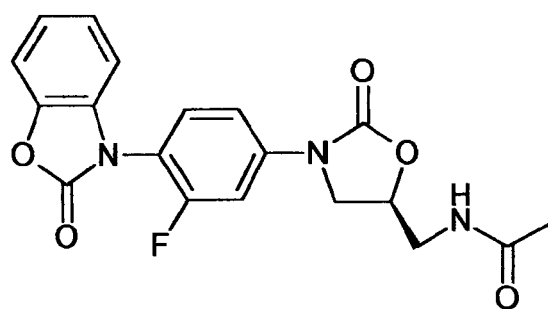
(69)



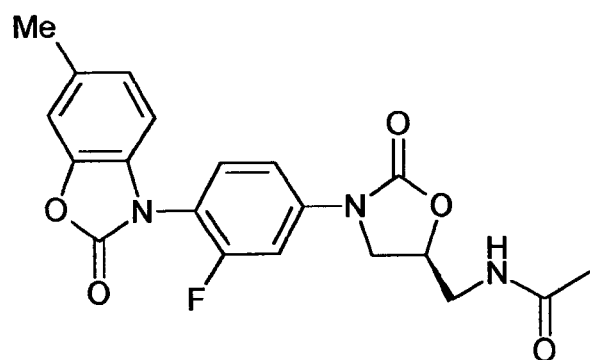
(70)



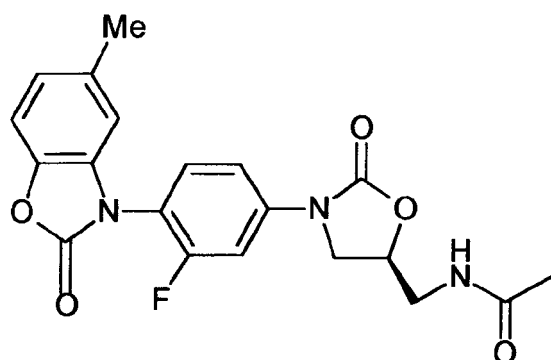
(71)



(72)

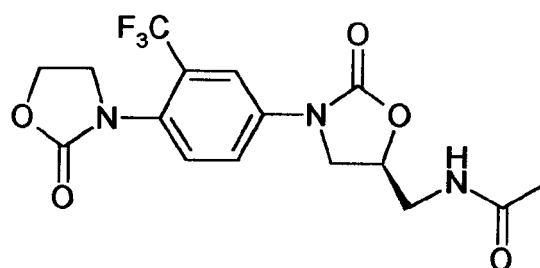


(73)

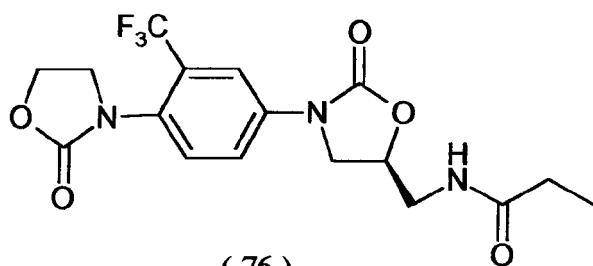


(74)

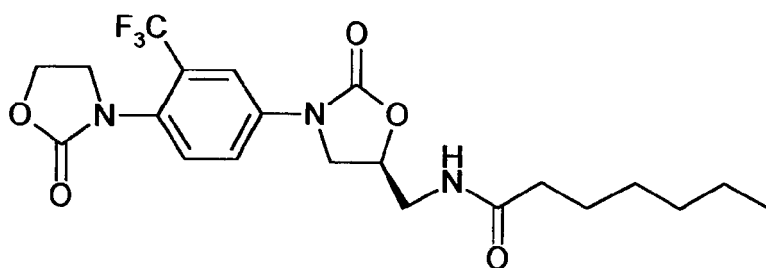
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



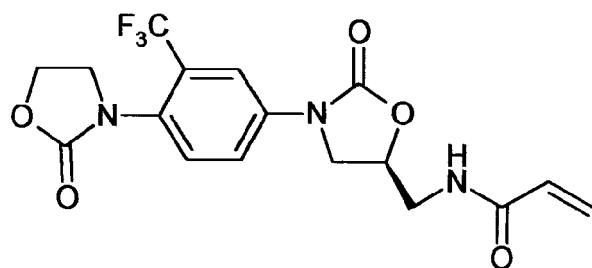
(75)



(76)

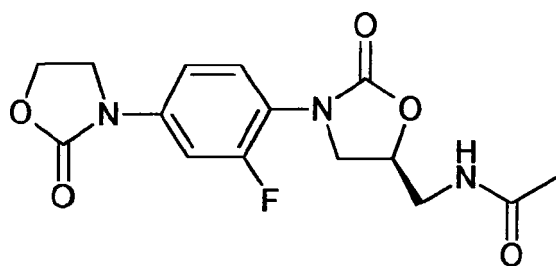


(77)

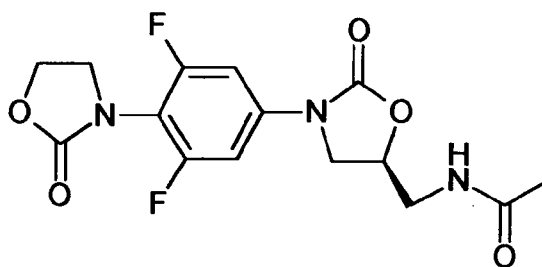


(78)

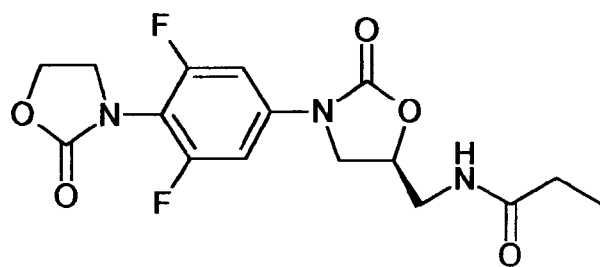
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



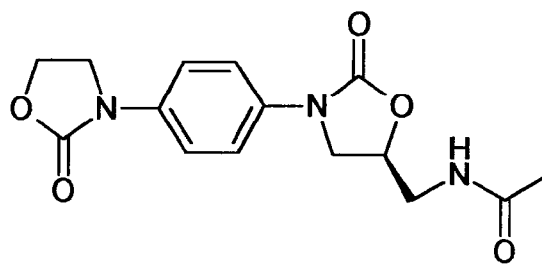
(79)



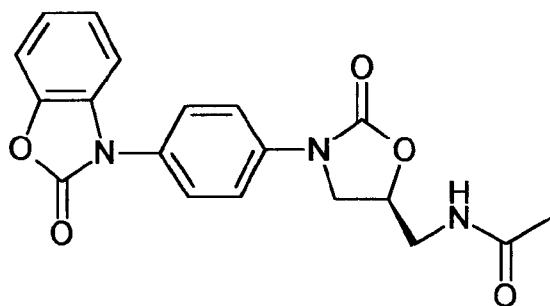
(80)



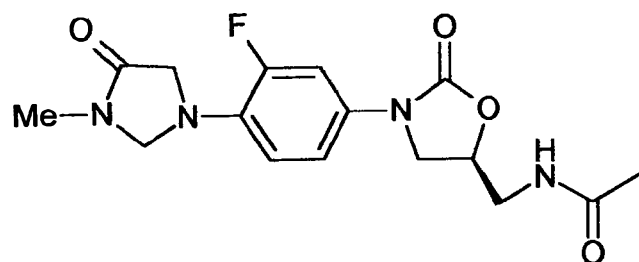
(81)



(82)

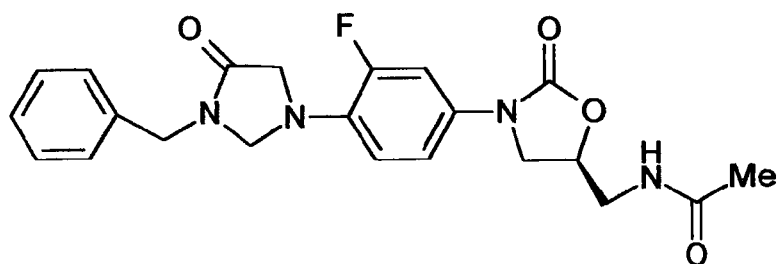


(83)

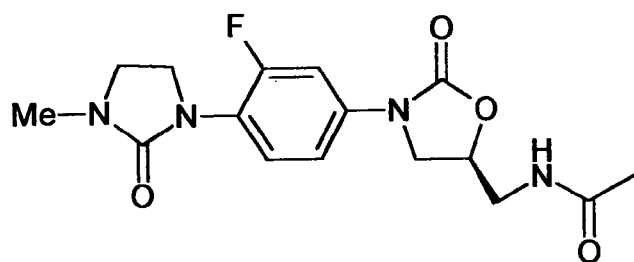


(84)

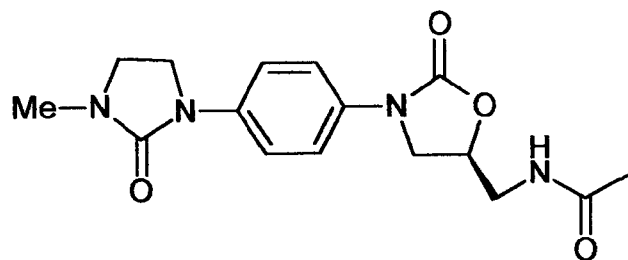
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



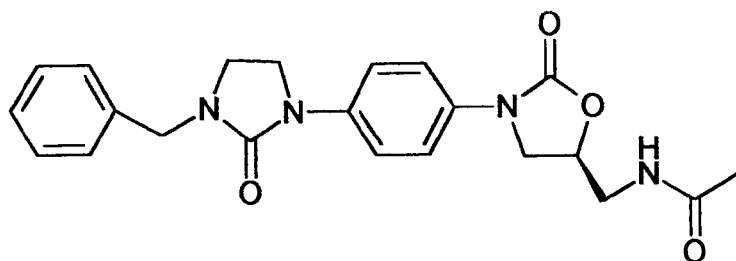
(85)



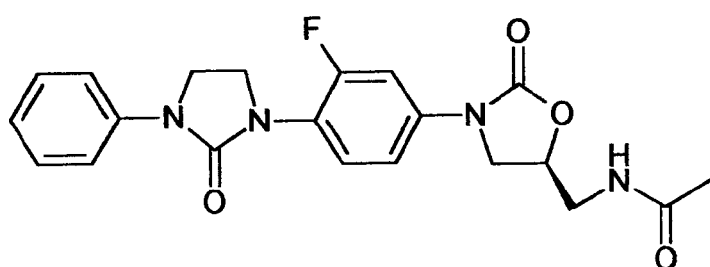
(86)



(87)

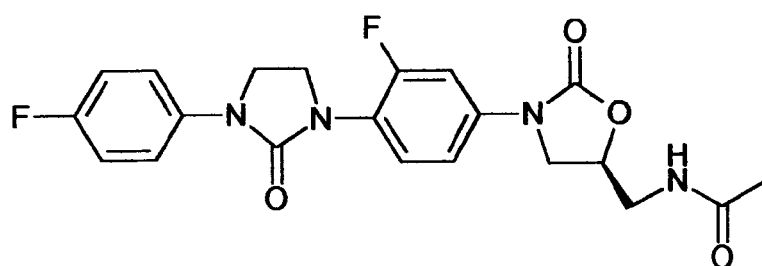


(88)

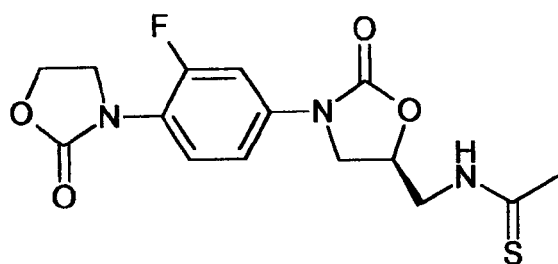


(89)

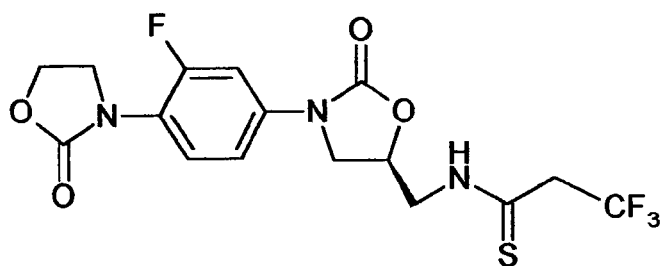
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



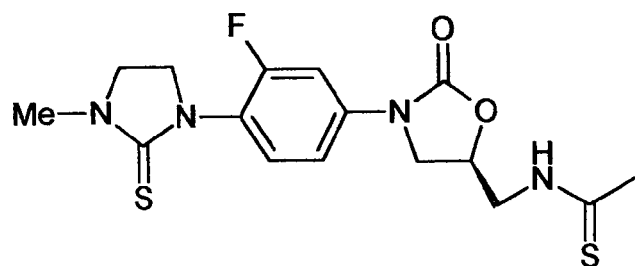
(90)



(91)

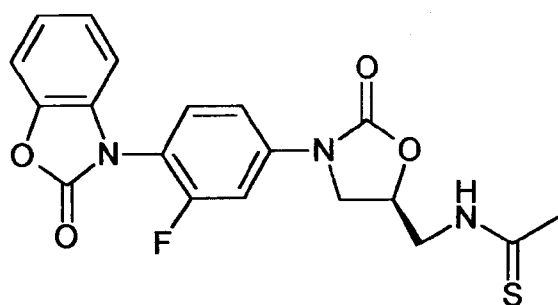


(92)

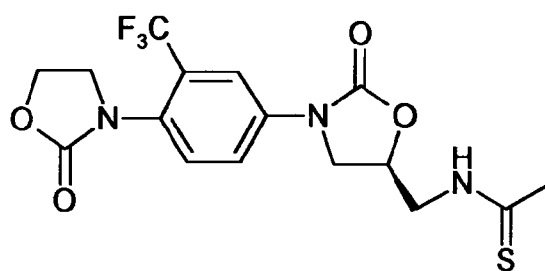


(93)

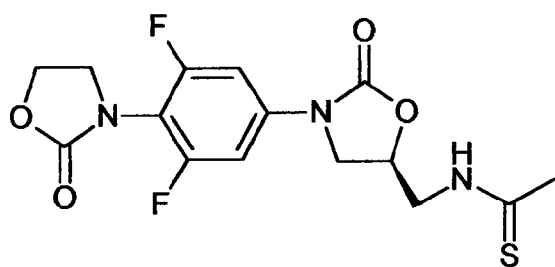
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



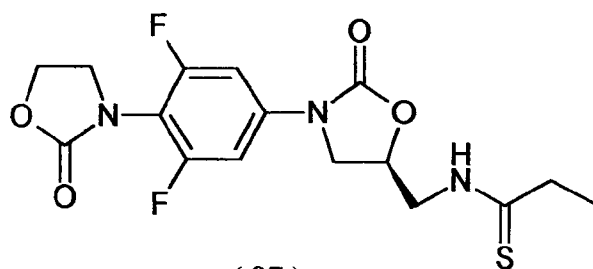
(94)



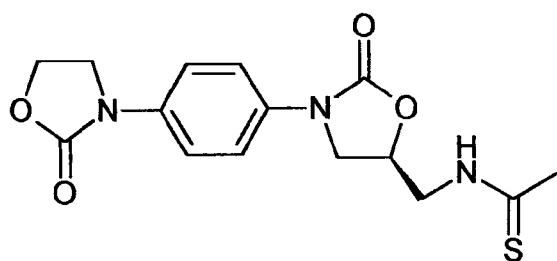
(95)



(96)

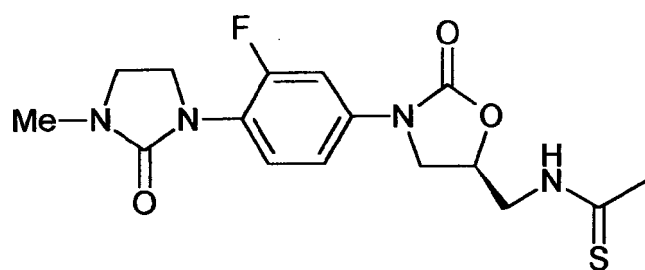


(97)

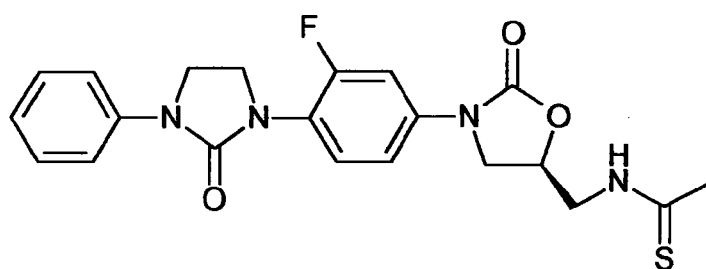


(98)

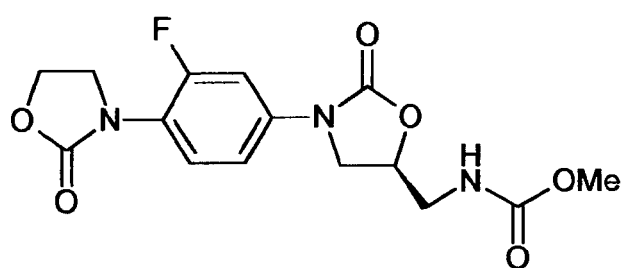
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



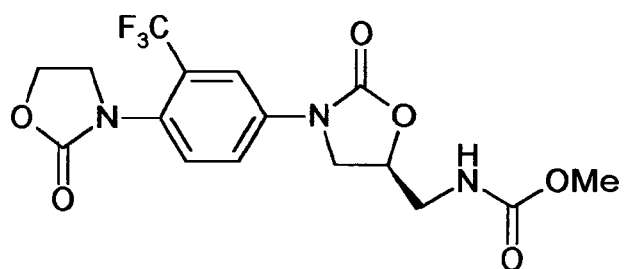
(99)



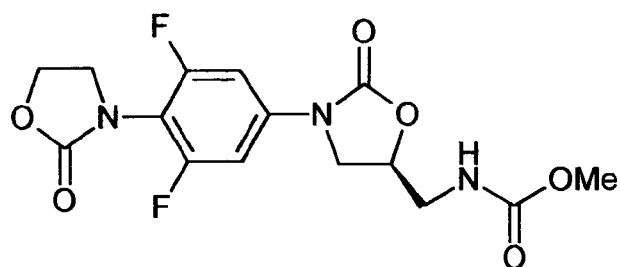
(100)



(101)

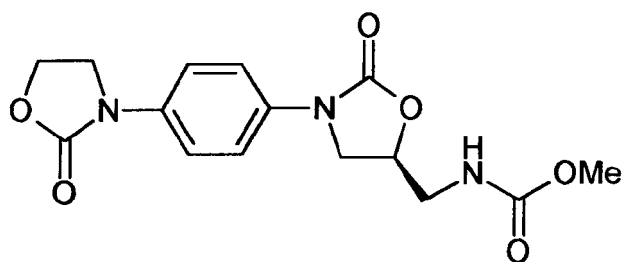


(102)

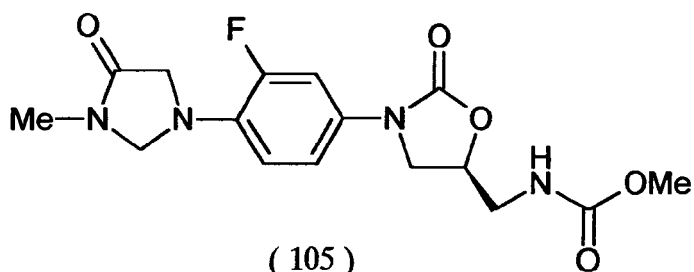


(103)

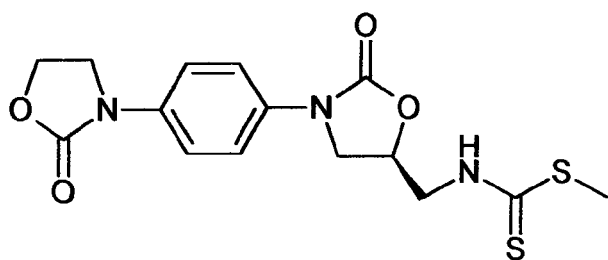
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



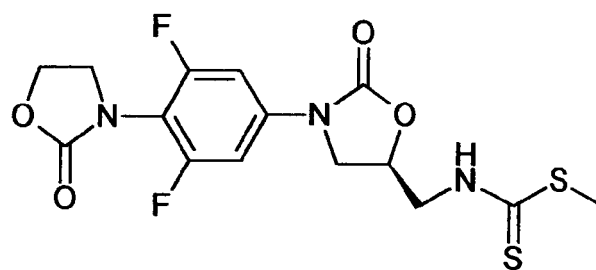
(104)



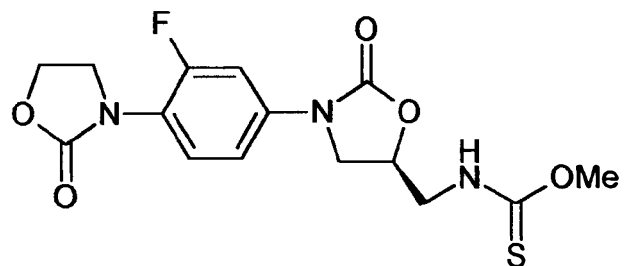
(105)



(106)

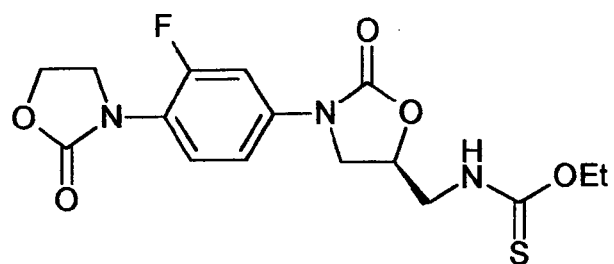


(107)

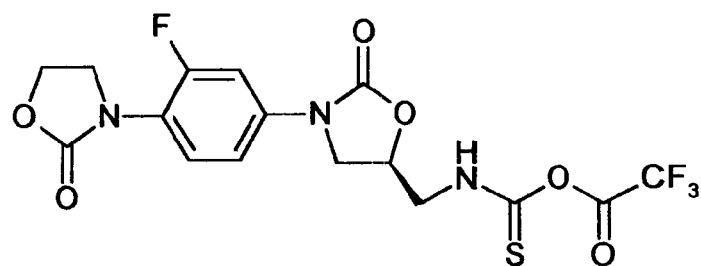


(108)

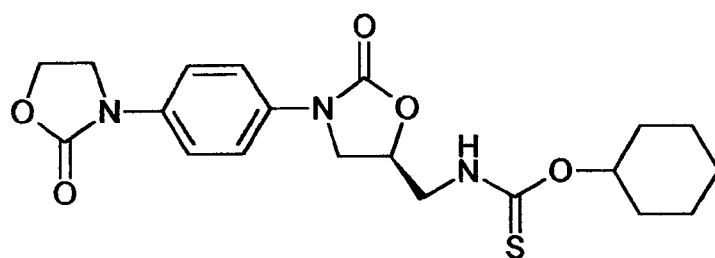
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



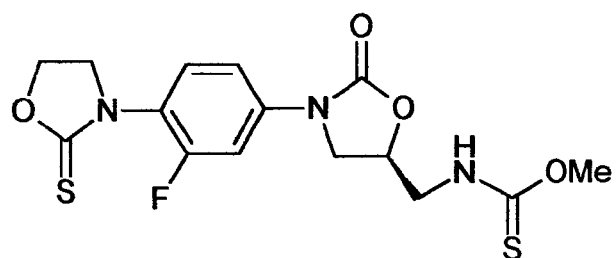
(109)



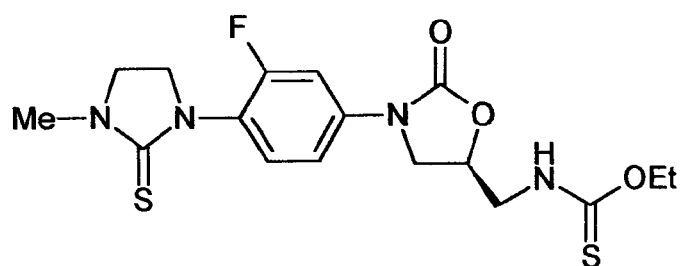
(110)



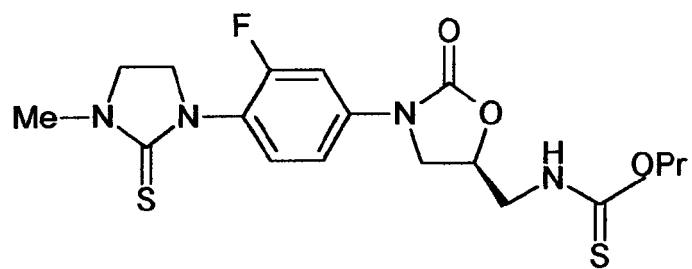
(111)



(112)

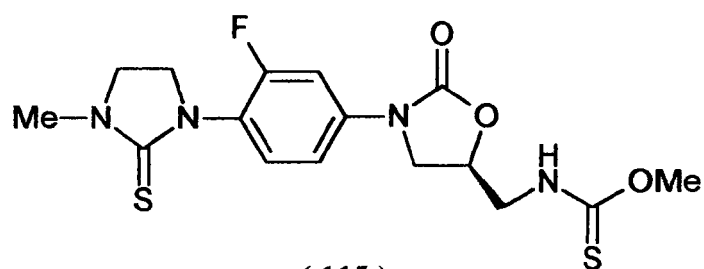


(113)

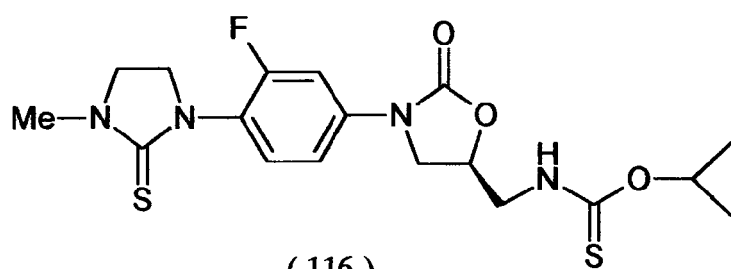


(114)

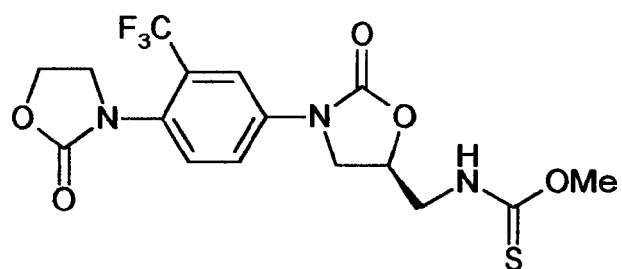
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



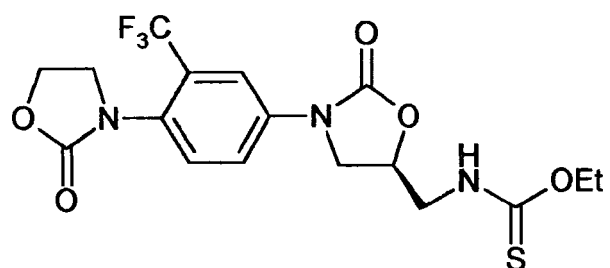
(115)



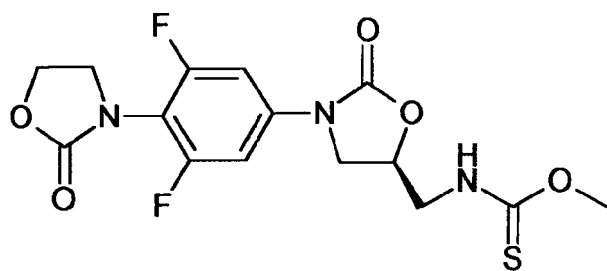
(116)



(117)

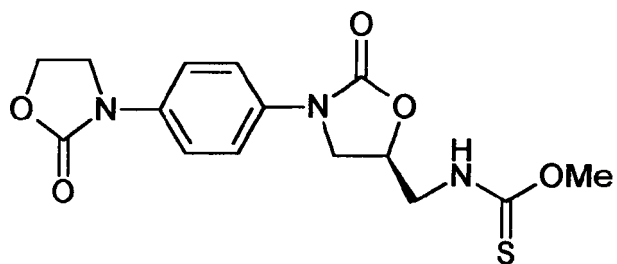


(118)

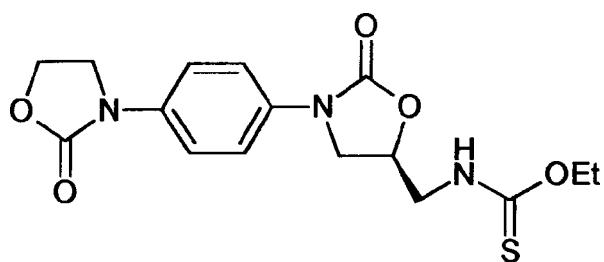


(119)

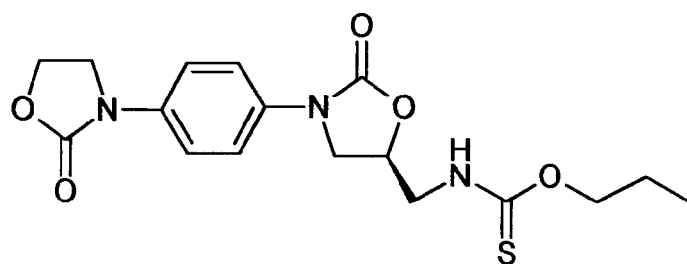
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



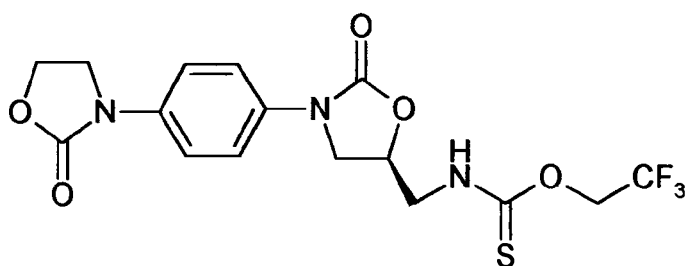
(120)



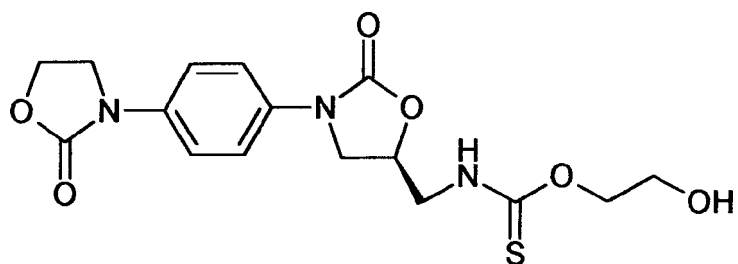
(121)



(122)

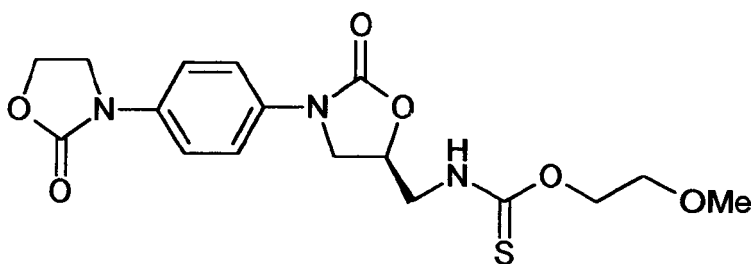


(123)

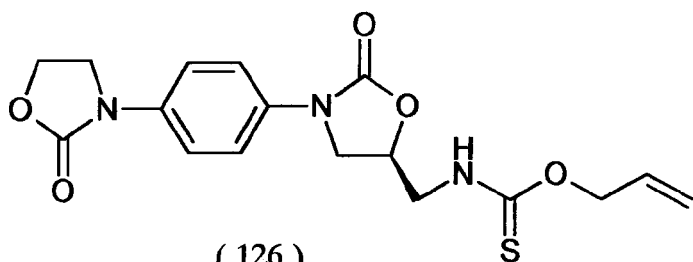


(124)

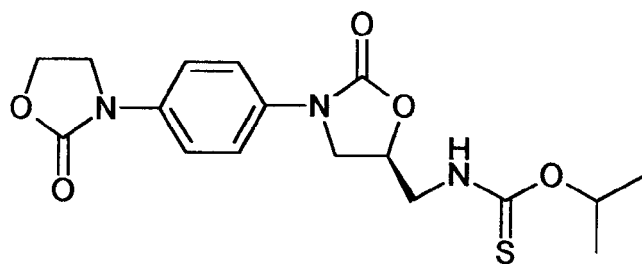
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



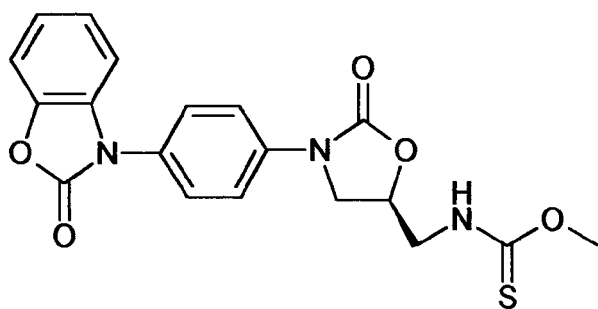
(125)



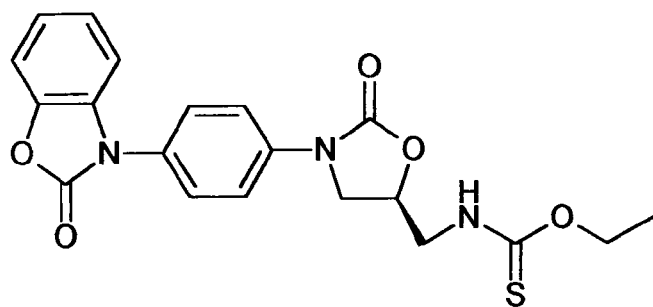
(126)



(127)

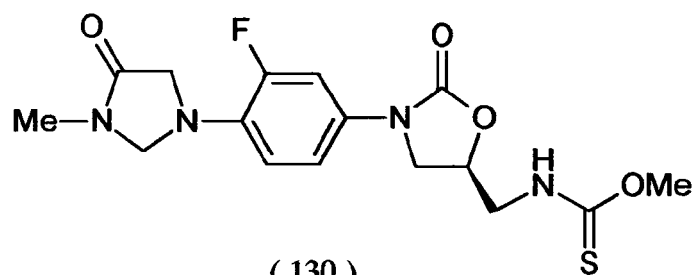


(128)

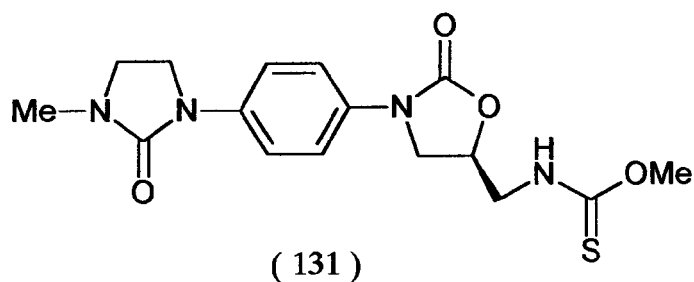


(129)

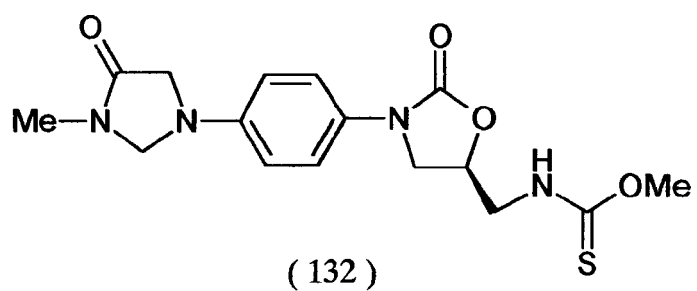
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



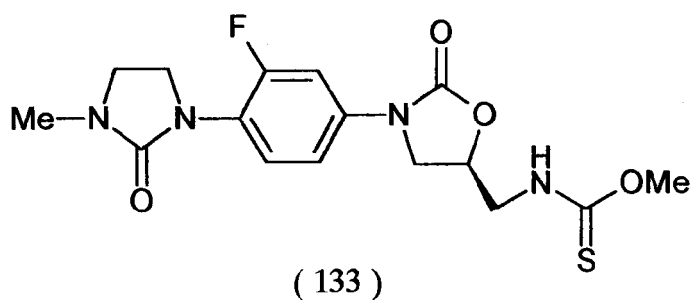
(130)



(131)

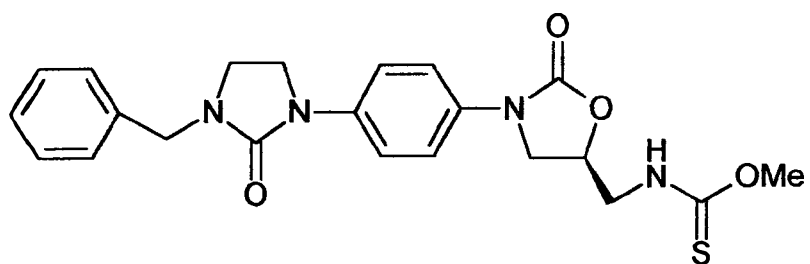


(132)

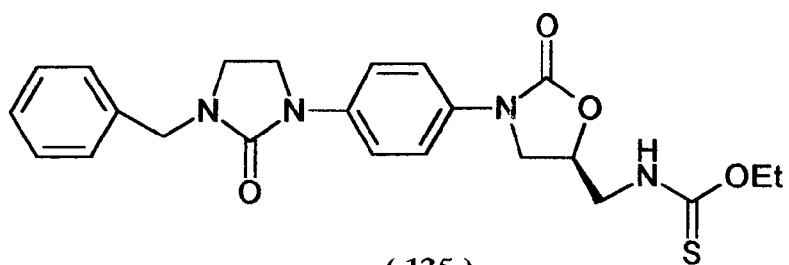


(133)

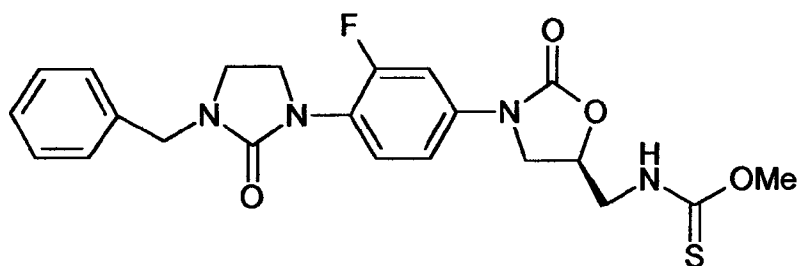
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



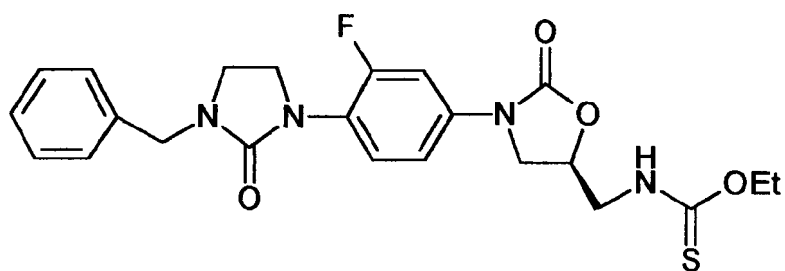
(134)



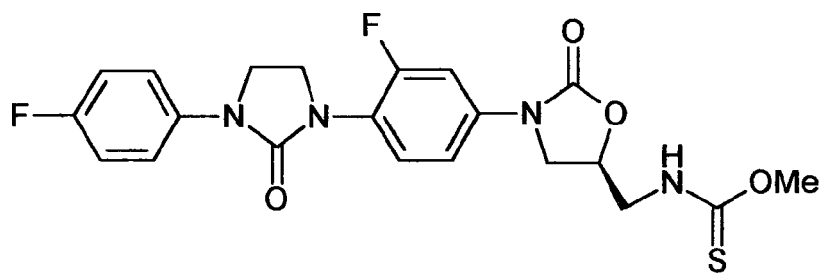
(135)



(136)

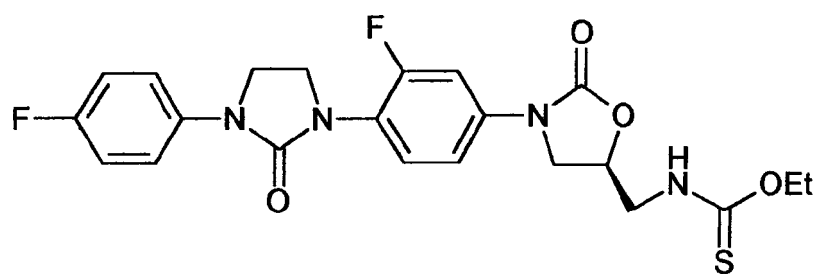


(137)

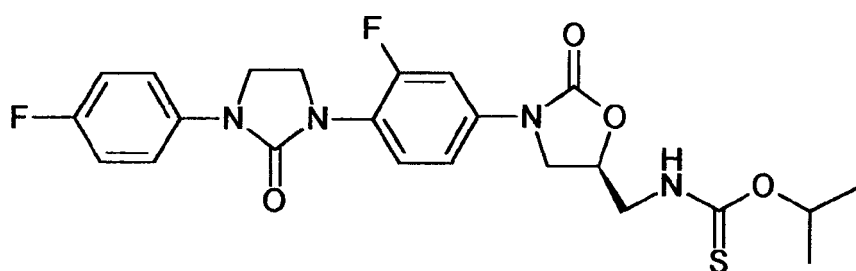


(138)

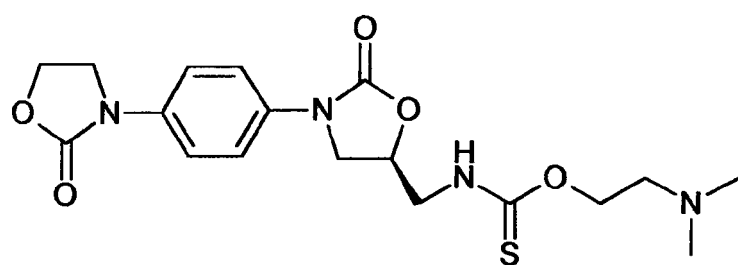
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



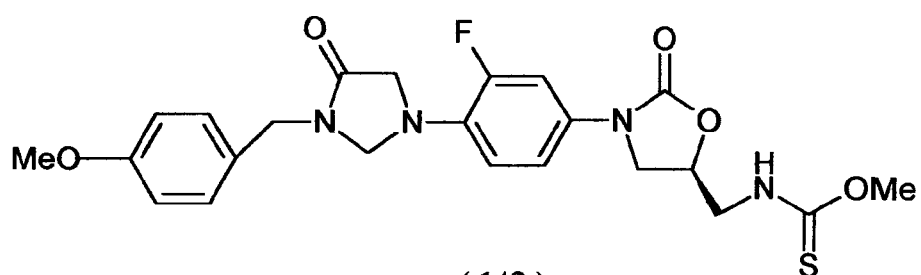
(139)



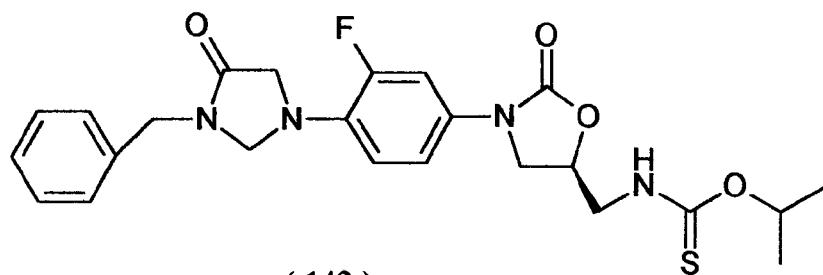
(140)



(141)

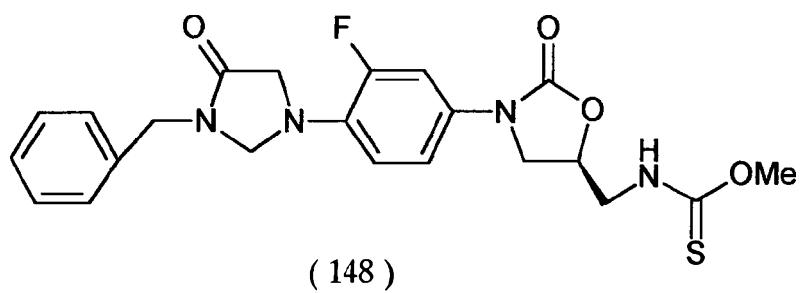
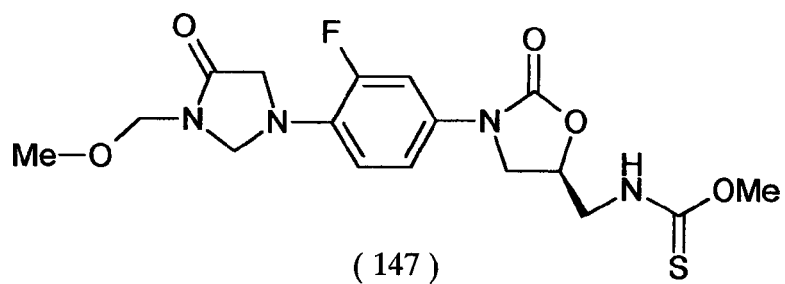
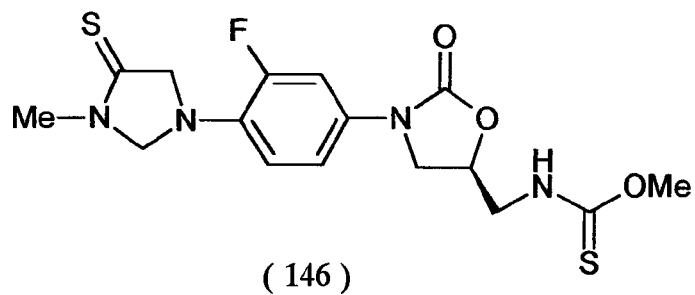
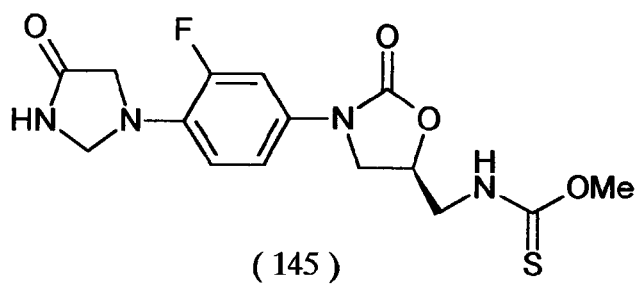
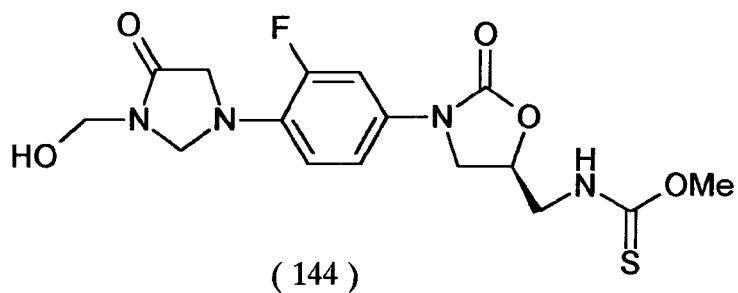


(142)

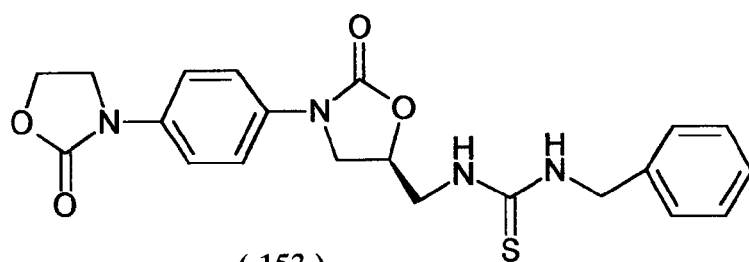
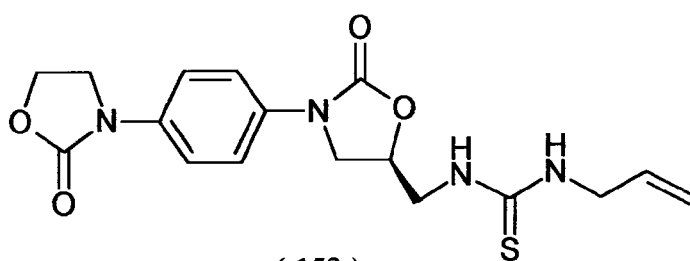
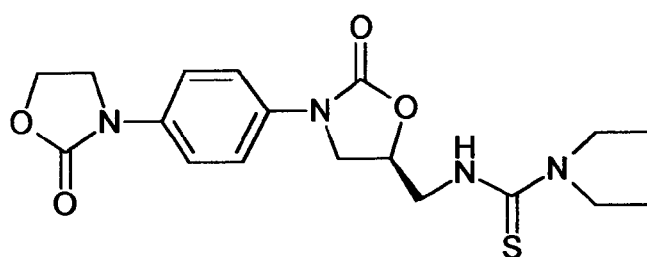
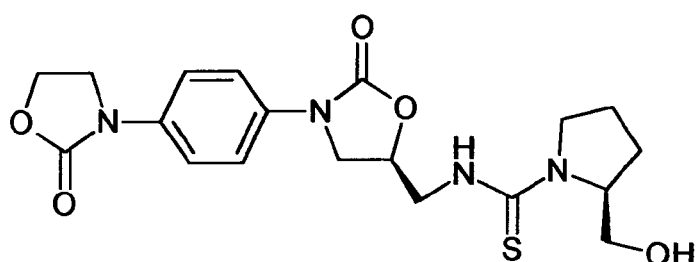
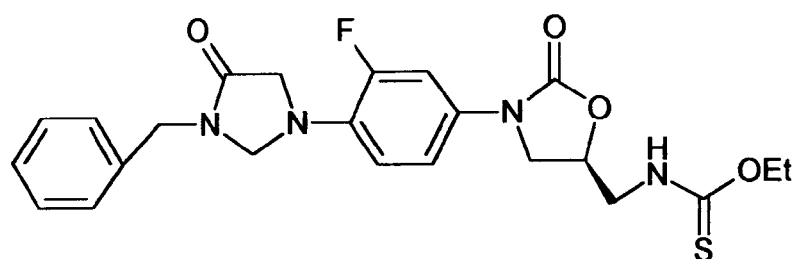


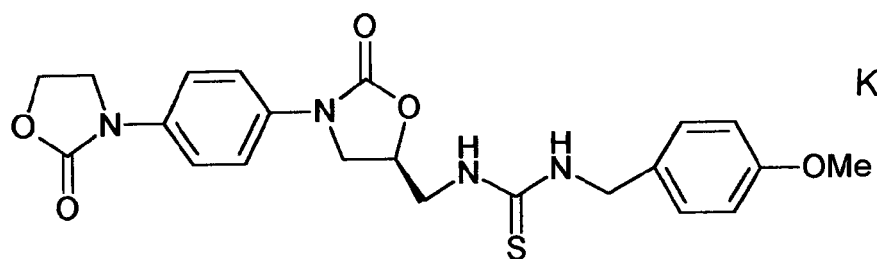
(143)

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



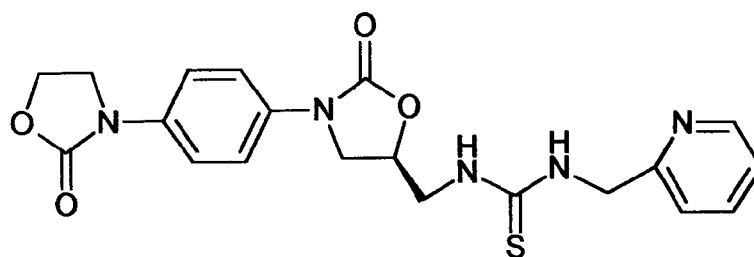
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



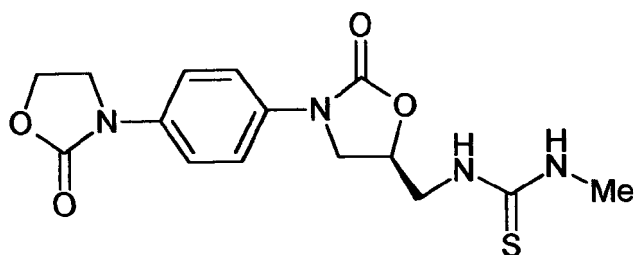


(154)

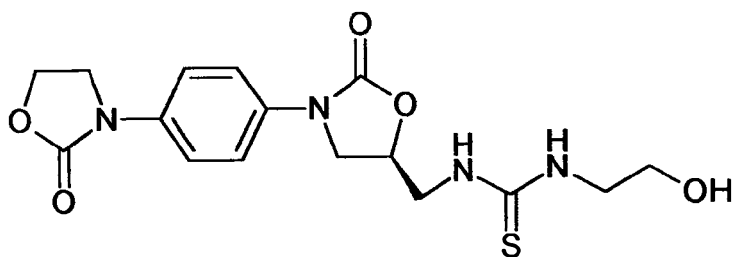
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



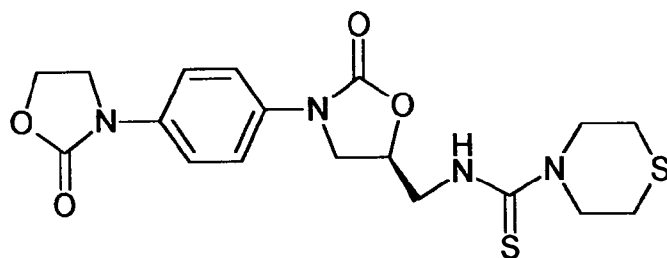
(155)



(156)



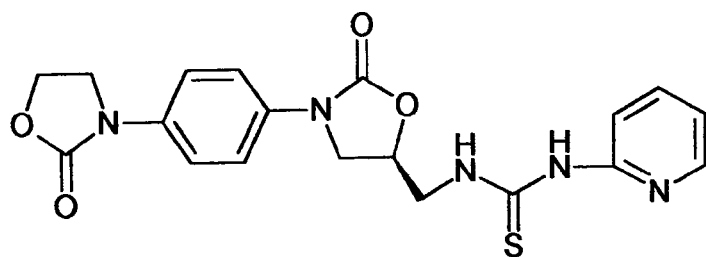
(157)



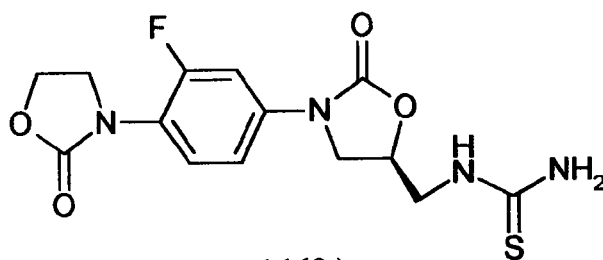
(158)

P 03 02 5 80

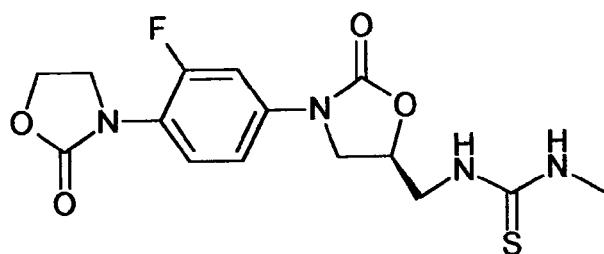
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



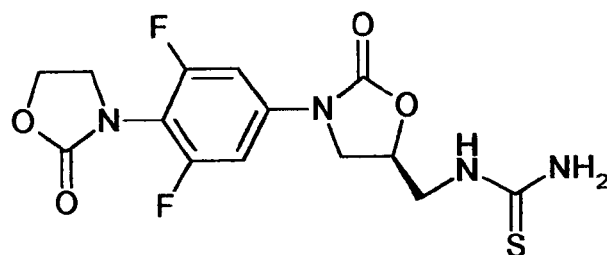
(159)



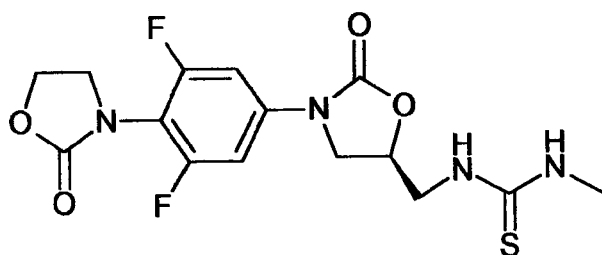
(160)



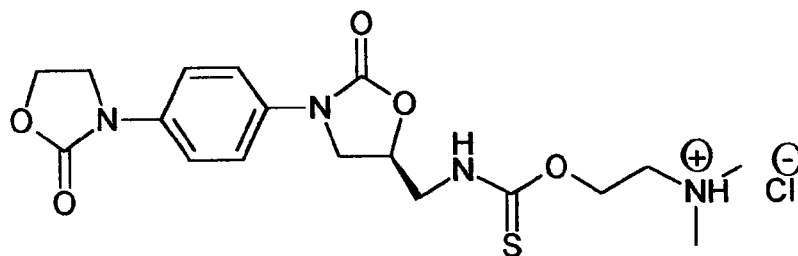
(161)



(162)



(163)



(164)