

1750/51



HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT

6 1660

8209

Eljárás béta-hidroxi-etil-amin-származékokat hatóanyagként
tartalmazó gyógyászati és agrokémiai készítmények előállít-
ására

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

A bejelentés napja: 1991. 05. 24.

Elsőbbség: 1990. 05. 26. (P 40 17 019.5)

Német Szövetségi Köztársaság

K i v o n a t

A találmány béta-hidroxi-etil-amin-származékokat vagy ezeknek a származékoknak gyógyászati szempontból elfogadható savaddíciós sóit hatóanyagként tartalmazó gyógyászati és agrokémiai készítmények előállítására szolgáló eljárásra vonatkozik.

A találmány szerinti eljárással előállított gyógyászati készítmények elsősorban patogén fázisu, dimorf élesztőgombasejtek növekedésének gátlására, antimikotikumként alkalmazhatók. Az agrokémiai készítmények elsősorban gombaellenes és növekedésszabályzó szerként használhatók fel. Ezek a készítmények [III] általános képletű hatóanyagokat tartalmaznak, amelyekkel - többek között - meg lehet előzni bizonyos gombás

megbetegedéseket, illetve meg lehet gyógyítani a gombás betegségekben szenvedőket.

A [III] általános képletben:

- R/1/ jelentése hidrogénatom; 1-10 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkilcsoport; 2-10 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen alkenilcsoport; fluoratómmal, klóráttal, brómmal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, metoxycsoporttal, oxi-fenil-csoporttal vagy fenilcsoporttal, adott esetben, egyszeresen vagy többszörösen helyettesített benzilcsoport; karbonil-/1-8 szénatomos alkil/-csoport, amely lehet egyenes és elágazó láncu egyaránt; továbbá karbonil-fenil-csoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom; egyenes vagy elágazó láncu, 1-18 szénatomos alkilcsoport; egyenes vagy elágazó láncu /1-6 szénatomos alkil/-oxi-/1-6 szénatomos alkil/-csoport; egyenes vagy elágazó láncu /1-6 szénatomos alkil/-oxi-fenil-csoport; egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-18 szénatomos alkenilcsoport; monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-12 szénatomos cikloalkilcsoport - például norbornilcsoport, adamantilcsoport vagy dekahidronaftilcsoport -; az egyenes vagy elágazó, 1-6 szénatomos alkilcsoportban egy vagy két hidroxilcsoporttal adott esetben helyettesített fenil-alkil-csoport; egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen fenil-/2-6 szénatomos alkenil/-csoport; egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6

1750/91

10210

Képviselő:

Budapesti 29. sz. Ügyvédi Munkaközösség

ADVOPATENT SZABADALMI IRODA

A
61660

NR05: AGIK 31/135,
ACIN 39/00

Eljárás béta-hidroxi-etil-amin-származékokat hatóanyagként
tartalmazó gyógyászati és agrokémiai készítmények előállít-
tására

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT, Frankfurt am Main

Német Szövetségi Köztársaság

Feltalálók: Dr. KOTTMANN Hariolf, Hofheim am Taunus

Dr. HÄZEL Heinz, Oberursel

Dr. KIRSCH Reinhard, Frankfurt am Main

Német Szövetségi Köztársaság

A bejelentés napja: 1991. 05. 24.

Elsőbbség: 1990. 05. 26. (P 40 17 019.5)

Német Szövetségi Köztársaság



A találmány béta-hidroxi-etil-amin-származékokat hatóanyagként tartalmazó gyógyászati és agrokémiai készítmények előállítására szolgáló eljárásra vonatkozik. A gyógyászati készítmények elsősorban patogén fázisu, dimorf élesztőgombasejtek növekedésének gátlására, valamint antimikotikumként alkalmazhatók, az agrokémiai készítmények pedig növényvédőszerként, például gombaölő és növekedésszabályzó szerként. A találmány szerinti eljárással előállított készítmények alkalmazhatók mind a megelőzésben, mind a gyógyításban.

Néhány bétablokkolóként alkalmazható béta-hidroxi-etil-amin-származékról tudjuk, hogy - ha csekély mértékben is - hatással van emlős állatokban a liposzomális Al-foszfolipáz gátlására /K. Y. Hostetler és mtsai: Biochemical Pharmacology, 34. 521-524 [1985]/. Ezeknek a vegyületeknek azonban nem kielégítő a hatásereőségük, valamint a kompatibilitásuk. Így van ez a [IV] képletű propranolol és a [V] képletű metoprolol esetében is.

Meglepetéssel tapasztaltuk, hogy - mindenkori szubsztitúenseik szerkezetétől függően - egyes béta-hidroxi-etil-amin-származékok hatásosan gátolják a gomba-exoenzimek /patogenitás faktorok/ működését, gombaölő, valamint antimikotikus hatással rendelkeznek és - mindenekelőtt - kiválóan gátolják a patogén fázisu, dimorf élesztőgombák növekedését.

A találmány szerinti eljárással előállítható készítmények hatóanyagai [III] általános képletű béta-hidroxi-etil-amin-származékok, valamint azok gyógyászati szempontból elfogadható savakkal képzett sói. Ezekből a hatóanyagokból olyan gyógyszerek készíthetők, amelyekkel meg lehet előzni egyes gombás

megbetegedéseket, illetve meg lehet gyógyítani gombás betegségekben szenvedőket.

A [III] általános képletben:

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport; fluoratómmal, klóráttal, brómmal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, metoxycsoporttal, fenil-oxi-csoporttal vagy fenilcsoporttal egyszeresen vagy többszörösen adott esetben helyettesített benzilcsoport; /1-8 szénatomos alkil/-karbonil-csoport egyenes vagy elágazó láncu; illetve fenil-karbonil-csoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-18 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu /1-6 szénatomos alkil/-oxi-/1-6 szénatomos alkil/-csoport; egyenes vagy elágazó láncu /1-6 szénatomos alkil/-oxi-fenil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-18 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-12 szénatomos cikloalkilcsoport - például norbornilcsoport, adamantilcsoport vagy dekahidronaftilcsoport -, egyenes vagy elágazó, 1-6 szénatomos alkilcsoportban egy vagy két hidroxilcsoporttal adott esetben helyettesített fenil-alkil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen fenil-/2-6 szénatomos alkenil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6

- szénatomos alkil/-csoport; egy vagy több fluoratommal, klóratommal, brómatommal, 1-10 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkilcsoporttal, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoporttal, hidroxilcsoporttal, merkaptocsoporttal, 1-10 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkoxicssoporttal, 1-4 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkilén-dioxi-csoporttal, dimetil-amino-etoxi-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu /1-4 szénatomos alkoxi/-karbonil-metoxi-csoporttal, fenoxicssoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal, fenetilcsoporttal, tiofenilcsoporttal és/vagy C_nF_{2n+1} általános képletű csoporttal - $n = 1 - 6$ - adott esetben helyettesített fenilcsoport; egyenes vagy elágazó láncu indol-3-il-/1-4 szénatomos alkil/-csoport vagy fluoratommal, klóratommal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy egyenes, illetve elágazó láncu /1-4 szénatomos alkil/-oxi-csoporttal adott esetben helyettesített tienilcsoport, illetve tienil-metil-csoport;
- R/3/ jelentései az R/2/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/3/ és R/2/ mindenkori jelentése független egymástól és R/2/ az R/3/-mal egy olyan, $-/CH_2/m-$ általános képletű láncot képezhet, amelyben m jelentése 4-6 és amelyben az egyik metiléncsoportot oxigénatom, kénatom vagy hidrogénatomot, metilcsoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot vagy fenetilcsoportot hordozó nitrogénatom helyettesítheti; és
 - A jelentése egyenes vagy elágazó láncu, 1-18 szénatomos

alkilcsoport; egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-18 szénatomos alkenilcsoport vagy [II] általános képletű csoport, amelyben

-- R/4/ jelenthet hidrogénatomot, egyenes vagy elágazó láncu, 1-18 szénatomos alkilcsoportot; egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-18 szénatomos alkenilcsoportot; monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal, C_nF_{2n+1} általános képletű csoporttal - $n=1-4$ -, fluoratommal, klóratommal, brómatommal ^{és} vagy hidroxilcsoporttal adott esetben egyszeresen vagy kétszeresen helyettesített, 3-20 szénatomos cikloalkilcsoportot; egyenes vagy elágazó láncu Y- C_1-C_{20} -alkil/-csoportot; egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y- C_2-C_{18} -alkenil/-csoportot; Y- C_3-C_{20} -cikloalkil/-csoportot, amelyben a cikloalkilcsoport monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos lehet és adott esetben helyettesítve van egyszeresen vagy kétszeresen egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal, C_nF_{2n+1} általános képletű csoporttal - $n = 1-4$ -, fluoratommal, klóratommal, brómatommal ^{és} vagy hidroxilcsoporttal; fenilcsoportot, Y-fenil-csoport -

- tot; egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-4 szénatomos alkil/-csoportot; egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-4 szénatomos alkoxi/-csoportot, bifenililcsoportot, fluoratomot, klóratomot, brómatomot, C_nF_{2n+1} általános képletű csoportot - $n = 1-8$ -, triklór-metil-csoportot, YH csoportot, naftilcsoportot, cianocsoportot, nitrocsoportot; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom, kénatom, szulfinilcsoport vagy szulfinilcsoport, a fenilcsoportok pedig fluoratommal, klóratommal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxi csoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesítve lehetnek;
- R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól és abban az esetben, ha R/4/ és R/5/ a fenilgyűrűhöz két szomszédos helyzetben kapcsolódik, együttesen egy $/CH_2/p$ -láncot alkothat, ahol p értéke 3 vagy 4;
 - R/6/ jelenthet hidrogénatomot, egyenes vagy elágazó láncu, 1-15 szénatomos alkilcsoportot, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-15 szénatomos alkenilcsoportot, egyenes vagy elágazó láncu Y-/C₁-C₁₅ -alkil/-csoportot, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-15 szén-

atomos alkenilcsoportot, fenilcsoportot, Y-fe-nil-csoportot, benzilcsoportot, bifenililcsoportot, fluoratomot, klóratomot, brómatomot, jódatomot, C_nF_{2n+1} általános képletű csoportot - $n = 1-8$ -, triklór-metil-csoportot, naftilcsoportot vagy YH általános képletű csoportot; az-al a megjegyzéssel, hogy Y jelentése a már meg-adott; és

- X jelentése oxigénatom vagy kénatom.

Előnyösen alkalmazhatók azok a [III] általános képletű ve-gyületek, amelyeknél

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy kétszeresen telítetlen, 3-8 szénatomos alkenilcsoport, fluoratómmal, klóratómmal, trifluor-me-til-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénato-mos alkilcsoporttal és/vagy metoxicssoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített benzil-csoport vagy egyenes láncu, illetve elágazó láncu /1-6 szénatomos alkil/-karbonil-csoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-16 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu /1-6 szénatomos alkil/-oxi-/1-6 szénatomos alkil/-cso-port, egyenes vagy elágazó láncu /1-6 szénatomos alkil/-oxi-fenil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egysze-resen vagy többszörösen telítetlen, 2-16 szénatomos al-kenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklu-

- sos, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport fluoratómmal, klóratómmal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-2 szénatomos alkilén-dioxi-csoporttal, /1-4 szénatomos alkoxi/-karbonil-metoxi-csoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal, fenetilcsoporttal és/vagy tiofenilcsoporttal, adott esetben, egyszeresen vagy kétszeresen helyettesített fenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu indol-3-il-/1-4 szénatomos alkil/-csoport vagy klóratómmal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy egyenes láncu, illetve elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkil-oxi-csoporttal adott esetben helyettesített tienilcsoportot tartalmazó tienil-metil-csoport;
- R/3/ jelentései az R/2/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/3/ és R/2/ mindenkori jelentése független egymástól és R/2/ az R/3/-mal $-\text{CH}_2/\text{m}$ - általános képletű láncot alkothat, amelyben az egyik metilén-csoportot oxigénatom, kénatom vagy hidrogénatomot, metilcsoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot, illetve fenetilcsoportot hordozó nitrogénatom helyettesítheti; és
 - A jelentése egyenes vagy elágazó láncu, 1-16 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-16 szénatomos alkenilcsoport vagy olyan, [II] általános képletű csoport, amelyben



-- R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-16 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-16 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, illetve egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal egyszeresen adott esetben helyettesített, 3-12 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó Y-/C₁-C₁₆-alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/C₃-C₁₆-alkenil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, illetve egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal egyszeresen adott esetben helyettesített Y-/C₃-C₁₂-cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, fenil-/C₁-C₂-alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/C₁-C₄-alkoxi/-csoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, C_nF_{2n+1} általános képletű csoport - n = 1-4 -, triklór-metil-csoport, nafilcsoport, cianocsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom és a fenilcsoportok - adott esetben - helyettesítve vannak egyszeresen vagy kétszeresen fluoratómmal, klóratómmal, trifluór-metil-csoporttal, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal;

- R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól és abban az esetben, ha R/4/ és R/5/ a fenilgyűrűhöz két szomszédos helyzetben kapcsolódik, együttesen $-\text{CH}_2/\text{p}$ -láncot alkothat, ahol p értéke 3 vagy 4;
- R/6/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-12 szénatomos alkenilcsoport, Y- $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ -alkil/-csoport egyenes vagy elágazó láncsal, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y- $\text{C}_3\text{-C}_{12}$ -alkenil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, brómatom, $\text{C}_n\text{F}_{2n+1}$ általános képletű csoport - n = 1-4 -, triklór-metil-csoport vagy naftilcsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése a már megadott; és

- X jelentése oxigénatom vagy kénatom.

Különösen jó eredménnyel alkalmazhatók azok a vegyületek, amelyeknek [III] általános képletében:

- R/1/ jelentése hidrogénatom, /1-4 szénatomos alkil/-karbonil-csoport egyenes vagy elágazó láncsal, illetve benzilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, /1-6 szénatomos alkil/-oxi-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó

láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-12 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, trifluor-metil-csoporttal, fluoratómmal, klóráttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-2 szénatomos alkilén-dioxi-csoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal és/vagy fenetilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített fenilcsoport; egyenes vagy elágazó láncu indol-3-il-/1-4 szénatomos alkil/-csoport vagy klóráttal, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal a gyűrűn adott esetben helyettesített tienil-metil-csoport;

- R/3/ jelentése hidrogénatom; illetve R/2/ és R/3/ egy olyan, $-/CH_2/m-$ általános képletű láncot alkothat, amelyben $m = 4-6$ és az egyik metilén-csoport helyettesítve lehet oxigénatómmal, kénatómmal vagy hidrogénatómot, metilcsoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot, illetve fenetilcsoportot hordozó nitrogénatómmal;
- A jelentése egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-12 szénatomos alkenilcsoport vagy egy olyan csoport, amelynek [II] általános képletében

-- R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-16 szénatomos alkilcsoport,

- egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telitetlen, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, helyettesitetlen, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-12 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-12 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telitetlen Y-/3-12 szénatomos alkenil/-csoport, helyettesitetlen monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos Y-/3-12 szénatomos cikloalkil/-csoport; fenilcsoport, Y-fenil-csoport, fenil-/1-2 szénatomos alkil/-csoport, fenil-/1-4 szénatomos alkoxi/-csoport egyenes vagy elágazó láncu, bifenilcsoport, fluoratom, klóratom, illetve naftilcsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom és a fenilcsoportok fluoratommal, klóratommal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes és/vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesítve vannak;
- R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól;
- R/6/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen

telitetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telitetlen Y-/3-10 szénatomos alkenil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, fluoratom, klóratom vagy trifluor-metilcsoport; és

- X jelentése oxigénatom.

Egészen különlegesen jó eredménnyel alkalmazhatók azok a vegyületek, amelyeknek [III] általános képletében:

- R/1/ jelentése hidrogénatom, metil-karbonil-csoport vagy benzilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telitetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, /1-3 szénatomos alkil/-oxi-/1-3 szénatomos alkil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, fenil-/1-4 szénatomos alkil/-csoport egyenes vagy elágazó láncu, difenil-/1-4 szénatomos alkil/-csoport egyenes vagy elágazó láncu, fluoratómmal, klóratómmal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-2 szénatomos alkilén-dioxi-csoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal és/vagy fenetilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített fenilcsoport; egyenes vagy elágazó láncu indol-3-il-/1-4 szénatomos alkil/-csoport, a tienilcsoporton klóratómmal, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, illetve 1-4 szénatomos

alkoxicsoporttal adott esetben helyettesített tienil-metil-csoport;

- R/3/ jelentése hidrogénatom;
- A jelentése egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport vagy olyan csoport, amelynek [II] általános képében

-- R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, helyettesítetlen, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu
 Y-/1-12 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-12 szénatomos alkenilcsoport, helyettesítetlen, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos Y-/3-10 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, benzil-oxi-csoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom vagy trifluor-metil-csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom és a fenilcsoportok fluoratommal, klóratommal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal

egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesítve vannak;

-- R/5/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy kétszeresen telítetlen, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-12 szénatomos alkil/-csoport, Y-/3-6 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, fluoratom, klóratom vagy trifluor-metil-csoport;

-- R/6/ jelentése hidrogénatom; és

- X jelentése oxigénatom.

Meglepetéssel tapasztaltuk, hogy a béta-hidroxi-etil-amin-származékok - a mindenkori szubsztituenseik szerkezetétől függően - hatásosan gátolják a gombák exoenzimjeit /patogenitásfaktorait/, gombaölő, valamint antimikotikus hatással rendelkeznek és különösen kiválóan gátolják a patogén fázisú, dimorf élesztőgombák növekedését.

A találmányunk tárgyát képezi ennél fogva a [I] általános képletű béta-hidroxi-etil-amin-származékoknak, valamint az ezeket a származékokat hatóanyagként tartalmazó gyógyászati készítményeknek az alkalmazása gombás megbetegedések megelőzésére, illetve gombás betegségekben szenvedők gyógyítására. A [I] általános képletben:

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu,

- egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport, fluoratómmal, klóráttal, brómatómmal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, metoxicssoporttal, fenil-oxi-csoporttal és/vagy fenilcsoporttal egyszeresen vagy többszörösen adott esetben helyettesített benzilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy kétszeresen telítetlen fenil-/2-6 szénatomos alkenil/-csoport, difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport egyenes vagy elágazó láncsal, fluoratómmal, klóráttal, brómatómmal, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoporttal, hidroxilcsoporttal, merkaptocsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkoxicssoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal, fenetilcsoporttal, tiofenilcsoporttal és/vagy C_nF_{2n+1} általános képletű csoporttal - $n = 1-6$ - egyszeresen vagy többszörösen adott esetben helyettesített fenilcsoport;
 - R/3/ jelentései az R/2/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/3/ és R/2/ mindenkorai jelentése független egymástól, továbbá R/2/ és R/3/ egy $-/CH_2/_m-$ általános képletű láncot képezhet,

amelyben $m = 4-6$ és az egyik metilénecsoport helyettesítve lehet oxigénatommal, kénatommal vagy hidrogénatomot, metilcsoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot, illetve fenetilcsoportot hordozó nitrogénatommal;

- R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-15 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-15 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal, C_nF_{2n+1} általános képletű csoporttal - $n = 1-4$ -, fluoratommal, klóratommal, brómatommal és/vagy hidroxilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített, 3-20 szénatomos cikloalkilcsoport - így például norbornilcsoport, adamantilcsoport vagy dekahidronaftilcsoport -; egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-15 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/2-15 szénatomos alkenil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal, C_nF_{2n+1} általános képletű csoporttal - $n = 1-4$ -, fluoratommal, klóratommal, brómatommal és/vagy hidroxilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített, 3-20 szénatomos Y-/3-20 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, fenil-/1-2 szénatomos alkil/-csoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, brómatom, jódatom, C_nF_{2n+1} általános képletű csoport - $n = 1-8$ -, triklór-metil-csoport, YH általános képletű csoport, naf-

tilcsoport, cianocsoport, nitrocsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;

- R/5/ jelentése az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól, továbbá abban az esetben, ha R/4/ és R/5/ a fenilgyűrűhöz egymással szomszédos helyzetekben kapcsolódik, együttesen $-\text{CH}_2/\text{p}-$ általános képletű láncot alkothat, ahol p értéke 3 vagy 4;
- R/6/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-15 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-15 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/2-15 szénatomos alkenil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, brómatom, jódatom, $\text{C}_n\text{F}_{2n+1}$ általános képletű csoport - $n = 1-8$ -, triklór-metil-csoport, naftilcsoport vagy YH általános képletű csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;
- X jelentése oxigénatom, kénatom, szulfinilcsoport vagy szulfonilcsoport

Az előzőekben definiált, [I] általános képletű vegyületeket - önmagukban vagy gyógyszerkészítmények formájában - gyógyászati szempontból elfogadható savakkal képzett sóik alakjában is lehet alkalmazni.

A [I] általános képletű vegyületek közül előnyösen lehet alkalmazni - adott esetben gyógyászati szempontból elfogadható só-

ik alakjában - azokat, amelyeknek képletében:

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, fluoratómmal, klóráttal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy metoxycsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített benzilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, hidroxilcsoporttal, fluoratómmal, klóráttal, bróráttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxycsoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal és/vagy fenetilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített fenilcsoport;
- R/3/ jelentései az R/2/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/3/ és R/2/ mindenkor jelentése független egymástól, továbbá R/2/ és R/3/ együttesen egy $-\text{CH}_2/\text{m}-$ általános képletű láncot képezhet, amelyben m jelentése 4-6 és az egyik metilén-csoport helyettesítve lehet oxigénatómmal vagy hidrogénatómmal, metilcsoporttal, fenilcsoporttal, benzil-

- csoportot vagy fenetilcsoportot hordozó nitrogénatommal;
- R/4/ jelentése hidrogénatom, 1-15 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkilcsoport, 2-15 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal egyszeresen adott esetben helyettesített, 3-15 szénatomos cikloalkilcsoport - például norbornilcsoport, adamantilcsoport, dekahidronaftilcsoport -, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/2-10 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal egyszeresen adott esetben helyettesített Y-/3-15 szénatomos cikloalkilcsoport, fenilcsoport, Y-fenilcsoport, fenil-/1-2 szénatomos alkilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, C_nF_{2n+1} általános képletű csoport - $n = 1-4$ -, triklór-metilcsoport, nafilcsoport vagy cianocsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;
 - R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól, továbbá abban az esetben, ha R/4/ és R/5/ a fenilgyűrűhöz egymással szomszédos helyzetekben kapcsolódik, együttesen egy $-CH_2/p-$ általános képletű láncot alkothat, ahol p értéke

3 vagy 4;

- R/6/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-10 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy kétszeresen telítetlen Y-/2-10 szénatomos alkenil/-csoport, fenilcsoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, brómatom, $C_n^F_{2n+1}$ általános képletű csoport - $n = 1-4$ -, triklór-metil-csoport vagy naftilcsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;
- X jelentése oxigénatom vagy kénatom.

Különösen előnyösen alkalmazhatók azok a vegyületek, amelyeknek /I/ általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, fluoratommal, klóratommal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy metoxicssoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített benzilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy kétszeresen telítetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, hidroxilcsoporttal fluoratommal, klóratommal, brómatommal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal, fe-

- nilcsoporttal és/vagy benzilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített fenilcsoport,
- R/3/ jelentése hidrogénatom vagy R/2/ és R/3/ együttesen egy $-\text{CH}_2/\text{m}-$ általános képletű láncot alkot $m = 4-5$, amelyben egy metilén-csoport helyettesítve lehet egy oxigénatommal vagy hidrogénatomot, metilcsoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot vagy fenetilcsoportot hordozó nitrogénatommal;
 - R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-15 szénatomos cikloalkilcsoport - például norbornilcsoport, adamantilcsoport vagy dekahidronaftilcsoport -, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-10 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/2-10 szénatomos alkenil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos Y-/3-15 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, $\text{C}_n\text{F}_{2n+1}$ általános képletű csoport $n = 1-4$, naftilcsoport vagy cianocsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;
 - R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól;
 - R/6/ jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkilcsoport, Y-/1-4 szénatomos alkil/-csoport egyenes vagy elágazó láncúval, fluoratom, klór-

atom vagy trifluor-metil-csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;

- X jelentése oxigénatom.

Egészen kiváló eredménnyel alkalmazhatók azok a vegyületek, amelyeknek /I/ általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom vagy benzilcsoport;

- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, továbbá olyan, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-4 szénatomos alkil/-csoport, amely magban - adott esetben - egyszeresen szubsztituált lehet fluoratómmal, klóráttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal;

- R/3/ jelentése hidrogénatom;

- R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-15 szénatomos cikloalkilcsoport - például norbornil, adamantil vagy dekahidronaftilcsoport -, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-10 szénatomos alkil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos Y-/3-15 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom vagy C_nF_{2n+1} általános képletű csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy $n = 1-4$ és Y jelentése kénatom;

- R/5/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-6 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, Y-/3-6 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, fluoratom, klóratom vagy trifluor-metil-csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom;
- R/6/ jelentése hidrogénatom;
- X jelentése oxigénatom.

A leírásban szereplő alkilcsoportok és alkenilcsoportok egyenes láncuak és elágazó láncuak egyaránt lehetnek; még abban az esetben is, ha ezt külön nem jeleztük.

A /I/ általános képletű vegyületeket például a 4 191 765. sz. amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírásban ismertett eljárással lehet előállítani. A kiindulási anyagként alkalmazott vegyületeket meg lehet vásárolni vagy ismert módon elő lehet állítani.

Találmányunk nemcsak a /I/ általános képletű szabad bázisoknak, hanem a szabad bázisok savaddíciós sóinak - mint a gombák exoenzimjét ugyancsak hatásosan gátló anyagoknak - az alkalmazására is vonatkozik.

A gyógyászati szempontból elfogadható, sóképző savakra példaként megemlítjük a szervetlen savak közül a sósavat, a hidrogén-bromidot, a hidrogén-jodidot, a kénsavat, a foszforsavat és a salétromsavat, a szerves savak közül pedig a malonsavat, az oxálsavat, a glukonsavat, a kámforszulfonsavat, a benzolszul-

fonsavat, ecetsavat, propionsavat, p-toluolszulfonsavat vagy szalicilsavat.

A [I] általános képletű vegyületek legalább egy aszimmetrikus szénatommal rendelkeznek, így enantiomerek és diasztereomerek alakjában egyaránt előfordulhatnak. Találmányunk vonatkozik mind a tiszta izomerek, mind az izomerelegyek felhasználására. A diasztereomer elegyeket szokásosan alkalmazott módszerekkel, például megfelelő oldószerekből végzett szelektív kristályosítással vagy szilikagélen, illetve alumínium-oxidon végrehajtott kromatografálással szét lehet választani komponenseikre.

A racemátokat szokásosan alkalmazott módszerekkel lehet enantiomerekre bontani: például optikailag aktív savakkal végrehajtott sóképzéssel, a diasztereomer sók szétválasztásával és a tiszta enantiomerek valamilyen bázissal való felszabadi-tásával. Mindezen túlmenően az enantiomereket kromatográfiai módszerekkel is el lehet különíteni királis fázisokra vagy enzimes eljárásokkal is szét lehet választani a racemátokat.

A [I] általános képletű vegyületek, savaddíciós sóik és fiziológiailag hidrolizálható származékaik értékes gyógyhatású anyagok. Elsősorban a mikrobák ellen hatnak és alkalmasak arra, hogy embereknél és különböző emlősállatoknál megelőzzük velük a gombás megbetegedéseket, illetve kezeljük velük a gombás fertőzésben szenvedőket.

A [I] általános képletű vegyületek in vitro nagyon hatásosak a bőrgombák - például a *Trichophyton mentagrophytes*, a *Microsporum canis*, az *Epidermophyton floccosum* -, a penészgombák - például az *Aspergillus niger* -, az élesztőgombák - így

a *Candida albicans*, a *C. tropicalis*, a *Torulopsis glabrata* és a *Trichosporon cutaneum* -, a protozoák - így a *Trichomonas vaginalis* vagy a *T. fetus* - vagy a grampozitív és a gramnegatív baktériumok ellen.

In vivo körülmények között is - például egerek kísérleti vesekandidózisánál - az orálisan vagy parenterálisan alkalmazott vegyületek igen jó szisztémás hatást mutatnak, így *Candida albicans* ellen. Ebben az esetben a *Candida albicans* élesztőgomba elsősoerban az exoenzimrendszert befolyásolja olyan mértékben, hogy a kórokozó patogenitása kifejezetten csökken. Hasonlóan nagyon jó hatást tapasztaltunk tengerimalacoknál a különböző, bőrgombás megbetegedéseket előidéző kórokozók ellen - például a *Trichophyton mentagrophytes* ellen - orális, parenterális vagy lokális alkalmazás esetén.

Az embergyógyászatban a javasolt felhasználások például a következők lehetnek: *Trichophyton mentagrophytes* és más *Trichophyták*, mikrospórafajták, *Epidermophyton floccosum* és kétfázisú gombák, például penészgombák által okozott bőrgombásodások és szisztémás gombafertőzések ellen. Elsősorban a mélyreható, a *Candida albicans* által előidézett gombafertőzéseknel lehet jó eredményeket előidézni a találmány szerinti vegyületekkel, amelyek megakadályozzák a gombák behatolását a gazdasejtekbe, illetve megnehezítik a gombák számára a behatolást a gazdasejtekbe.

Az állatgyógyászatban például a következők lehetnek a javasolt felhasználások: az összes gombás bőrmegbetegedés, illetve szisztémás gombás megbetegedések ellen; ezeken belül a már említett kórokozók által előidézett betegségek ellen elsősorban.

A találmányunk tárgyát képezik azok a gyógyászati készítmények is, amelyek nem mérgező, iners, gyógyászati szempontból alkalmas hordozóanyagok mellett egyet vagy többet tartalmaznak a találmányunk szerint alkalmazható hatóanyagokból. A találmányunkhoz tartozik még az ezeknek a készítményeknek az előállítására szolgáló eljárás is.

A nem toxikus, iners, gyógyászati szempontból alkalmas hordozóanyagokon szilárd, félig szilárd vagy folyékony hígító anyagokat, töltőanyagokat és mindenféle kisserelési segédanyagokat értjük.

A különböző, *Candida albicans* beli foszfolipázokat gátló adalékanyagnak a páciensekben mindenütt elegendő koncentrációban rendelkezésre kell állnia ott, ahol a gomba meg tud telepedni a szerveket beágyazó lágy sejtszövetekben. Így a megfelelő hatóanyagot olyan koncentrációban kell biztosítani, amely az előzetes állatkísérletek során hatásosnak bizonyult.

A mélyre került *Candidose* súlyos kórképeit mutató betegek többnyire rossz állapotban vannak. Magas lázuk van és gyakran fellépnek további betegségek. Az adagolási utasításokat illetően különbséget kell tenni aszerint, hogy megelőzésről vagy diagnosztizált fertőzés kikezeléséről van-e szó. Megelőzés esetén abból lehet kiindulni, hogy a betegek általános állapota jobb, tehát lehetséges a szájon keresztüli szervezetbe juttatás. Ebben az esetben alkalmazni lehet tablettákat, oldatokat, géleket vagy liofilizált leveket. A diagnosztizált mély kandidózisoknál gyakran abból kell kiindulni, hogy a hatóanyag szabályozott orális felvétele nem mindig biztosított. Ebben az esetben számitásba jön a parenterális alkalmazási formák használata. Ki-

vételes esetben gondolni lehet a szubkután beadásra is.

A megelőzéses kezelést illetően elsősorban az immunkomprimált páciensek jönnek szóba, akik megfelelő gyógyszeres terhelés vagy szervezeti immunprobléma miatt ebben az állapotban vannak. Ilyenek elsősorban a szervátültetéses páciensek, a cukorbeteg és/vagy zsirdaganatos betegek, az AIDS-esek, a kemoterápiás kezelés alatt állók, a hosszú idő óta mesterségesen lélegeztetettek stb.

A vegyületek gátló hatást mutatnak a *Candida albicans* foszfolipázára; mégpedig olyan koncentrációkban, amelyek messze alatta vannak a *Candida albicans* elleni hatóanyagra in vitro megállapított minimális inhibitor-koncentrációknak. Így rendszerint kisebb dózisokban lehet alkalmazni ezeket a vegyületeket, mint amikor már gombaellenes terápiáról van szó.

A betegekben kifejtett hatás azon alapszik, hogy a hatóanyagok a parenchyma /lágyszövet/ közelében található *Candida*-sejtekre két különböző hatást fejtenek ki. Az első hatás abban nyilvánul meg, hogy a hatóanyagok megakadályozzák az élesztőgombasejtek rátapadását a test sejtjeire. A másik hatás abban akadályozza meg a *Candida albicans*-t, hogy a test sejtjeibe behatoljon a csiratömlőcskéivel. Ennek a kettős hatásnak az eredményeként az élesztőgombák nem tudják teljes mértékben kifejteni kórokozó hatásukat. Ezzel kapcsolatban azonban meg kell említeni, hogy a foszfolipázokon kívül a *Candida albicans* még további betegséget eredményező mechanizmusokra képes, például a proteáz enzim révén. A behatoláshoz vezető első lépés azonban mindenesetre a test sejtjeire való rátapadás. Mivel a foszfolipázgátlók

akadályozzák ezt a tapadást, a többi betegséget okozó mechanizmus sem tud teljes mértékben érvényre jutni.

Adagolási formaként számításba lehet venni például a tablettákat, drazsékat, kapszulákat, pilulákat, vizes oldatokat, szuszpenziókat és emulziókat, adott esetben steril, injektálható oldatokat, nemvizes emulziókat, szuszpenziókat és oldatokat, kenőcsöket, krémeket, pasztákat, lemosószereket, permeteket.

A profilaktikusan és terápiásan hatásosan alkalmazható vegyületeket az előző bekezdésben felsorolt gyógyászati készítményekbe mintegy 0,1-99,5 m% - előnyösen mintegy 0,5-95 m% - mennyiségben célszerű beletenni.

A felsorolt gyógyászati készítmények a találmányunk szerint alkalmazott hatóanyagokon kívül további gyógyhatású anyagokat is tartalmazhatnak.

A felsorolt gyógyászati készítményeket szokásos módon, ismert eljárásokkal állítjuk elő; például úgy, hogy a hatóanyagot vagy a hatóanyagokat összekeverjük hordozóanyaggal vagy hordozóanyagokkal.

A találmányunkhoz tartozik a találmányunk szerinti hatóanyagok, illetve az egy vagy több találmányunk szerinti hatóanyagot tartalmazó gyógyászati készítmények alkalmazása az ember- és állatgyógyászatban a már felsorolt betegségek elhárítására, illetve a felsorolt betegségekben szenvedők állapotának a javítására és/vagy a betegek kigyógyítására.

A hatóanyagokat vagy a gyógyászati készítményeket lokálisan, orálisan, parenterálisan, intraperitoneálisan és/vagy rektálisan lehet alkalmazni.

A találmányunk szerinti hatóanyagot vagy hatóanyagokat általában legalább mintegy 0,05 - előnyösen 0,1, célszerűen 0,5 - mg/kg testtömeg napi dózisban, legfeljebb 200 - előnyösen 100, célszerűen 10 - mg/kg testtömeg napi dózisban alkalmazzuk a kívánt eredmény eléréséhez. Az összdózist 1-8, előnyösen 1-3 egyszeri adagban alkalmazzuk; mély mikózis esetén azonban lényegesen hosszabb időn, akár hat héten át.

Ezzel kapcsolatban azonban megemlítjük, hogy bizonyos esetekben el lehet térni az előző bekezdésben közölt dózisoktól a kezelendő test fajtájától és tömegétől, a megbetegedés fajtájától és súlyosságától, a gyógyszer elkészítési és alkalmazási módjától, valamint az alkalmazás időtartamától és az adagolás szüneteltetésének hosszúságától stb. függően. Így egyes esetekben a megadott dózisoknál kisebb, más esetekben azonban a megadottaknál nagyobb mennyiségekben kell alkalmazni a hatóanyagokat. A hatóanyag mindenkor szükséges optimális adagolását, valamint alkalmazásának módját a szakemberek tudásuk alapján könnyen meg tudják állapítani.

A /I/ általános képletű vegyületeknek biocid-aktivitásuk is van. Elsősorban a fitopatogén gombákra gyakorolt gombaölő hatásukkal tűnnek ki. Segítségükkel még a növényi szövetekbe behatolt gomba-kórokozókat is sikeresen le lehet küzdeni. Ez különösen fontos és előnyös azoknál a gombás betegségeknél, amelyeknél a fellépett fertőzést az egyébként szokásosan használt fungicidekkel már nem lehet leküzdeni. A /I/ általános képletű vegyületek hatásspektruma kiterjed nagyszámu, különböző fitopatogén gombára /*Botrytic cinerea*, lisztharmat, *Drechslera teres*, *Venturie inaeguallis*, *Cerospora beticola*, *Phytophthora infestans*, *Plasmopara viticola*, különböző rozsdagombafajták

- elsősorban *Plasmopara viticola* - gyümölcs-, zöldség-, gabona- és disznóvény-kultúrákban/.

A /I/ általános képletű vegyületeket szokásos kiszerelési formákban - permetezhető porok, emulgeálható koncentrátumok, permetezhető oldatok, porozószeresek, csávázószeresek, diszperziók, granulátumok vagy mikrogranulátumok - lehet alkalmazni.

Permetezhető porokon azokat a készítményeket értjük, amelyek vízzel egyenletesen diszpergálhatók. Ezek a készítmények a hatóanyag mellett adott esetben tartalmaznak még egy higitószert vagy iners anyagot, valamint van bennük nedvesítőszert, például polietoxilezett alkil-fenol, polietoxilezett zsiralkohol, alkil- vagy alkil-fenil-szulfonát - továbbá diszpergálószer - például ligninszulfonsav-nátrium-só, 2,2'-dinaftil-metán-6,6'-diszulfonsav nátrium-só, dibutil-naftalinszulfonsav-nátrium-só vagy oleoil-metil-aurinsav-nátrium-só. Ezeket a készítményeket szokásosan állítjuk elő, például a komponensek megőrlésével és összekeverésével.

Az emulgeálható koncentrátumokat például úgy állítjuk elő, hogy a hatóanyagot feloldjuk iners szerves oldószerben, például butanolban, ciklohexanonban, dimetil-formamidban, xilolban vagy magas forráspontu aromás vegyületekben, illetve más szénhidrogénekben egy vagy több emulgeátor adagolása mellett. Folyékony hatóanyagok esetében az oldószertől részben vagy teljesen el lehet tekinteni. Az alkalmazható emulgeátorokra példaként megemlítjük az alkil-aril-szulfonsav-kalcium-sókat, így a kalcium-dodecyl-benzolszulfonátot, illetve a nemionos emulgeátorokat, így a zsirsavas poliglikolésztereket, az alkil-aril-poliglikolétereket, a zsiralkohol-poliglikolétereket, a propilén-oxid és az etilén-oxid kondenzációs termékeit, a zsiralkoholok propilén-oxiddal

és etilén-oxiddal alkotott kondenzációs termékeit, az alkil-poliglikolétereket, a szorbitán-zsirsav-észtereket, a poli/oxi-etilén/-szorbitán-zsirsav-észtereket és a poli/oxi-etilén/-szorbit-észtereket.

Porozószereket úgy készíthetünk, hogy a hatóanyagokat összeőröljük finom eloszlású szilárd anyagokkal, például talkummal, természetes agyagokkal - így kaolinnal, bentonittal, pirofillit-tel - vagy diatomafölddel.

Granulátumokat vagy úgy állítunk elő, hogy hatóanyagokat rápermetezzünk adszorpcióképes, granulált iners anyagokra, vagy úgy járunk el, hogy kötőanyagok segítségével hatóanyag-koncentrátumokat viszünk fel hordozóanyagok - például homok, kaolin vagy granulált iners anyagok - felületére. Kötőanyagként például poli/vinil-alkohol/-t, poliakrilsav-nátrium-sót vagy ásványolajokat használhatunk. Alkalmas hatóanyagokat lehet granulálni a műtrágya-granulátumok készítéséhez használt eljárással is, kivánt esetben a műtrágyával összekeverve.

A permetezhető porokban a hatóanyag-koncentráció például mintegy 10-90 m%. A fennmaradó részt a szokásosan alkalmazott formálási segédanyagok teszik ki. Az emulgeálható koncentrátumok hatóanyag-tartalma mintegy 10-80 m% lehet, a permetezhető oldatoké pedig mintegy 1-20 m%. A granulátumoknál a hatóanyag-tartalom részben attól függ, hogy a hatásos vegyület folyékony-e vagy szilárd, részben pedig attól, hogy milyen granulálási segédanyagokat stb. alkalmazunk.

Az ismertettek mellett az említett hatóanyag kiszerezési formák adott esetben tartalmazhatnak szokásosan használt tapadástnövelő adalékokat, nedvesítőszereket, diszpergálószereket, emulgeálószereket, penetrációs adalékokat, oldószereket, töltő-

anyagokat vagy hordozóanyagokat.

A kereskedelmi forgalomban szokásosan beszerezhető koncentrált kiszerelési formákat adott esetben fel lehet higitani az alkalmazás előtt, például permetezhető porok, emulgeálható koncentrátumok, diszperziók és egyes mikrogranulátumok alkalmazásakor. A higitást vízzel végezzük. Por alaku és granulált készítmények, valamint permetezhető oldatok alkalmazásakor rendszerint nem alkalmazunk további iners anyagot a higitásra.

Más hatóanyagokkal - például inszekticidekkel, akaricidekkel, herbicidekkel, műtrágyákkal, növekedésszabályozókkal vagy más gombaölőszerekkel - is keverhetjük a találmányunk szerinti hatóanyagokat, illetve kevert hatóanyagú készítményeket is előállíthatunk más hatóanyagok felhasználásával. Ezeknek a készítményeknek vagy hatóanyagelegyeknek az előállításával szinergikus hatásfokozás is lehet a célunk.

A következőkben néhány formálási példát közlünk.

A porkészítmények előállításakor például úgy járunk el, hogy verőmalomban összeapritunk 90 m% talkummal - mint iners anyaggal - összekevert, 10 m% mennyiségű hatóanyagot, például 1.1 képletű hatóanyagot.

A vízzel könnyen diszpergálható, nedvesíthető porok tartalmazhatnak például 25 tömegrész hatóanyagot, 65 tömegrész kaolintartalmu kvarcot - iners anyagként -, 10 tömegrész ligninszulfonsav-kalcium-sót - nedvesítő és diszpergáló adalékként. A felsorolt komponenseket - hatóanyagként például az 1.1 képletű vegyületet alkalmazva - malomban összeőröljük.

Vizben könnyen diszpergálható diszperziókoncentrátumot például úgy állítunk elő, hogy összekeverünk 20 tömegrész hatóanya-

got - így például 1.1 képletű vegyületet - 6 tömegrész alkil-fenol-poliglikol-éterrel - például Triton X 207-tel -, 3 tömegrész izotridekanol-poliglikoléterrel - amelynek az etoxiszáma 8 - és 71 tömegrész parafinos ásványolajjal - amelynek a forrásponttartománya például 255-377°C lehet, majd a kapott keveréket golyósmalomban 5 mikron alatti méretre őröljük.

Emulgeálható koncentrátumot előállíthatunk például úgy, hogy 15 tömegrész hatóanyagot - például 1.1 képletű vegyületet -, oldószerként 75 tömegrész ciklohexanont és emulgeátorként 10 tömegrész etoxilezett - 10 etoxiszámu - nonil-fenolt összekeverünk.

A patogén fázisu, dimorf élesztőgombasejtek gátlására példaként ismertetjük egy enzimes in vitro teszt eredményeit, amelynél a hatásosság mértékének a szabaddá tett exoenzimek - első sorban a szabaddá tett lizofoszfolipáz /B foszfolipáz/ százalékos gátlását tekintettük.

Az enzimgátlás meghatározására *Candida albicans* csirakonidiumokból /Stamm 200/175/ szuszpenziót készítettünk, amelynek a csirasűrűségét 0,5-re /500 nm/ állítottuk be fotometrikan. Ezt a szuszpenziót összekevertük a preparátumoldattal, illetve - kontrolláláshoz - az oldószeres oldattal:

- a/ 100 μ l preparátumoldat /szuszpenzió/
+900 μ l csirasuszpenzió
- b/ 100 μ l oldószer
+900 μ l csirasuszpenzió

A 21°C-on 30 percen keresztül inkubált blasztokonidiumszuszpenzióból minden esetben 5 μ l-t rácseppentettünk egy agárlemezre /Sabourand Agar, adalékolva 8 m% tojássárgájával, 1 M

nátrium-kloriddal és 5 mM kalcium-kloriddal/. Az így beoltott lemezeket 3 napon keresztül gőzöltük 37°C-on.

A kiértékelést úgy végeztük, hogy meghatároztuk:

1. a kezelt valamint a kezeletlen *Candida albicans* kolóniák mm-ben kifejezett átmérőjét, valamint

2. a kolóniák és az exoenzimek által előidézett homályos udvarok összesített átmérőjét mind a kezelt, mind a kezeletlen tenyészetekre.

A preparátumok és a kontrollcsoportok kvocienseinek a meghatározásából adódott egy érték, amelyet az enzimaktivitás mértékének lehetett tekinteni. Amint az I. táblázat adataiból kitűnik, a találmányunk szerint alkalmazott vegyületek a szabaddá tett exoenzimeket lényegesen jobban gátolják, mint a propranolol, amelyet a szakirodalom /Pappu A.S. és mtsai: Biochem. Pharmacol., 34. 521-524 [1985]/ a leghatásosabb anyagnak írják le májsejtekből származó foszfolipázzal szemben, a gátlóhatásra vonatkozóan elvégzett, megfelelő in vitro vizsgálat eredményei alapján.

A technika állásának tekinthető, előző bekezdés szerinti eredményeket a találmányunk szerint alkalmazott, /I/ általános képletű hatóanyagokkal - meglepő módon - szembetűnő módon felül lehet mulni.

Az I. táblázatban a találmányunk szerint alkalmazható hatóanyagok kémiai szerkezetére utaló képletszámok mellett megadjuk az adott koncentráció esetében mért százalékos foszfolipázgátló hatást.

I. táblázat: *Candida albicans* szabaddá tett exoenzimjeinek
százalékos gátlása in vitro körülmények között

Hatóanyag	Koncentráció [ug/ml]	A foszfolipáz %-os gátlása
1	5	62,5
2	5	50
3	10	42,8
4	50	100
5	50	50
6	10	87,5
7	10	50
8	50	75
	10	25
9	10	75
10	10	75
11	50	40
12	100	100
	50	100
13	50	100
	10	30
14	50	100
	10	33
15	50	86
	10	29
16	100	100
	50	100
	10	50

I. táblázat: /1. folytatás/

Hatóanyag	Koncentráció [$\mu\text{g/ml}$]	A foszfolipáz %-os gátlása
17	100	100
	50	100
	10	92,9
18	50	91
	10	14,3
19	100	100
	50	87,5
20	100	100
	50	30
21	100	100
	50	44,4
	10	25
22	100	100
	50	100
23	100	100
	50	100
24	100	100
	50	100
Propranolol	100	30
25	50	100
	10	100
	5	20

I. táblázat: /2. folytatás/

Hatóanyag	Koncentráció [$\mu\text{g/ml}$]	A foszfolipáz %-os gátlása
26	50	100
	10	100
	5	22
27	50	100
	10	100
	5	30
28	50	100
	10	100
	5	45
29	10	100
	5	100
	1	10
30	10	100
	5	100
	1	0
31	100	100
	50	67
	10	20
32	100	100
	50	100
	10	100
33	100	100
	50	100
	10	10

I. táblázat: /3. folytatás/

Hatóanyag	Koncentráció [$\mu\text{g/ml}$]	A foszfolipáz %-os gátlása
34	100	100
	50	100
	10	100
	5	100
35	100	100
	50	100
	10	33
36	100	100
	50	100
	10	100
	5	8
37	100	100
	50	100
38	100	100
	50	100
39	100	100
	50	100
40	100	100
	50	100
	10	100
	5	17
41	100	100
	50	100
	10	50

I. táblázat: /4. folytatás/

Hatóanyag	Koncentráció [$\mu\text{g/ml}$]	A foszfolipáz %-os gátlása
42	100	100
	50	100
43	10	100
	5	100
44	100	100
	50	100
	10	45
45	100	100
	50	100
	10	10
46	10	100
	5	100
47	100	100
	50	50
48	10	100
	5	100
	1	10
49	100	100
	50	100
	10	11
50	100	56
	50	23

I. táblázat: /5. folytatás/

Hatóanyag	Koncentráció [$\mu\text{g/ml}$]	A foszfolipáz %-os gátlása
51/a	100	100
	50	100
	10	75
51/b	100	100
	50	100
	10	75
52	100	100
	50	100
	10	67
53	50	100
	10	100
54	100	100
	50	100
55	100	100
	50	100
56	100	100
	50	100
57	50	100
58	100	100
	50	100
59	100	100
	50	100

I. táblázat: /6. folytatás/

Hatóanyag	Koncentráció [$\mu\text{g/ml}$]	A foszfolipáz %-os gátlása
60	100	100
	50	100
61	100	100
	50	60
62	100	100
	50	100
63	100	100
	50	100
	10	100
	5	34
64	100	100
	50	100
	10	30
65	10	100
	5	100
66	50	100
	10	100
	5	40
67	10	100
	5	100
68	100	100
	50	100
	10	30

I. táblázat: /7. folytatás/

Hatóanyag	Koncentráció [$\mu\text{g/ml}$]	A foszfolipáz %-os gátlása
69	100	100
	50	100

A vegyületek szisztémás in vivo hatásosságának bemutatására egereket lehet megfertőzni szisztémásan *Candida albicans*-szal. Ennek a megoldásnak az a célja, hogy kiderítsük, milyen aktívak a készítmények a szisztémás *Candida albicans* fertőzéssel szemben. Ez a fertőzés 2-4 napon belül az állatok pusztulásához vezet.

A módszer leírása: 15-20 g testömegű, him albino egereket /NMRI/ intravénásan megfertőztünk *Candida albicans* élesztőgombasejtekkel /Stamm 200/175/, amelyeket frissen előtenyésztettünk malátaagaron és fiziológiás konyhasóoldatban szuszpendáltunk. Az adott időintervallumon belül pusztulást előidéző fertőző dózist fotometrián állítottuk be: egerenként 1 millió élesztőgombasejtet.

A vizsgálat tárgyát képező vegyületeket vagy önmagukban vagy valamilyen szokásosan alkalmazott gombaellenes hatóanyaggal kombináltan használtuk. Olyan vizsgálatot végeztünk, amely-nél a kombinált preparátum szokásosan alkalmazott antimikotikumként flukozanolt /Pfizer-cég/ tartalmazott. Az alkalmazási módok anyagcsoportonként különbözők lehetnek, de a szájon keresztüli alkalmazást előnyben részesítjük. Az egereket 4 héten keresztül megfigyelés alatt tartottuk, naponta feljegyeztük a

mortalitási adatokat és az egyes csoportok túlélési idejeit, amelyeket egymással összehasonlítottunk. Az egyes csoportokban átlagosan 10 állat volt. A középértékek összehasonlítása a Students T teszttel történik.

A II. táblázatban bemutatjuk, hogy például a /16/ képletű vegyület adagolása esetén /14 x 50 mg/kg dózis, szájon keresztüli adagolás, naponta egyszer/ a Candida-val fertőzött egereknek a túlélési ideje 65 %-kal meghosszabbodik. /A csak flukozanollal kezelt állatok túlélési idejét 100-nak véve adódott a 165-ös érték a kombinált hatóanyaggal végzett kezelésre./

II. táblázat: A Candida-val fertőzött egerek túlélési ideje flukozanolos kombinált terápia alkalmazása esetén

Vegyületmegnevezés	Túlélési idő a flukonazolra vonatkoztatva
Flukonazol	100 %
Flukonazol+ a /7/ képletű vegyület	127 %
Flukonazol+ a /9/ képletű vegyület	131 %
Flukonazol+ a /10/ képletű vegyület	149 %
Flukonazol+ a /16/ képletű vegyület	165 %

Adagolás:

Flukonazol: minden esetben 8 x 50 mg/kg x nap per os

Béta-hidroxi-etil-amin: minden esetben 14 x 50 mg/kg x nap per os

Néhány példával /III. táblázat/ szemléltetjük a vegyületek gombaölő, antimikotikus aktivitását in vitro körülmények között, a *Trichophyton mentagrophytes* százalékos elpusztítása alapján. A szokásosan használt rilopirox készítményt alkalmaztuk összehasonlító vegyületként.

III. táblázat:

Vegyület	/ug/ml					
	80	40	20	10	5	2,5
/1/	100	100	99,8	99,4	98,7	80,8
/2/	100	100	100	100	98,7	92,3
/3/	100	100	99,8	98,9	74,9	52,7
/17/	100	100	100	99,8	87,1	73,4
/18/	100	100	100	100	95,7	79,3
Rilopirox	100	100	100	100	96,2	94,1

/A III. táblázat adatai a *Trichophyton mentagrophytes* desztillált vízben, 14 óra elteltével mért százalékos pusztulási értékeit mutatják./

Mintegy hat hetes szőlőcsemetéket egyenletesen benedvesítettünk a találmányunk szerint alkalmazott vegyületek vizes szuszpenzióival. Miután a növényeken megszáradt a felvitt permetbevonat *Plasmopara viticola* vizes spóraszuszpenziójával megfertőztük a növényeket és rövid ideig klimakamrában inkubáltuk őket 23°C-on, 80-90 %-os relatív légnedvesség mellett. Hét nap eltelte

után szemügyre vettük a már említett kamrákban levő, gombaspórákkal kezelt növényeket, és megállapítottuk a szőlőlevelek fertőzöttségének mértékét százalékban kifejezve, a kezeletlen, fertőzött kontroll-növényekre vonatkoztatva. Az eredményeket a IV. táblázatban közöljük.

IV. táblázat:

Az 1. példa szerinti vegyületek	A Plasmopara viticola-val fertőzött szőlőlevelek megtámadottságának százalékban kifejezett foka a hatóanyag megadott, ppm-ben /1 mg hatóanyag/1 liter vizes szuszpenzió/ kifejezett koncentrációja esetén		
	500	250	125
32	0	0	0
37	0	0	0
Kezeletlen, fertőzött kontroll-növények		100	

A IV. táblázatból kitűnik, hogy a találmányunk szerint alkalmazott vegyületekkel kezelt növényeket nem támadta meg a gombakártevő.

Szabadalmi igénypontok:

1. Eljárás hatóanyagként béta-hidroxi-etil-amin-származékokat tartalmazó gyógyszerkészítmények előállítására, a z z a l j e l l e m e z v e , h o g y olyan béta-hidroxi-etil-amin-származékokat, amelyeknek [III] általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport; fluoratómmal, klóráttal, bróm-atómmal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, metoxicssoporttal, fenil-oxi-csoporttal vagy fenilcsoporttal egyszeresen vagy többszörösen adott esetben helyettesített benzilcsoport; /1-8 szénatomos alkil/-karbonil-csoport egyenes vagy elágazó lánccal; illetve fenil-karbonil-csoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-18 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu /1-6 szénatomos alkil/-oxi-/1-6 szénatomos alkil/-csoport; egyenes vagy elágazó láncu /1-6 szénatomos alkil/-oxi-fenil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-18 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-12 szénatomos cikloalkilcsoport - például norbornilcsoport, adamantilcsoport vagy dekahidronaftilcsoport -, egyenes vagy elágazó, 1-6 szénatomos alkilcsoportban egy vagy két hidroxilcsoporttal adott esetben helyettesített fenil-alkil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen fenil-/2-6 szénatomos alkenil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6

- szénatomos alkil/-csoport; egy vagy több fluoratommal, klóratommal, brómatommal, 1-10 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkilcsoporttal, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoporttal, hidroxilcsoporttal, merkaptocsoporttal, 1-10 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkoxicssoporttal, 1-4 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkilén-dioxi-csoporttal, dimetil-amino-etoxi-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu /1-4 szénatomos alkoxi/-karbonil-metoxi-csoporttal, fenoxicssoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal, fenetilcsoporttal, tiofenilcsoporttal és/vagy C_nF_{2n+1} általános képletű csoporttal - n = 1 - 6 - adott esetben helyettesített fenilcsoport; egyenes vagy elágazó láncu indol-3-il-/1-4 szénatomos alkil/-csoport vagy fluoratommal, klóratommal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy egyenes, illetve elágazó láncu /1-4 szénatomos alkil/-oxi-csoporttal adott esetben helyettesített tienilcsoport, illetve tienil-metil-csoport;
- R/3/ jelentései az R/2/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/3/ és R/2/ mindenkori jelentése független egymástól és R/2/ az R/3/-mal egy olyan, $-/CH_2/m-$ általános képletű láncot képezhet, amelyben m jelentése 4-6 és amelyben az egyik metiléncsoportot oxigénatom, kénatom vagy hidrogénatomot, metilcsoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot vagy fenetilcsoportot hordozó nitrogénatom helyettesítheti;
- és
- A jelentése egyenes vagy elágazó láncu, 1-18 szénatomos

alkilcsoport; egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-18 szénatomos alkenilcsoport vagy [II] általános képletű csoport, amelyben

-- R/4/ jelenthet hidrogénatomot, egyenes vagy elágazó láncu, 1-18 szénatomos alkilcsoportot; egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-18 szénatomos alkenilcsoportot; monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal, C_nF_{2n+1} általános képletű csoporttal - $n=1-4$ -, fluoratommal, klóratommal, brómatommal ^{és} vagy hidroxilcsoporttal adott esetben egyszeresen vagy kétszeresen helyettesített, 3-20 szénatomos cikloalkilcsoportot; egyenes vagy elágazó láncu Y-/C₁-C₂₀-alkil/-csoportot; egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/C₂-C₁₈-alkenil/-csoportot; Y-/C₃-C₂₀-cikloalkil/-csoportot, amelyben a cikloalkilcsoport monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos lehet és adott esetben helyettesítve van egyszeresen vagy kétszeresen egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal, C_nF_{2n+1} általános képletű csoporttal - $n = 1-4$ -, fluoratommal, klóratommal, brómatommal ^{és} vagy hidroxilcsoporttal; fenilcsoportot, Y-fenil-csoport -

- tot; egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-4 szénatomos alkil/-csoportot; egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-4 szénatomos alkoxi/-csoportot, bifenililcsoportot, fluoratomot, klóratomot, brómatomot, C_nF_{2n+1} általános képletű csoportot - $n = 1-8$ -, triklór-metil-csoportot, YH csoportot, naftilcsoportot, cianocsoportot, nitrocsoportot; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom, kénatom, szulfinilcsoport vagy szulfinilcsoport, a fenilcsoportok pedig fluoratómmal, klóratómmal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxi csoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesítve lehetnek;
- R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól és abban az esetben, ha R/4/ és R/5/ a fenilgyűrűhöz két szomszédos helyzetben kapcsolódik, együttesen egy $/CH_2/p$ -láncot alkothat, ahol p értéke 3 vagy 4;
 - R/6/ jelenthet hidrogénatomot, egyenes vagy elágazó láncu, 1-15 szénatomos alkilcsoportot, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-15 szénatomos alkenilcsoportot, egyenes vagy elágazó láncu Y- C_1-C_{15} -alkil/-csoportot, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-15 szén-

atomos alkenilcsoportot, fenilcsoportot, Y-fenil-csoportot, benzilcsoportot, bifenililcsoportot, fluoratomot, klóratomot, brómatomot, jód-atomot, C_nF_{2n+1} általános képletű csoportot - $n = 1-8$ -, triklór-metil-csoportot, naftilcsoportot vagy YH általános képletű csoportot; az-
 zal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése a már meg-
 adott; és

- X jelentése oxigénatom vagy kénatom;

és/vagy [III] általános képletű béta-hidroxi-etil-amin-szárma-
 zékokat tartalmazó preparátumokat - ismert módon - gombás meg-
 betegedések megelőzésére és gombás betegségekben szenvedők ke-
 zelésére alkalmas gyógyszerkészítményekké dolgozunk fel.

2. Az 1. igénypont szerinti eljárás, a z z a l j e l l e-
 m e z v e , h o g y olyan vegyületeket dolgozunk fel - adott
 esetben preparátumok formájában -, amelyeknek [III] általános
 képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu,
 1-8 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu,
 egyszeresen vagy kétszeresen telítetlen, 3-8 szénatomos
 alkenilcsoport, fluoratómmal, klóráttal, trifluor-me-
 til-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénato-
 mos alkilcsoporttal és/vagy metoxicssoporttal egyszeresen
 vagy kétszeresen adott esetben helyettesített benzil-
 csoport vagy egyenes láncu, illetve elágazó láncu
 /1-6 szénatomos alkil/-karbonil-csoport;

- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-16 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu /1-6 szénatomos alkil/-oxi-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu /1-6 szénatomos alkil/-oxi-fenil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-16 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport fluoratómmal, klóráttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-2 szénatomos alkilén-dioxi-csoporttal, /1-4 szénatomos alkoxi/-karbonil-metoxi-csoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal, fenetilcsoporttal és/vagy tiofenilcsoporttal, adott esetben, egyszeresen vagy kétszeresen helyettesített fenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu indol-3-il-/1-4 szénatomos alkil/-csoport vagy klóráttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy egyenes láncu, illetve elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkil-oxi-csoporttal adott esetben helyettesített tienilcsoportot tartalmazó tienil-metil-csoport;
- R/3/ jelentései az R/2/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/3/ és R/2/ mindenkorai jelentése független egymástól és R/2/ az R/3/-mal $-\text{CH}_2/\text{m}$ - általános képletű láncot alkothat, amelyben

az egyik metilénecsoportot oxigénatom, kénatom vagy hidrogénatomot, metilcsoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot, illetve fenetilcsoportot hordozó nitrogénatom helyettesítheti; és

- A jelentése egyenes vagy elágazó láncu, 1-16 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-16 szénatomos alkenilcsoport vagy olyan, [II] általános képletű csoport, amelyben
 - R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-16 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-16 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, illetve egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal egyszeresen adott esetben helyettesített, 3-12 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó Y-/C₁-C₁₆-alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/C₃-C₁₆-alkenil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, illetve egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal egyszeresen adott esetben helyettesített Y-/C₃-C₁₂-cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, fenil-/C₁-C₂-alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó lán-

cu fenil-/C₁-C₄-alkoxi/-csoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, C_nF_{2n+1} általános képletű csoport - n = 1-4 -, triklór-metil-csoport, naftilcsoport, cianocsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom és a fenilcsoportok - adott esetben - helyettesítve vannak egyszeresen vagy kétszeresen fluoratómmal, klóratómmal, trifluor-metil-csoporttal, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal;

- R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól és abban az esetben, ha R/4/ és R/5/ a fenilgyűrűhöz két szomszédos helyzetben kapcsolódik, együttesen -/CH₂/_p-láncot alkothat, ahol p értéke 3 vagy 4;
- R/6/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-12 szénatomos alkenilcsoport, Y-/C₁-C₁₂-alkil/-csoport egyenes vagy elágazó láncú, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/C₃-C₁₂-alkenil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, brómatom, C_nF_{2n+1} általános képletű csoport - n = 1-4 -, triklór-metil-csoport vagy naftilcsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése

a már megadott; és

- X jelentése oxigénatom vagy kénatom.

3. Az 1. igénypont szerinti eljárás, a z z a l j e l l e m e z v e , h o g y olyan vegyületeket dolgozunk fel - adott esetben preparátumok formájában -, amelyeknek [III] általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom, /1-4 szénatomos alkil/-karbonil-csoport egyenes vagy elágazó láncsal, illetve benzilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, /1-6 szénatomos alkil/-oxi-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-12 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, trifluor-metil-csoporttal, fluoratómmal, klóráttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-2 szénatomos alkilén-dioxi-csoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal és/vagy fenetilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített fenilcsoport; egyenes vagy elágazó láncu indol-3-il-/1-4 szénatomos alkil/-csoport vagy klóráttal, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal a gyűrűn adott esetben helyettesített tienil-metil-csoport;

- R/3/ jelentése hidrogénatom; illetve R/2/ és R/3/ egy olyan, $-\text{CH}_2/\text{m}$ - általános képletű láncot alkothat, amelyben $m = 4-6$ és az egyik metilén-csoport helyettesítve lehet oxigénatommal, kénatommal vagy hidrogénatomot, metil-csoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot, illetve fenetilcsoportot hordozó nitrogénatommal;
- A jelentése egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-12 szénatomos alkenilcsoport vagy egy olyan csoport, amelynek [II] általános képletében
 - R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-16 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, helyettesítetlen, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-12 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu
 - Y-/1-12 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/3-12 szénatomos alkenil/-csoport, helyettesítetlen monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos Y-/3-12 szénatomos cikloalkil/-csoport; fenilcsoport, Y-fenil-csoport, fenil-/1-2 szénatomos alkil/-csoport, fenil-/1-4 szénatomos alkoxi/-csoport egyenes vagy elágazó láncuval, bifenilcsoport, fluoratom, klóratom, illetve naftilcsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom és a

fenilcsoportok fluoratómmal, klóráttal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes és/ vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesítve vannak;

- R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkorai jelentése független egymástól;
- R/6/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/3-10 szénatomos alkenil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, fluoratom, klóratom vagy trifluor-metil-csoport; és

- X jelentése oxigénatom.

4. Az 1. igénypont szerinti eljárás, a z z a l j e l l e - m e z v e , h o g y olyan vegyületeket dolgozunk fel - adott esetben preparátumok formájában -, amelyeknek [III] általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom, metil-karbonil-csoport vagy benzilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu,

1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, /1-3 szénatomos alkil/-oxi-/1-3 szénatomos alkil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, fenil-/1-4 szénatomos alkil/-csoport egyenes vagy elágazó láncsal, difenil-/1-4 szénatomos alkil/-csoport egyenes vagy elágazó láncsal, fluoratómmal, klóráttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-2 szénatomos alkilén-dioxi-csoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal és/vagy fenetilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített fenilcsoport; egyenes vagy elágazó láncu indol-3-il-/1-4 szénatomos alkil/-csoport, a tienilcsoporton klóráttal, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, illetve 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal adott esetben helyettesített tienil-metil-csoport;

- R/3/ jelentése hidrogénatom;
- A jelentése egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport vagy olyan csoport, amelynek [II] általános kép-
letében

-- R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, helyettesítetlen, monociklusos, biciklu-



szós vagy multiciklusos, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-12 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-12 szénatomos alkenilcsoport, helyettesítetlen, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos Y-/3-10 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, benzil-oxi-csoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom vagy trifluor-metil-csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom és a fenilcsoportok fluoratómmal, klóratómmal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesítve vannak;

- R/5/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy kétszeresen telítetlen, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-12 szénatomos alkil/-csoport, Y-/3-6 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, fluoratom, klóratom vagy trifluor-metil-csoport;
- R/6/ jelentése hidrogénatom; és

- X jelentése oxigénatom.

5. Az 1. igénypont szerinti eljárás, a z z a l j e l l e -
m e z v é , h o g y olyan, a [III] általános képletű vegyületek
szűkebb körét képviselő béta-hidroxi-etil-amin-származékokat dol-
gozunk fel - adott esetben preparátumok formájában -, amelyeknek
[I] általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu,
1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu,
egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénato-
mos alkenilcsoport, fluoratómmal, klóráttal, bróttal,
trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó
láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, metoxycsoporttal,
fenil-oxi-csoporttal és/vagy fenilcsoporttal egyszerere-
sen vagy többszörösen adott esetben helyettesített ben-
zilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu,
1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó lán-
cu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szén-
atomos alkenilcsoport, 3-10 szénatomos cikloalkilcso-
port, egyenes vagy elágazó láncu, fenil-/1-6 szénatomos
alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen
vagy kétszeresen telítetlen fenil-/2-6 szénatomos alke-
nil/-csoport, difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport
egyenes vagy elágazó lánccal, fluoratómmal, klóráttal,
bróttal, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoport-
tal, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoporttal, hidroxilcso-
porttal, merkaptocsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu,
1-10 szénatomos alkoxycsoporttal, fenilcsoporttal, ben-
zilcsoporttal, fenetilcsoporttal, tiofenilcsoporttal

- és/vagy $C_n F_{2n+1}$ általános képletű csoporttal - $n = 1-6$ - egyszeresen vagy többszörösen adott esetben helyettesített fenilcsoport;
- R/3/ jelentései az R/2/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/3/ és R/2/ mindenkori jelentése független egymástól, továbbá R/2/ és R/3/ egy $-/CH_2/m-$ általános képletű láncot képezhet, amelyben $m = 4-6$ és az egyik metilencsoport helyettesítve lehet oxigénatommal, kénatommal vagy hidrogénatomot, metilcsoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot, illetve fenetilcsoportot hordozó nitrogénatommal;
 - R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-15 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-15 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal, $C_n F_{2n+1}$ általános képletű csoporttal - $n = 1-4$ -, fluoratómmal, klóráttal, brómatómmal és/vagy hidroxilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített, 3-20 szénatomos cikloalkilcsoport - így például norbornilcsoport, adamantilcsoport vagy dekahidronaftilcsoport -; egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-15 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/2-15 szénatomos alkenil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal, $C_n F_{2n+1}$ általános

- képletű csoporttal - $n = 1-4$ -, fluoratómmal, klóratómmal, brómatómmal és/vagy hidroxilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített, 3-20 szénatomos Y-/3-20 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, fenil-/1-2 szénatomos alkil/-csoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, brómatom, jódatom, C_nF_{2n+1} általános képletű csoport - $n = 1-8$ -, triklór-metil-csoport, YH általános képletű csoport, naftilcsoport, cianocsoport, nitrocsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;
- R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól, továbbá abban az esetben, ha R/4/ és R/5/ a fenilgyűrűhöz egymással szomszédos helyzetekben kapcsolódik, együttesen $-/CH_2/p-$ általános képletű láncot alkothat, ahol p értéke 3 vagy 4;
 - R/6/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-15 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-15 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/2-15 szénatomos alkenil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, brómatom, jódatom, C_nF_{2n+1} általános képletű csoport - $n = 1-8$ -, triklór-metil-csoport, naftilcsoport vagy YH általános képletű csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;

- X jelentése oxigénatom, kénatom, szulfinilcsoport vagy szulfonilcsoport.

6. Az 5. igénypont szerinti eljárás, a z z a l j e l l e - m e z v e , h o g y olyan béta-hidroxi-etil-amin-származékokat dolgozunk fel - adott esetben preparátumok formájában -, amelyeknek [I] általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, fluoratómmal, klóráttal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy metoxycsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített benzilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, hidroxilcsoporttal, fluoratómmal, klóráttal, bróráttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxycsoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal és/vagy fenetilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített fenilcsoport;



képletű csoport - $n = 1-4$ -, triklór-metil-csoport, naftilcsoport vagy cianocsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;

- R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól, továbbá abban az esetben, ha R/4/ és R/5/ a fenilgyűrűhöz egymással szomszédos helyzetekben kapcsolódik, együttesen egy $-\text{CH}_2/\text{p}$ általános képletű láncot alkothat, ahol p értéke 3 vagy 4;
- R/6/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-10 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy kétszeresen telítetlen Y-/2-10 szénatomos alkenil/-csoport, fenilcsoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, brómatom, $\text{C}_n\text{F}_{2n+1}$ általános képletű csoport - $n = 1-4$ -, triklór-metil-csoport vagy naftilcsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;
- X jelentése oxigénatom vagy kénatom.

7. Az 5. igénypont szerinti eljárás, a z z a l j e l l e - m e z v e , h o g y o l y a n b é t a - h i d r o x i - e t i l - a m i n - s z á r m a z é k o k a t d o l g o z u n k f e l - a d o t t e s e t b e n p r e p a r á t u m o k f o r m á j á b a n -, a m e l y e k n e k [I] általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, fluoratommal, klóratommal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy metoxicssoporttal

egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített benzilcsoport;

- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy kétszeresen telitetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, hidroxilcsoporttal, fluoratómmal, klóráttal, bróttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxilcsoporttal, fenilcsoporttal és/vagy benzilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített fenilcsoport,
- R/3/ jelentése hidrogénatom vagy R/2/ és R/3/ együttesen egy $-\text{CH}_2/\text{m}-$ általános képletű láncot alkot $- m = 4-5 -$, amelyben egy metilcsoport helyettesítve lehet egy oxigénatommal vagy hidrogénatomot, metilcsoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot vagy fenetilcsoportot hordozó nitrogénatommal;
- R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telitetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-15 szénatomos cikloalkilcsoport - például norbornilcsoport, adamantilcsoport vagy dekahidronaftilcsoport -, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-10 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telitetlen Y-/2-10 szénatomos alkenil/-

- csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos Y-/3-15 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, C_nF_{2n+1} általános képletű csoport - $n = 1-4$ -, naftilcsoport vagy cianocsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;
- R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól;
- R/6/ jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkilcsoport, Y-/1-4 szénatomos alkil/-csoport egyenes vagy elágazó lánccal, fluoratom, klóratom vagy trifluor-metil-csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;
- X jelentése oxigénatom.

8. Az 5. igénypont szerinti eljárás, a z z a l j e l l e m e z v e , h o g y olyan béta-hidroxi-etil-amin-származékokat dolgozunk fel - adott esetben preparátumok formájában -, amelyeknek [I] általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom vagy benzilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, továbbá olyan, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-4 szénatomos alkil/-csoport, amely magban - adott esetben - egyszeresen szubsztituált lehet fluoratommal, klóratommal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal;

- R/3/ jelentése hidrogénatom;
 - R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-15 szénatomos cikloalkilcsoport - például norbornil, adamantil vagy dekahidronaftilcsoport -, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-10 szénatomos alkil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos Y-/3-15 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom vagy C_nF_{2n+1} általános képletű csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy $n = 1-4$ és Y jelentése kénatom;
 - R/5/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-6 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, Y-/3-6 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, fluoratom, klóratom vagy trifluor-metil-csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom;
 - R/6/ jelentése hidrogénatom;
 - X jelentése oxigénatom.
9. Eljárás hatóanyagként béta-hidroxi-etil-amin-származékokat tartalmazó, gombás megbetegedések megelőzésére alkalmas gyógyszerkészítmények előállítására, a z z a l

j e l l e m e z v e , h o g y az 1. igénypontban definiált, [III] általános képletű vegyületeket - ismert módon - profilaktikus gyógyszerkészítményekké dolgozzuk fel.

10. Eljárás hatóanyagként béta-hidroxi-etil-amin-származékokat tartalmazó, gombás megbetegedések megelőzésére alkalmas gyógyszerkészítmények előállítására, a z z a l j e l l e m e z v e , h o g y az 5. igénypontban definiált, [I] általános képletű vegyületeket - ismert módon - profilaktikus gyógyszerkészítményekké dolgozzuk fel.

11. Eljárás hatóanyagként béta-hidroxi-etil-amin-származékokat tartalmazó gombaellenes és/vagy növekedésszabályozó agrokemikáliák előállítására, a z z a l j e l l e m e z v e , h o g y olyan béta-hidroxi-etil-amin-származékokat, amelyeknek [III] általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport; fluoratómmal, klóráttal, brómatómmal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, metoxicssoporttal, fenil-oxi-csoporttal vagy fenilcsoporttal egyszeresen vagy többszörösen adott esetben helyettesített benzilcsoport; /1-8 szénatomos alkil/-karbonil-csoport egyenes vagy elágazó lánccal; illetve fenil-karbonil-csoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-18 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu

/1-6 szénatomos alkil/-oxi-/1-6 szénatomos alkil/-csoport; egyenes vagy elágazó láncu /1-6 szénatomos alkil/-oxi/-fenil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-18 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-12 szénatomos cikloalkilcsoport - például norbornilcsoport, adamantilcsoport vagy dekahidronaftilcsoport -, egyenes vagy elágazó, 1-6 szénatomos alkilcsoportban egy vagy két hidroxilcsoporttal adott esetben helyettesített fenil-alkil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen fenil-/2-6 szénatomos alkenil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport; egy vagy több fluoratómmal, klóráttal, bróttal, 1-10 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkilcsoporttal, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoporttal, hidroxilcsoporttal, merkaptocsoporttal, 1-10 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkoxycsoporttal, 1-4 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkilén-dioxi-csoporttal, dimetil-amino-etoxi-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu /1-4 szénatomos alkoxi/-karbonil-metoxi-csoporttal, fenoxycsoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal, fenetilcsoporttal, tiofenilcsoporttal és/vagy C_nF_{2n+1} általános képletű csoporttal - $n = 1 - 6$ - adott esetben helyettesített fenilcsoport; egyenes vagy elágazó láncu indol-3-yl-/1-4 szénatomos alkil/-csoport vagy fluoratómmal, klóráttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy

egyenes, illetve elágazó láncu /1-4 szénatomos alkil/-
-oxi-csoporttal adott esetben helyettesített tienilcso-
port, illetve tienil-metil-csoport;

- R/3/ jelentései az R/2/-nél megadottak; azzal a megjegy-
zéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/3/ és R/2/
mindenkori jelentése független egymástól és R/2/ az
R/3/-mal egy olyan, $-\text{CH}_2/\text{m}$ - általános képletű láncot
képezhet, amelyben m jelentése 4-6 és amelyben az egyik
metilcsoportot oxigénatom, kénatom vagy hidrogénatomot,
metilcsoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot vagy
fenetilcsoportot hordozó nitrogénatom helyettesítheti;
és

- A jelentése egyenes vagy elágazó láncu, 1-18 szénatomos
alkilcsoport; egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen
vagy többszörösen telítetlen, 2-18 szénatomos alkenilcso-
port vagy [II] általános képletű csoport, amelyben

- R/4/ jelenthet hidrogénatomot, egyenes vagy el-
ágazó láncu, 1-18 szénatomos alkilcsoportot;
egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy
többszörösen telítetlen, 2-18 szénatomos alkenil-
csoportot; monociklusos, biciklusos vagy multi-
ciklusos, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szén-
atomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó
láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal, $\text{C}_n\text{F}_{2n+1}$
általános képletű csoporttal - $n=1-4$ -, fluor-
atommal, klóratommal, brómatommal ^{és} vagy hidroxil-

csoporttal adott esetben egyszeresen vagy kétszeresen helyettesített, 3-20 szénatomos cikloalkilcsoportot; egyenes vagy elágazó láncu Y-/C₁-C₂₀-alkil/-csoportot; egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/C₂-C₁₈-alkenil/-csoportot; Y-/C₃-C₂₀-cikloalkil/-csoportot, amelyben a cikloalkilcsoport monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos lehet és adott esetben helyettesítve van egyszeresen vagy kétszeresen egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal, C_nF_{2n+1} általános képletű csoporttal - n = 1-4 -, fluoratómmal, klóráttal, brómatómmal és/vagy hidroxilcsoporttal; fenilcsoportot, Y-fenil-csoportot; egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-4 szénatomos alkil/-csoportot; egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-4 szénatomos alkoxi/-csoportot, bifenililcsoportot, fluoratómot, klóráttal, brómatómot, C_nF_{2n+1} általános képletű csoportot - n = 1-8 -, triklór-metil-csoportot, YH csoportot, naftilcsoportot, cianocsoportot, nitrocsoportot; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom, kénatom, szulfinilcsoport vagy szulfinilcsoport, a fenilcsoportok pedig fluoratómmal, klóráttal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal

és/vagy egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxi csoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesítve lehetnek;

- R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól és abban az esetben, ha R/4/ és R/5/ a fenilgyűrűhöz két szomszédos helyzetben kapcsolódik, együttesen egy $/CH_2/p$ -láncot alkothat, ahol p értéke 3 vagy 4;
- R/6/ jelenthet hidrogénatomot, egyenes vagy elágazó láncu, 1-15 szénatomos alkilcsoportot, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-15 szénatomos alkenilcsoportot, egyenes vagy elágazó láncu Y- C_1-C_{15} -alkil/-csoportot, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-15 szénatomos alkenilcsoportot, fenilcsoportot, Y-fenil-csoportot, benzilcsoportot, bifenililcsoportot, fluoratomot, klóratomot, brómatomot, jódatomot, C_nF_{2n+1} általános képletű csoportot - $n = 1-8$ -, triklór-metil-csoportot, naftilcsoportot vagy YH általános képletű csoportot; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése a már megadott; és

- X jelentése oxigénatom vagy kénatom,

ismert módon feldolgozzuk gombaellenes és/vagy növekedésszabályozó készítményekké.

12. A 11. igénypont szerinti eljárás, a z z a l j e l -
l e m e z v e , h o g y olyan béta-hidroxi-etil-amin-származé-
kokat dolgozunk fel, amelyeknek [III] általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu,
1-8 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu,
egyszeresen vagy kétszeresen telítetlen, 3-8 szénatomos
alkenilcsoport, fluoratómmal, klóráttal, trifluor-me-
til-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénato-
mos alkilcsoporttal és/vagy metoxicssoporttal egyszeresen
vagy kétszeresen adott esetben helyettesített benzil-
csoport vagy egyenes láncu, illetve elágazó láncu
/1-6 szénatomos alkil/-karbonil-csoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu,
1-16 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu
/1-6 szénatomos alkil/-oxi-/1-6 szénatomos alkil/-cso-
port, egyenes vagy elágazó láncu /1-6 szénatomos alkil/-
-oxi-fenil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egysze-
resen vagy többszörösen telítetlen, 2-16 szénatomos al-
kenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklu-
sos, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy el-
ágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egye-
nes vagy elágazó láncu difenil-/1-6 szénatomos alkil/-cso-
port fluoratómmal, klóráttal, egyenes vagy elágazó lán-
cu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, 3-8 szénatomos ciklo-
alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénato-
mos alkoxicssoporttal, 1-2 szénatomos alkilén-dioxi-cso-
porttal, /1-4 szénatomos alkoxi/-karbonil-metoxi-csoport-

- tal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal, fenetilcsoporttal és/vagy tiofenilcsoporttal, adott esetben, egyszeresen vagy kétszeresen helyettesített fenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu indol-3-il-/1-4 szénatomos alkil/-csoport vagy klóratommal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy egyenes láncu, illetve elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkil-oxi-csoporttal adott esetben helyettesített tienilcsoportot tartalmazó tienil-metil-csoport;
- R/3/ jelentései az R/2/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/3/ és R/2/ mindenkori jelentése független egymástól és R/2/ az R/3/-mal $-\text{CH}_2/\text{m}$ - általános képletű láncot alkothat, amelyben az egyik metilén-csoportot oxigénatom, kénatom vagy hidrogénatomot, metilcsoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot, illetve fenetilcsoportot hordozó nitrogénatom helyettesítheti; és
 - A jelentése egyenes vagy elágazó láncu, 1-16 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-16 szénatomos alkenilcsoport vagy olyan, [II] általános képletű csoport, amelyben
 - R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-16 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-16 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoport-

tal, illetve egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal egyszeresen adott esetben helyettesített, 3-12 szénatomos cikloalkil-csoport, egyenes vagy elágazó Y-/C₁-C₁₆-alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/C₃-C₁₆-alkenil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, illetve egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal egyszeresen adott esetben helyettesített Y-/C₃-C₁₂-cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, fenil-/C₁-C₂-alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/C₁-C₄-alkoxi/-csoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, C_nF_{2n+1} általános képletű csoport - n = 1-4 -, triklór-metil-csoport, nafilcsoport, cianocsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom és a fenilcsoportok - adott esetben - helyettesítve vannak egyszeresen vagy kétszeresen fluoratommal, klóratommal, trifluor-metil-csoporttal, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal;

-- R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól és abban az esetben, ha R/4/ és R/5/

a fenilgyűrűhöz két szomszédos helyzetben kapcsolódik, együttesen $-\text{CH}_2/\text{p}$ -láncot alkothat, ahol p értéke 3 vagy 4;

-- R/6/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-12 szénatomos alkenilcsoport, Y- $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ -alkil/-csoport egyenes vagy elágazó láncu, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y- $\text{C}_3\text{-C}_{12}$ -alkenil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, brómatom, $\text{C}_n\text{F}_{2n+1}$ általános képletű csoport - n = 1-4 -, triklór-metil-csoport vagy naftilcsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése a már megadott; és

- X jelentése oxigénatom vagy kénatom.

13. A 11. igénypont szerinti eljárás, a z z a l j e l - l e m e z v e , h o g y olyan béta-hidroxi-etil-amin-származékokat dolgozunk fel, amelyeknek [III] általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom, /1-4 szénatomos alkil/-karbonil-csoport egyenes vagy elágazó láncu, illetve benzilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, /1-6 szénatomos alkil/-oxi-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó



- láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-12 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, trifluor-metil-csoporttal, fluoratómmal, klóráttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-2 szénatomos alkilén-dioxi-csoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal és/vagy fenetilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített fenilcsoport; egyenes vagy elágazó láncu indol-3-il-/1-4 szénatomos alkil/-csoport vagy klóráttal, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal a gyűrűn adott esetben helyettesített tienil-metil-csoport;
- R/3/ jelentése hidrogénatom; illetve R/2/ és R/3/ egy olyan, $-\text{CH}_2/\text{m}-$ általános képletű láncot alkot, amelyben $m = 4-6$ és az egyik metilén-csoport helyettesítve lehet oxigénatómmal, kénatómmal vagy hidrogénatomot, metilcsoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot, illetve fenetilcsoportot hordozó nitrogénatómmal;
 - A jelentése egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-12 szénatomos alkenilcsoport vagy egy olyan csoport, amelynek [II] általános képletében
 - R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-16 szénatomos alkilcsoport,

egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, helyettesítetlen, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-12 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu
 Y-/1-12 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/3-12 szénatomos alkenil/-csoport, helyettesítetlen monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos Y-/3-12 szénatomos cikloalkil/-csoport; fenilcsoport, Y-fenil-csoport, fenil-/1-2 szénatomos alkil/-csoport, fenil-/1-4 szénatomos alkoxi/-csoport egyenes vagy elágazó lánccal, bifenilcsoport, fluoratom, klóratom, illetve naftilcsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom és a fenilcsoportok fluoratómmal, klóratómmal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes és/vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesítve vannak;

- R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól;
- R/6/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen

telítetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/3-10 szénatomos alkenil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, fluoratom, klóratom vagy trifluor-metilcsoport; és

- X jelentése oxigénatom.

14. A 11. igénypont szerinti eljárás, a z z a l j e l l e m e z v e , h o g y olyan béta-hidroxi-etil-amin-származékokat dolgozunk fel, amelyeknek [III] általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom, metil-karbonil-csoport vagy benzilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, /1-3 szénatomos alkil/-oxi-/1-3 szénatomos alkil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, fenil-/1-4 szénatomos alkil/-csoport egyenes vagy elágazó láncu, difenil-/1-4 szénatomos alkil/-csoport egyenes vagy elágazó láncu, fluoratommal, klóratommal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-2 szénatomos alkilén-dioxi-csoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal és/vagy fenetilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített fenilcso-

port; egyenes vagy elágazó láncu indol-3-il-/1-4 szénatomos alkil/-csoport, a tienilcsoporton klóratommal, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, illetve 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal adott esetben helyettesített tienil-metil-csoport;

- R/3/ jelentése hidrogénatom;

- A jelentése egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport vagy olyan csoport, amelynek [II] általános képletében

-- R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, helyettesítetlen, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-12 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-12 szénatomos alkenilcsoport, helyettesítetlen, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos Y-/3-10 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, benzil-oxi-csoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom vagy trifluorometil-csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy

Y jelentése oxigénatom és a fenilcsoportok fluoratómmal, klóráttal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesítve vannak;

-- R/5/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-12 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy kétszeresen telítetlen, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-12 szénatomos alkil/-csoport, Y-/3-6 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, fluoratom, klóratom vagy trifluor-metil-csoport;

-- R/6/ jelentése hidrogénatom; és

- X jelentése oxigénatom.

15. Eljárás hatóanyagként béta-hidroxi-etil-amin-származékokat tartalmazó gombaellenes és/vagy növekedésszabályozó agrokemikáliák előállítására, a z z a l j e l l e m e z v e , h o g y a [III] általános képletű vegyületek szűkebb körét reprezentáló [I] általános képletű béta-hidroxi-etil-amin-származékokat - a [I] általános képletben

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu,

egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport, fluoratómmal, klóráttal, bróttal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, metoxycsoporttal, fenil-oxi-csoporttal és/vagy fenilcsoporttal egyszeresen vagy többszörösen adott esetben helyettesített benzilcsoport;

- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport, 3-10 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy kétszeresen telítetlen fenil-/2-6 szénatomos alkenil/-csoport, difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport egyenes vagy elágazó lánccal, fluoratómmal, klóráttal, bróttal, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoporttal, hidroxilcsoporttal, merkaptocsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkoxycsoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal, fenetilcsoporttal, tiofenilcsoporttal és/vagy C_nF_{2n+1} általános képletű csoporttal - $n = 1-6$ - egyszeresen vagy többszörösen adott esetben helyettesített fenilcsoport;

- R/3/ jelentései az R/2/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/3/ és R/2/ mindenkorai jelentése független egymástól, továbbá R/2/ és R/3/ egy $-/CH_2/m-$ általános képletű láncot képezhet,

amelyben $m = 4-6$ és az egyik metilénecsoport helyettesítve lehet oxigénatommal, kénatommal vagy hidrogénatomot, metilcsoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot, illetve fenetilcsoportot hordozó nitrogénatommal;

- R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-15 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-15 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal, C_nF_{2n+1} általános képletű csoporttal - $n = 1-4$ -, fluoratommal, klóratommal, brómatommal és/vagy hidroxilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített, 3-20 szénatomos cikloalkilcsoport - így például norbornilcsoport, adamantilcsoport vagy dekahidronaftilcsoport -; egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-15 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/2-15 szénatomos alkenil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes láncu, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal, C_nF_{2n+1} általános képletű csoporttal - $n = 1-4$ -, fluoratommal, klóratommal, brómatommal és/vagy hidroxilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített, 3-20 szénatomos Y-/3-20 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, fenil-/1-2 szénatomos alkil/-csoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, brómatom, jódatom, C_nF_{2n+1} általános képletű csoport - $n = 1-8$ -, triklór-metil-csoport, YH általános képletű csoport, naf-

tilcsoport, cianocsoport, nitrocsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;

- R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól, továbbá abban az esetben, ha R/4/ és R/5/ a fenilgyűrűhöz egymással szomszédos helyzetekben kapcsolódik, együttesen $-\text{CH}_2/\text{p}-$ általános képletű láncot alkothat, ahol p értéke 3 vagy 4;
- R/6/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-15 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-15 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/2-15 szénatomos alkenil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, brómatom, jódatom, $\text{C}_n\text{F}_{2n+1}$ általános képletű csoport - $n = 1-8$ -, triklór-metil-csoport, naftilcsoport vagy YH általános képletű csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;
- X jelentése oxigénatom, kénatom, szulfinilcsoport vagy szulfonilcsoport -

ismert módon feldolgozzuk gombaellenes és/vagy növekedésszabályozó készítményekké.

16. A 15. igénypont szerinti eljárás, a z z a l j e l l e m e z v e , h o g y olyan béta-hidroxi-etil-amin-származékokat dolgozunk fel, amelyeknek [I] általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, fluoratómmal, klóráttal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy metoxicssoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített benzilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, hidroxilcsoporttal, fluoratómmal, klóráttal, bróráttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal, fenilcsoporttal, benzilcsoporttal és/vagy fenetilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített fenilcsoport;
- R/3/ jelentései az R/2/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/3/ és R/2/ mindenkorai jelentése független egymástól, továbbá R/2/ és R/3/ együttesen egy $-/CH_2/m-$ általános képletű láncot képezhet, amelyben m jelentése 4-6 és az egyik metilén-csoport helyettesítve lehet oxigénatómmal vagy hidrogénatómmal, metilcsoporttal, fenilcsoporttal, benzil-

- csoportot vagy fenetilcsoportot hordozó nitrogénatommal;
- R/4/ jelentése hidrogénatom, 1-15 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkilcsoport, 2-15 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal egyszeresen adott esetben helyettesített, 3-15 szénatomos cikloalkilcsoport - például norbornilcsoport, adamantilcsoport, dekahidronaftilcsoport -, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/2-10 szénatomos alkenil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal egyszeresen adott esetben helyettesített Y-/3-15 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, fenil-/1-2 szénatomos alkil/-csoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, $C_n F_{2n+1}$ általános képletű csoport - $n = 1-4$ -, triklór-metil-csoport, nafilcsoport vagy cianocsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;
 - R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól, továbbá abban az esetben, ha R/4/ és R/5/ a fenilgyűrűhöz egymással szomszédos helyzetekben kapcsolódik, együttesen egy $-/CH_2/p-$ általános képletű láncot alkothat, ahol p értéke

3 vagy 4;

- R/6/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-10 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy kétszeresen telitetlen Y-/2-10 szénatomos alkenil/-csoport, fenilcsoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, brómatom, C_nF_{2n+1} általános képletű csoport - $n = 1-4$ -, triklór-metil-csoport vagy naftilcsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;
- X jelentése oxigénatom vagy kénatom.

17. A 15. igénypont szerinti eljárás, a z z a l j e l l e - m e z v e , h o g y olyan béta-hidroxi-etil-amin-származékokat dolgozunk fel, amelyeknek [I] általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, fluoratommal, klóratommal, trifluor-metil-csoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy metoxicssoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített benzilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy kétszeresen telitetlen, 3-10 szénatomos alkenilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu difenil-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, hidroxilcsoporttal,

- fluoratómmal, klóráttal, bróráttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxycsoporttal, fenilcsoporttal és/vagy benzilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen adott esetben helyettesített fenilcsoport,
- R/3/ jelentése hidrogénatom vagy R/2/ és R/3/ együttesen egy $-\text{CH}_2/\text{m}$ - általános képletű láncot alkot $m = 4-5$ -, amelyben egy metilcsoport helyettesítve lehet egy oxigénatómmal vagy hidrogénatómot, metilcsoportot, fenilcsoportot, benzilcsoportot vagy fenetilcsoportot hordozó nitrogénatómmal;
 - R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-15 szénatomos cikloalkilcsoport - például norbornilcsoport, adamantilcsoport vagy dekahidronaftilcsoport -, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-10 szénatomos alkil/-csoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen Y-/2-10 szénatomos alkenil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos Y-/3-15 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom, $\text{C}_n\text{F}_{2n+1}$ általános képletű csoport - $n = 1-4$ -, naftilcsoport vagy cianocsoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;
 - R/5/ jelentései az R/4/-nél megadottak; azzal a megjegyzéssel, hogy az azonos jelentéskörön belül R/5/ és R/4/ mindenkori jelentése független egymástól;

- R/6/ jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos, egyenes vagy elágazó láncu alkilcsoport, Y-/1-4 szénatomos alkil/-csoport egyenes vagy elágazó láncu fluoratom, klóratom vagy trifluor-metil-csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom vagy kénatom;
- X jelentése oxigénatom.

18. A 15. igénypont szerinti eljárás, a z z a l j e l l e - m e z v e , h o g y olyan béta-hidroxi-etil-amin-származékokat dolgozunk fel, amelyeknek [I] általános képletében

- R/1/ jelentése hidrogénatom vagy benzilcsoport;
- R/2/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-8 szénatomos alkilcsoport, továbbá olyan, egyenes vagy elágazó láncu fenil-/1-4 szénatomos alkil/-csoport, amely magban - adott esetben - egyszeresen szubsztituált lehet fluoratommal, klóratommal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, egyenes vagy elágazó láncu, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal;
- R/3/ jelentése hidrogénatom;
- R/4/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-10 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-10 szénatomos alkenilcsoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos, 3-15 szénatomos cikloalkilcsoport - például norbornil, adamantil vagy dekahidronaftilcsoport -, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-10 szénatomos alkil/-csoport, monociklusos, biciklusos vagy multiciklusos

Y-/3-15 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, bifenililcsoport, fluoratom, klóratom vagy C_nF_{2n+1} általános képletű csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy $n = 1-4$ és Y jelentése kénatom:

- R/5/ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncu, 1-6 szénatomos alkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu, egyszeresen vagy többszörösen telítetlen, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, egyenes vagy elágazó láncu Y-/1-6 szénatomos alkil/-csoport, Y-/3-6 szénatomos cikloalkil/-csoport, fenilcsoport, Y-fenil-csoport, benzilcsoport, fluoratom, klóratom vagy trifluor-metil-csoport; azzal a megjegyzéssel, hogy Y jelentése oxigénatom;
- R/6/ jelentése hidrogénatom;
- X jelentése oxigénatom.

A meghatalmazott:

28. sz. ügyvéd munkaközösség
ADVOPATENT SZABADALMI IRODA
KARÁCSONYI BÉLA
szabadalmi ügyvéd
Postacím: 1051 Bp. Pf. 11.

25 lap rajz
de Courboursé!

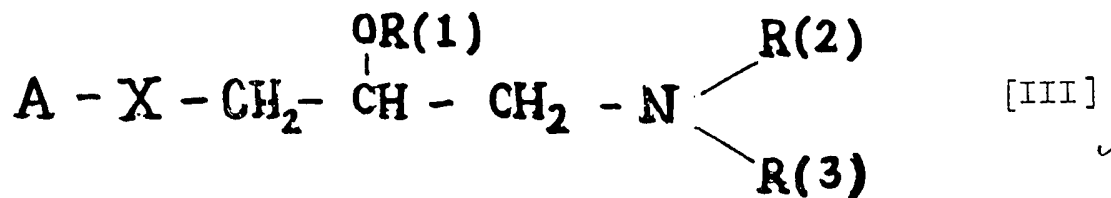
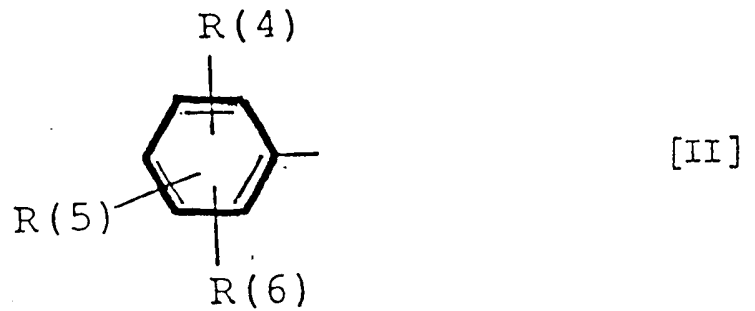
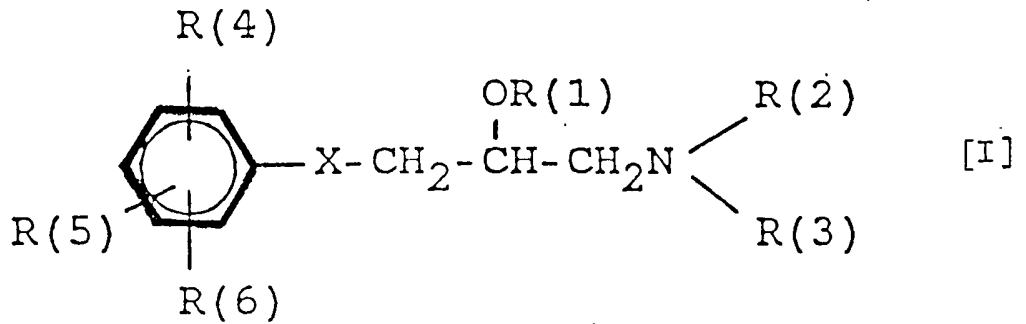
1750/91

10210

25/1

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

61660

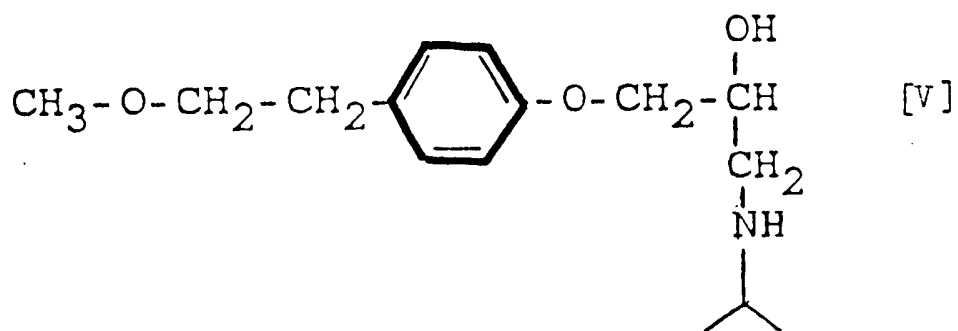
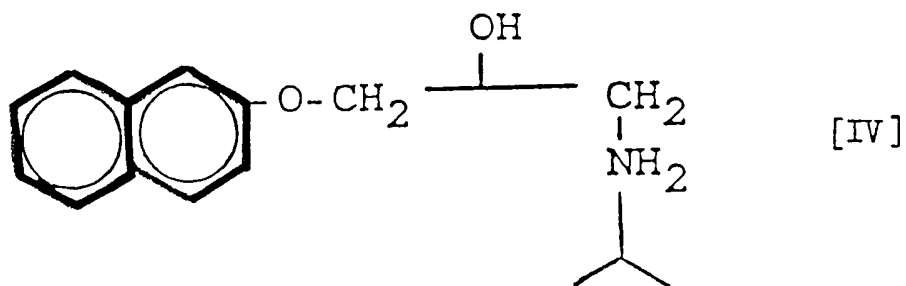


1750/91

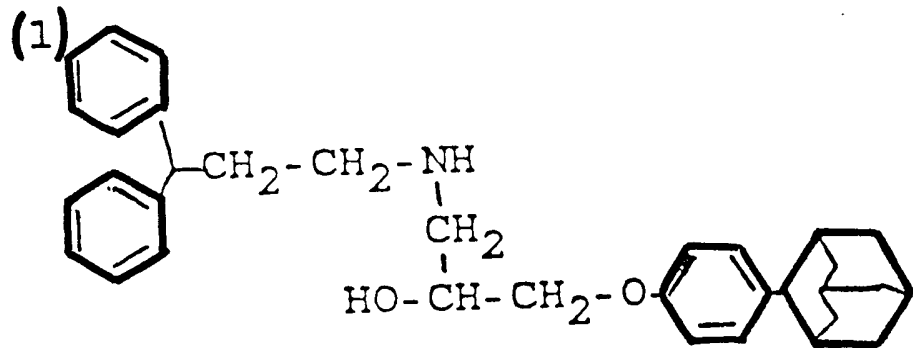
18318

25/2

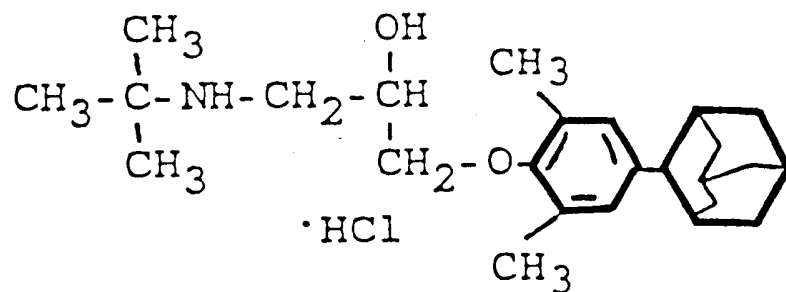
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



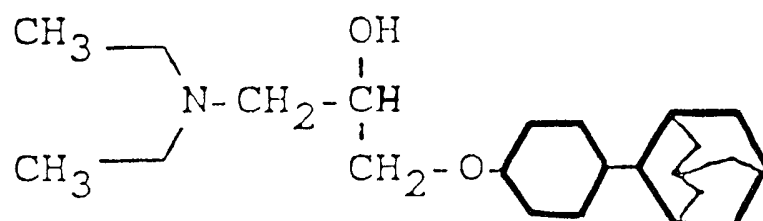
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



(2)

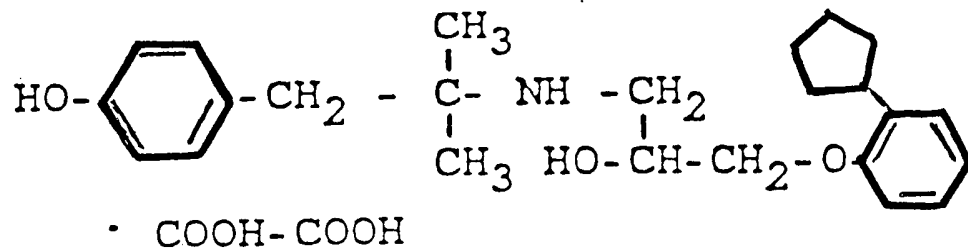


(3)

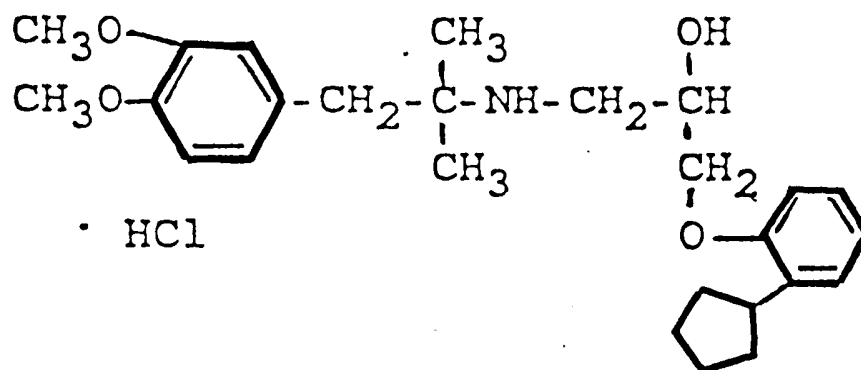


KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

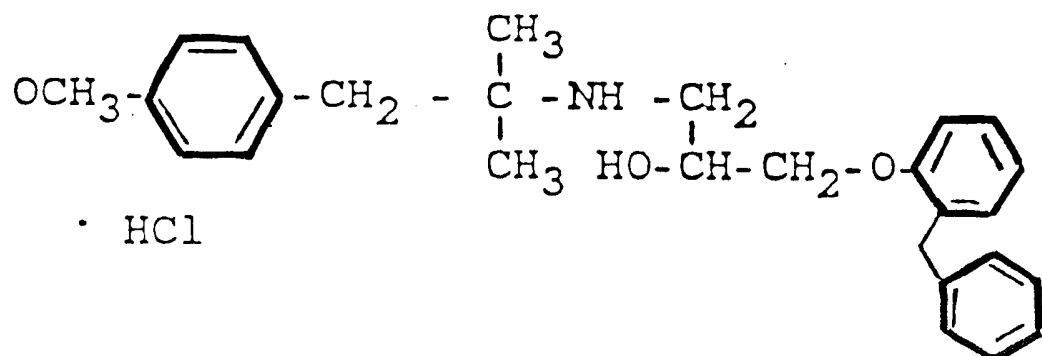
(4)



(5)

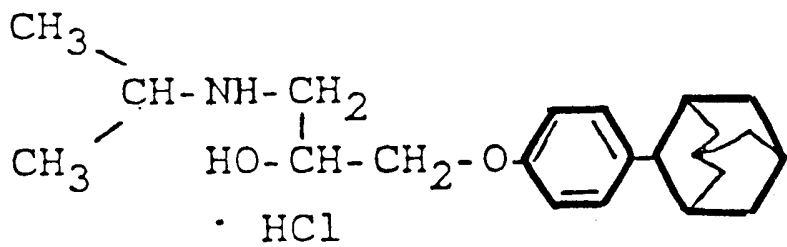


(6)

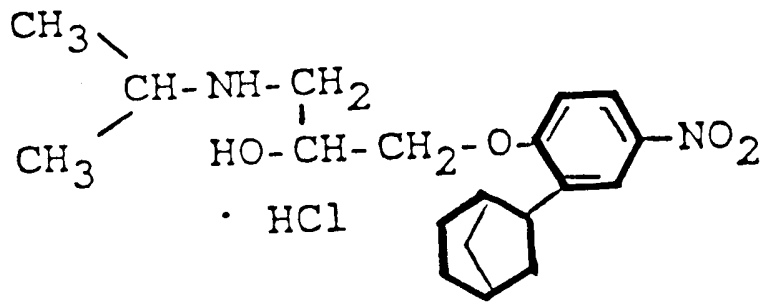


KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

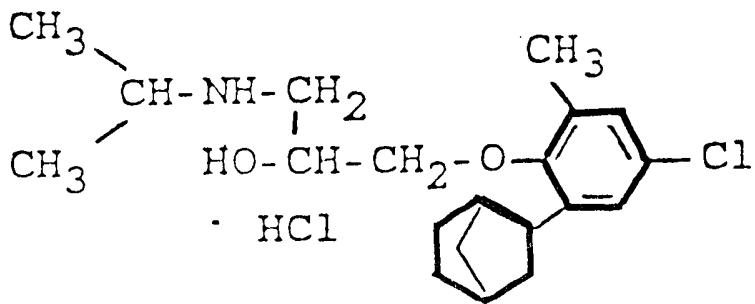
(7)



(8)

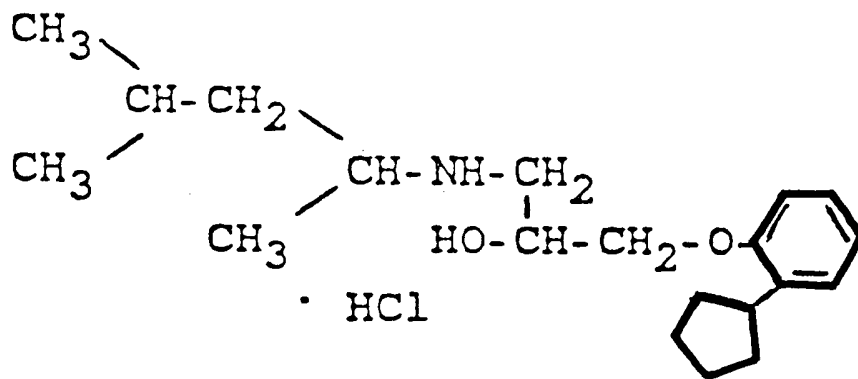


(9)

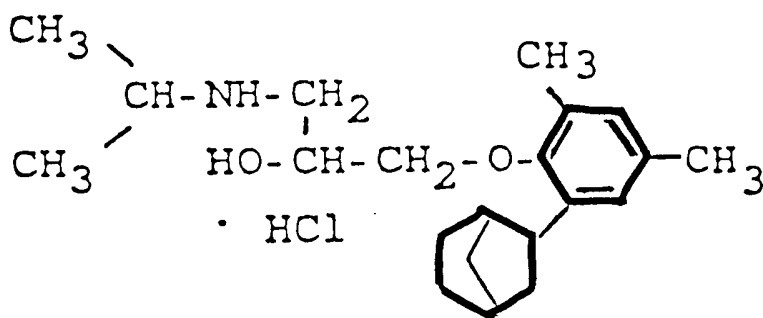


KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

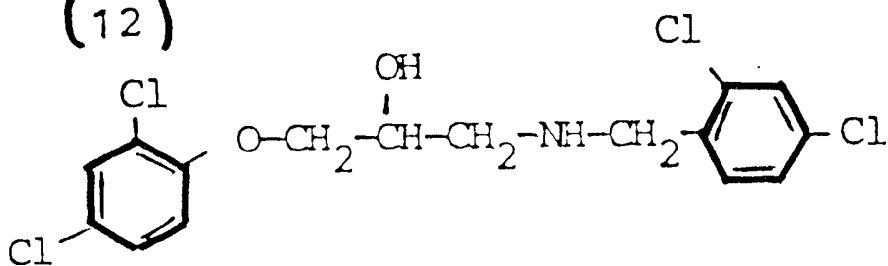
(10)



(11)

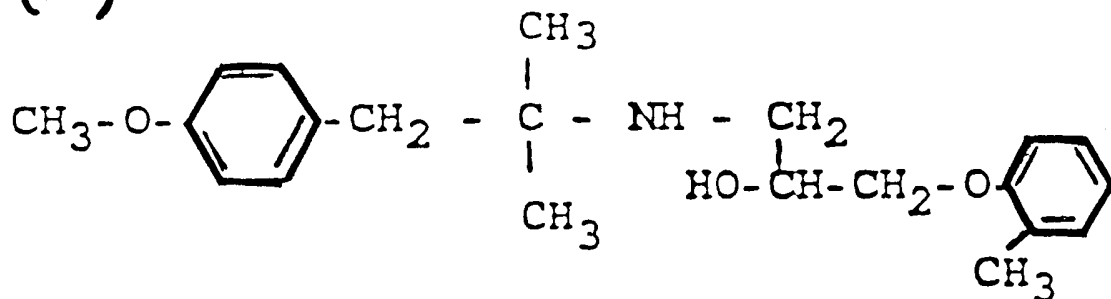


(12)

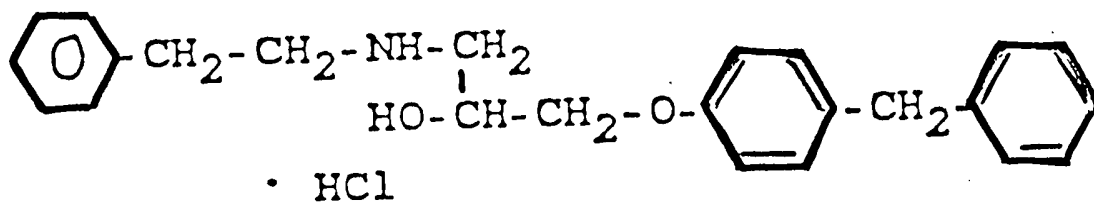


KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

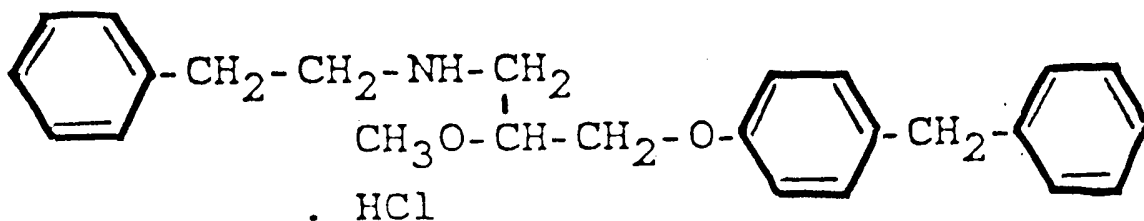
(13)



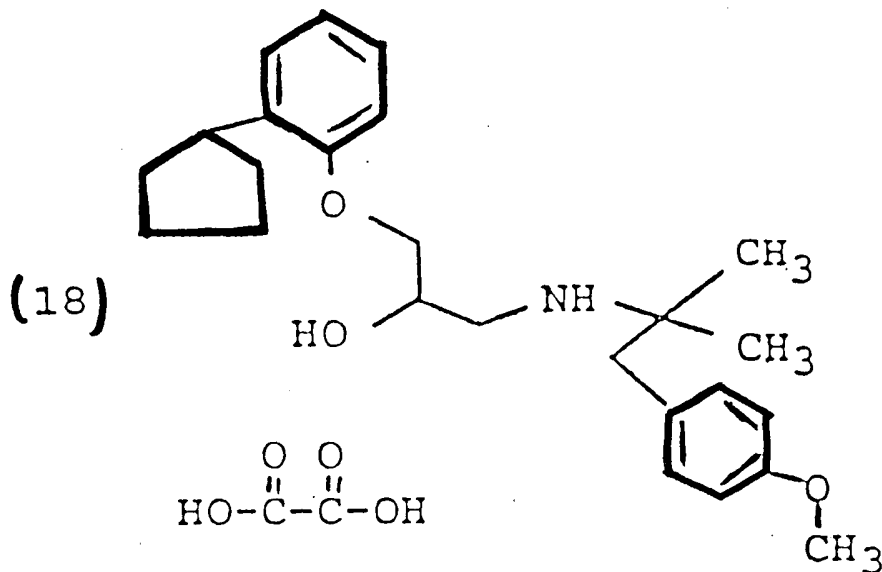
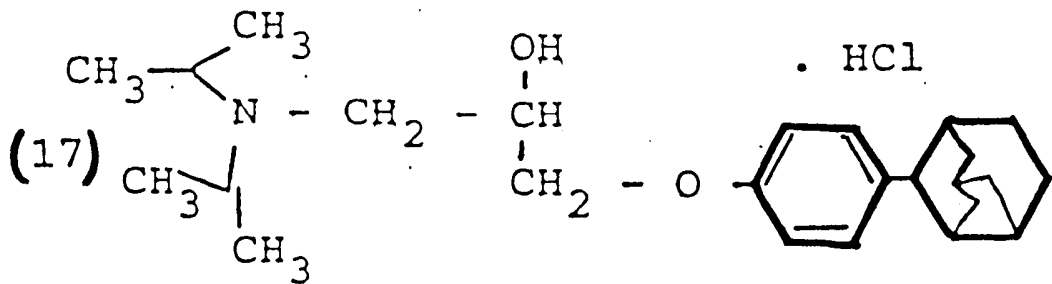
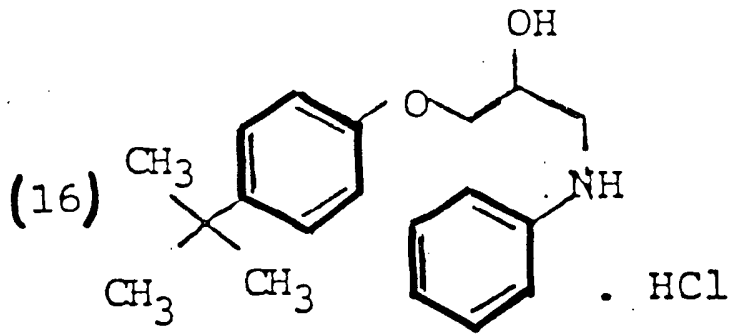
(14)



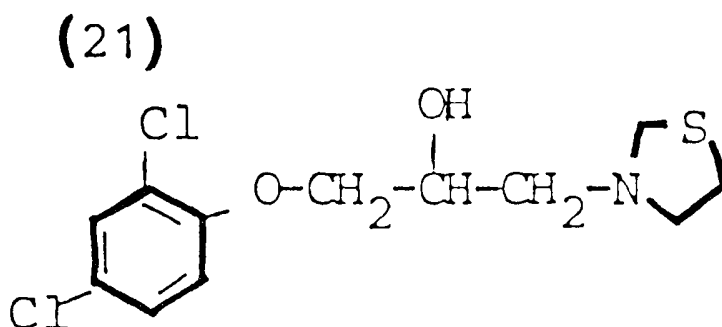
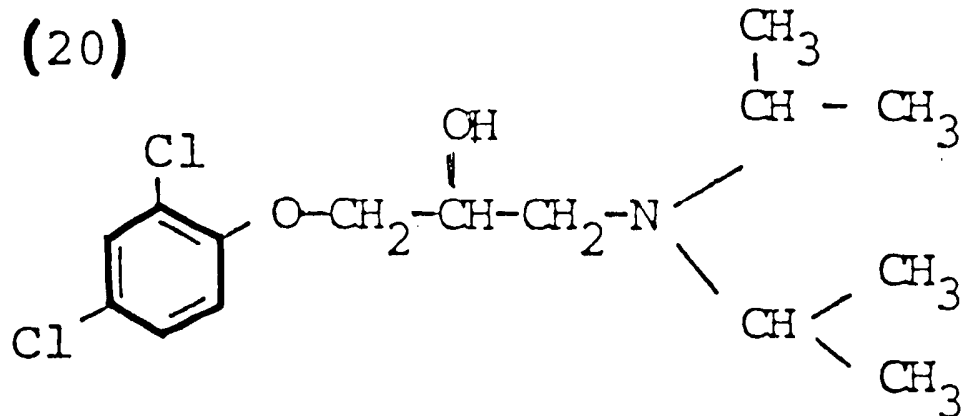
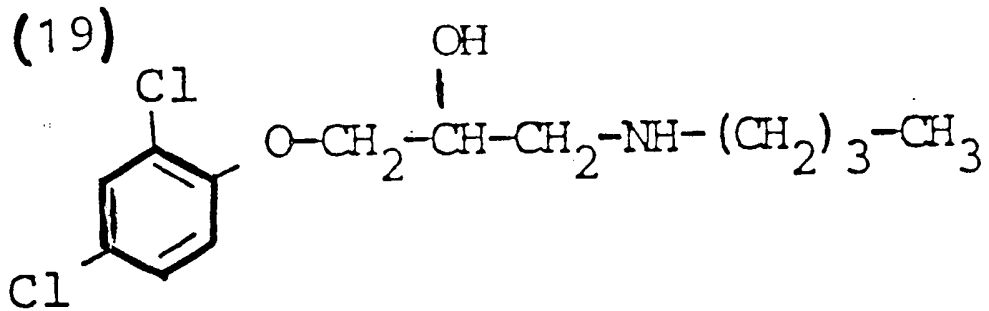
(15)



KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

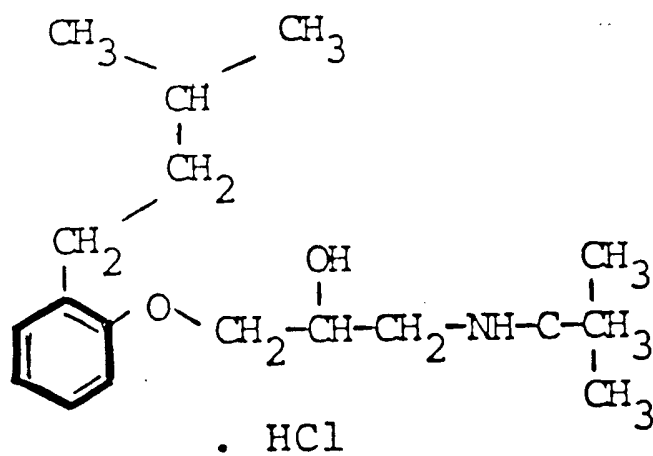


KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

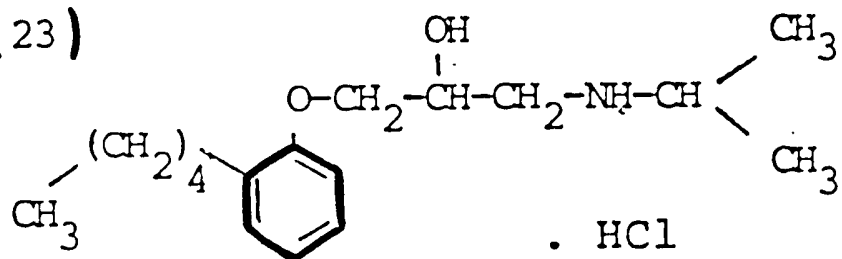


KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

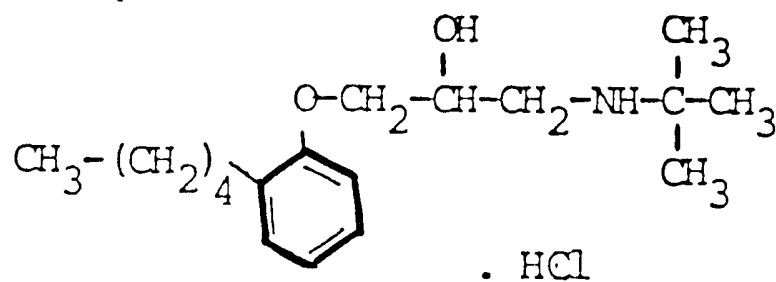
(22)



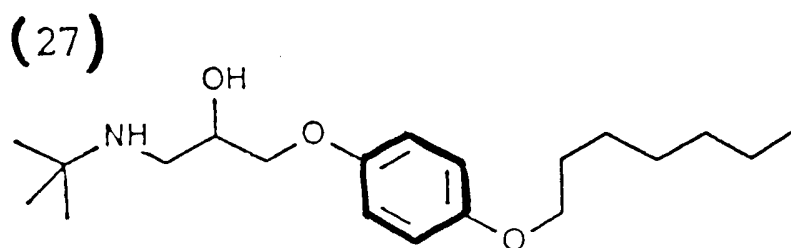
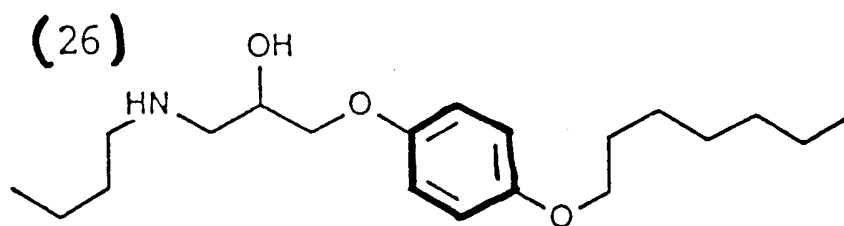
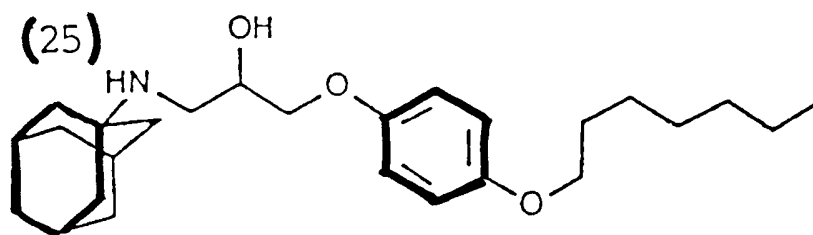
(23)



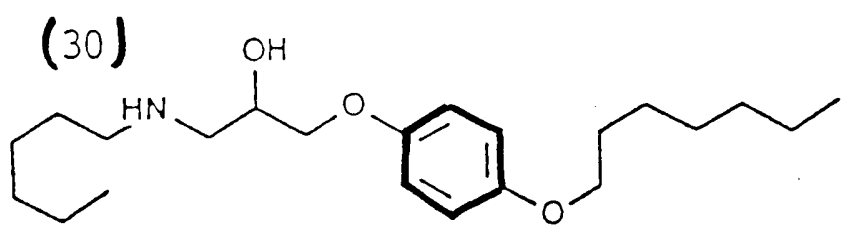
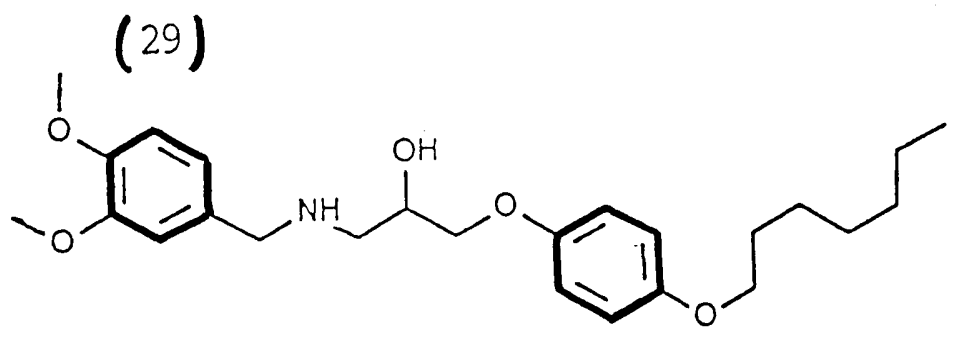
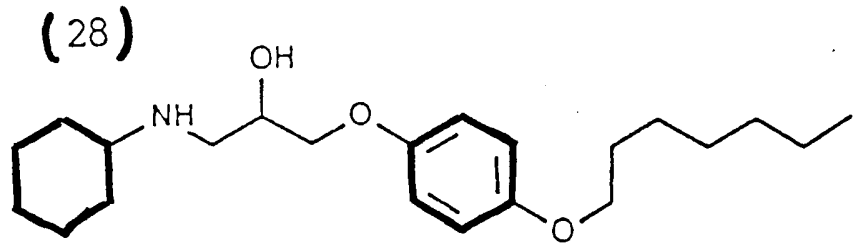
(24)



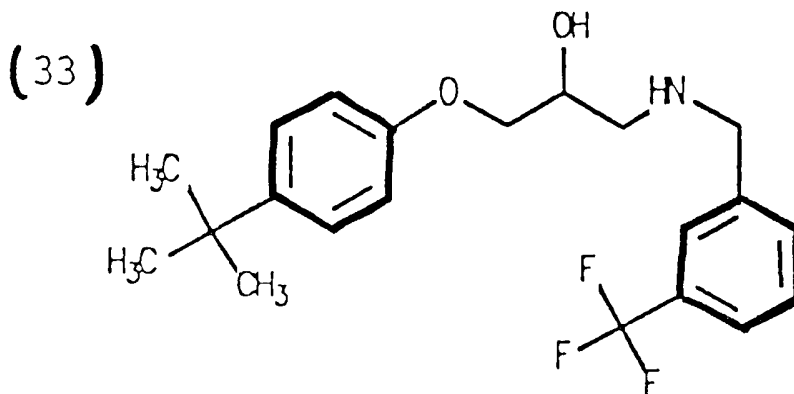
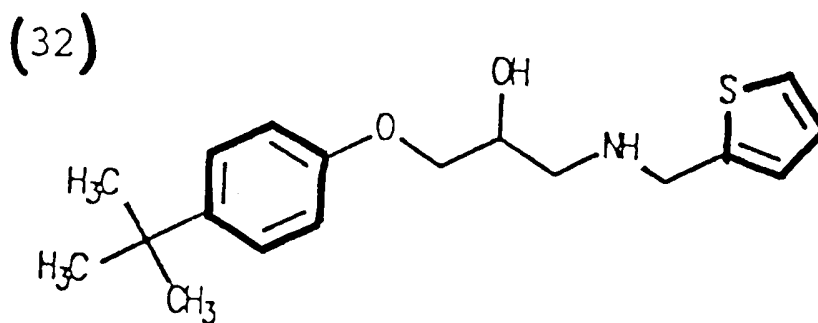
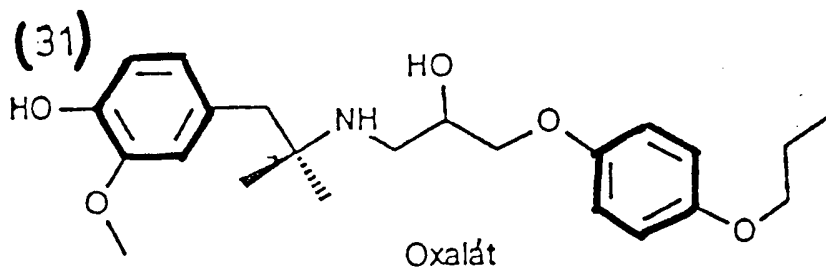
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



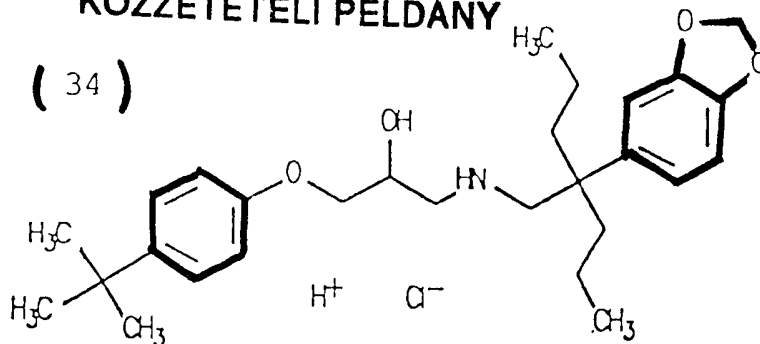
1270/81

10210

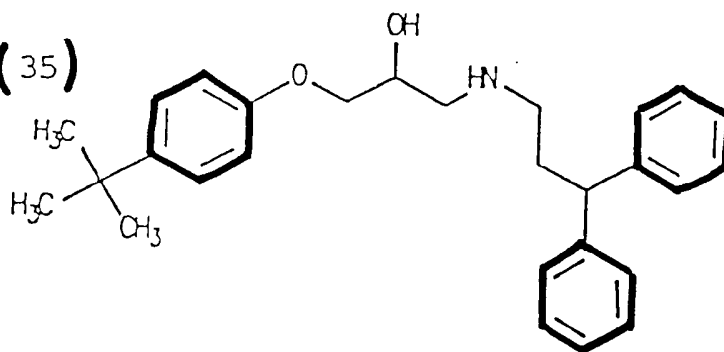
25/14

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

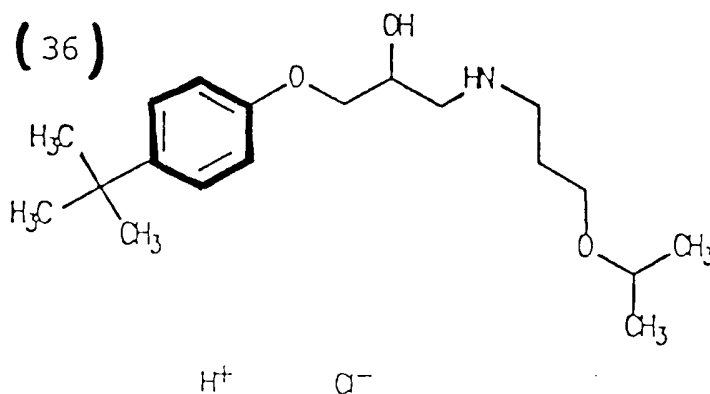
(34)



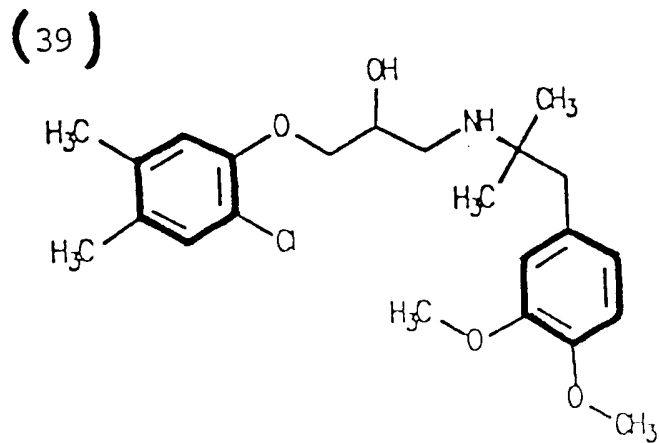
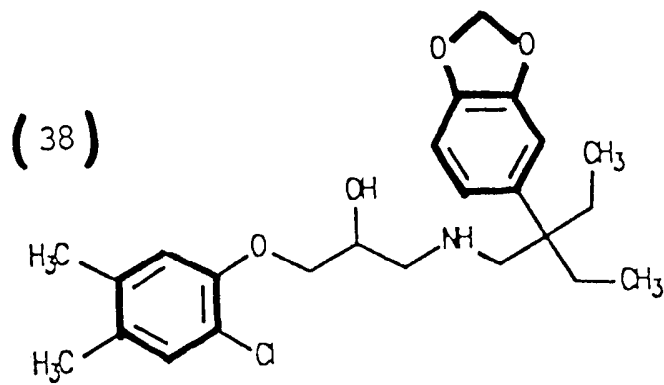
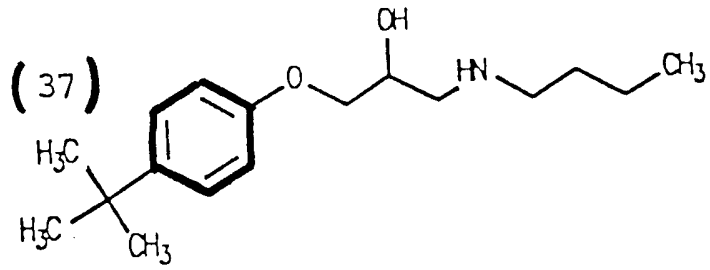
(35)



(36)



KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



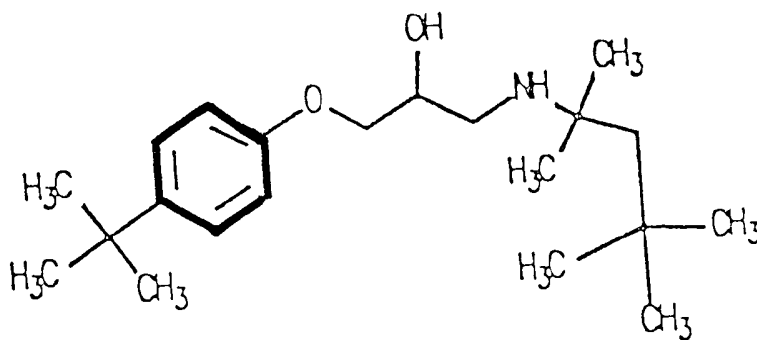
1750/91



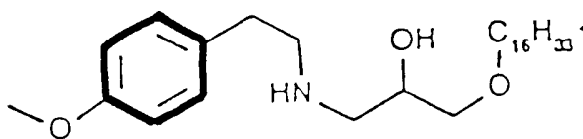
25/16

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

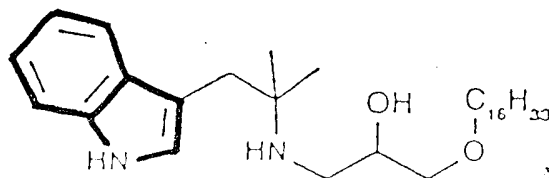
(40)



(41)



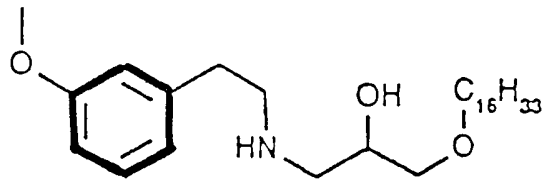
(42)



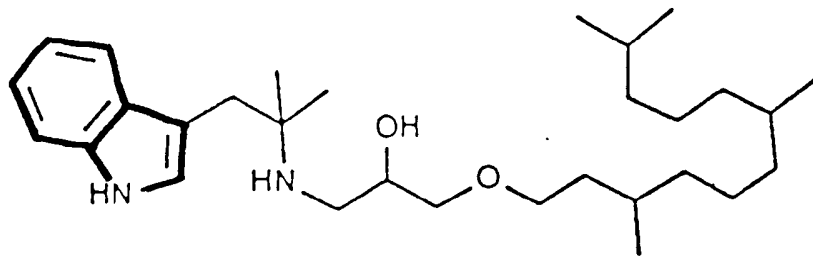
20. sz. Ügyvédi Munkaközösség
ADVOPATENT SZABADALMI IRODA
KARÁCSONYI BÉLA
szabadalmi ügyvéd
Postacím: 1251 Bp. Pf. 11.

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

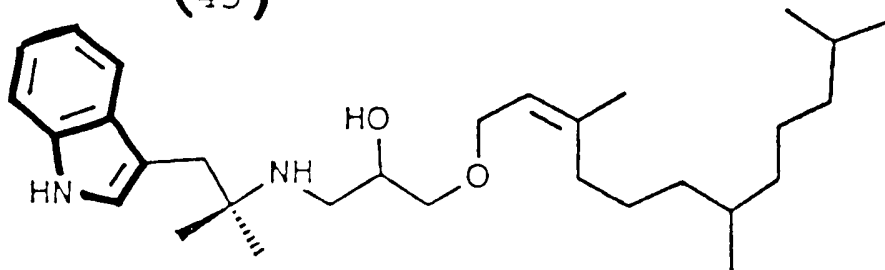
(43)



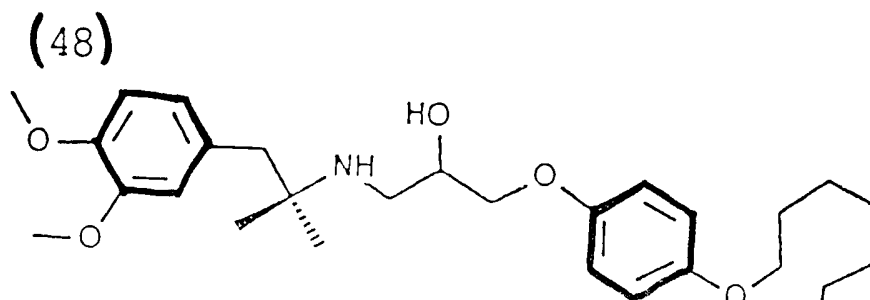
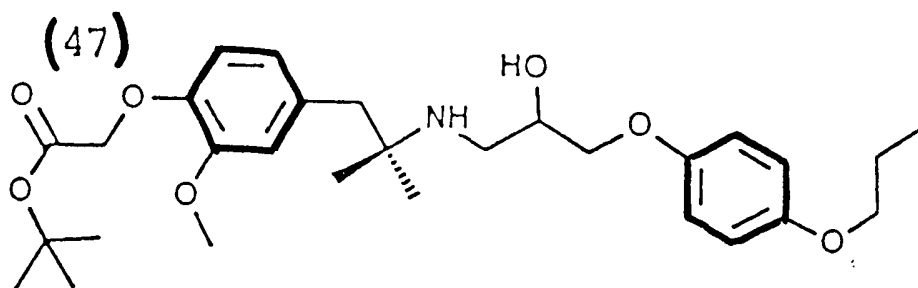
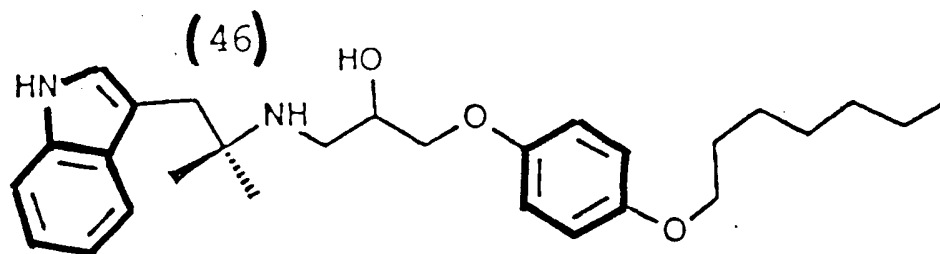
(44)



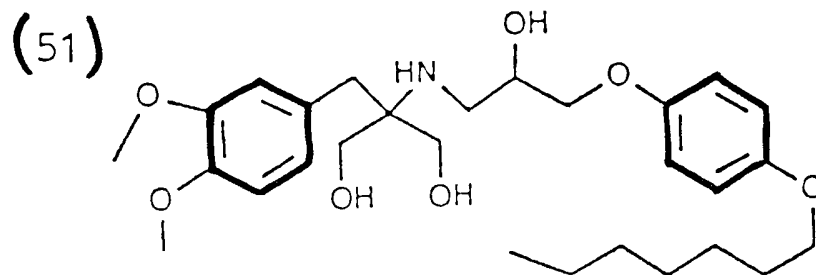
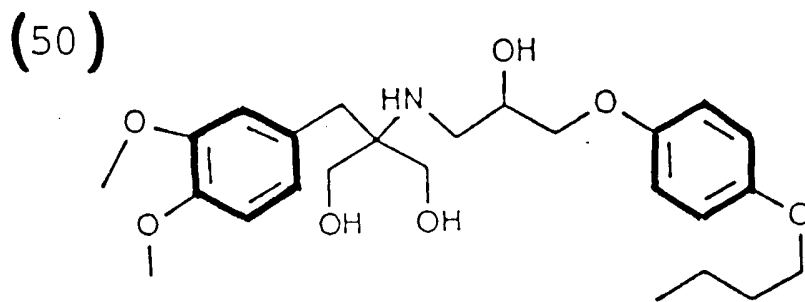
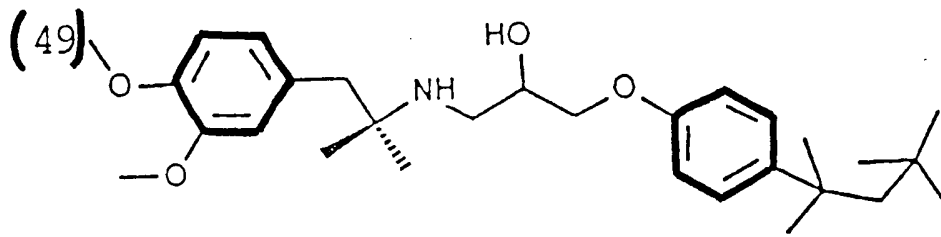
(45)



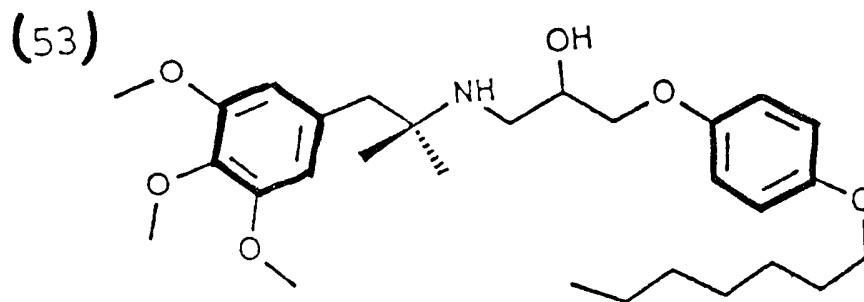
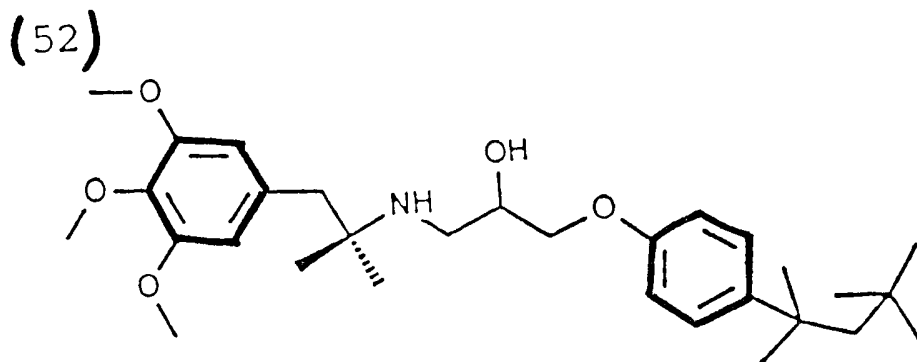
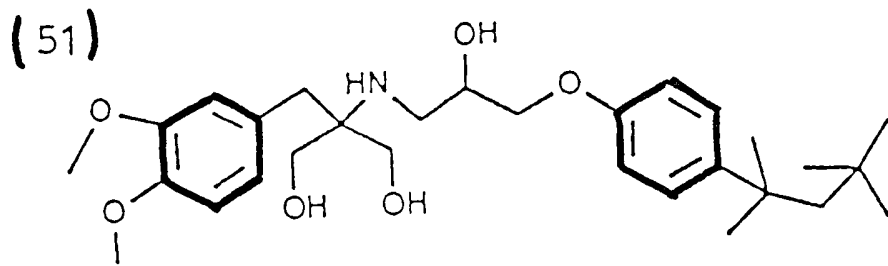
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



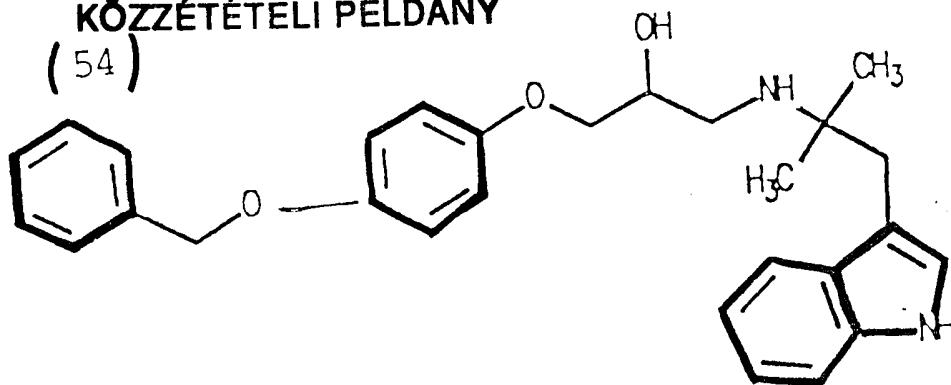
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



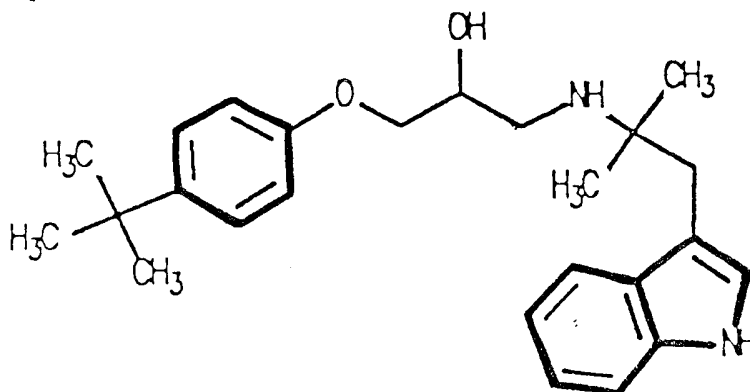
1250/91

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

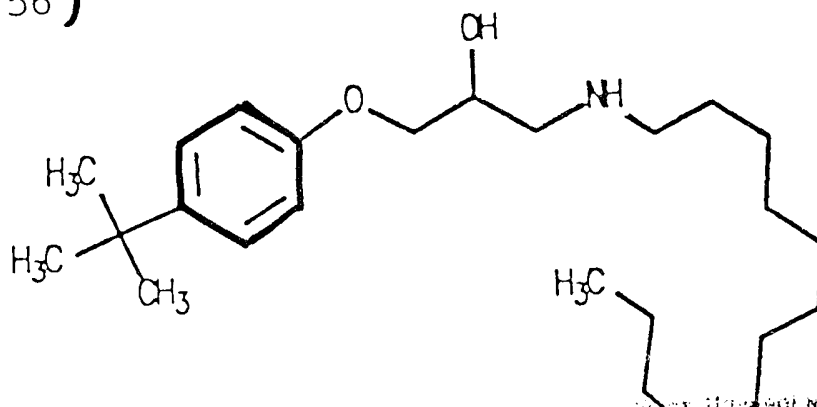
(54)



(55)



(56)



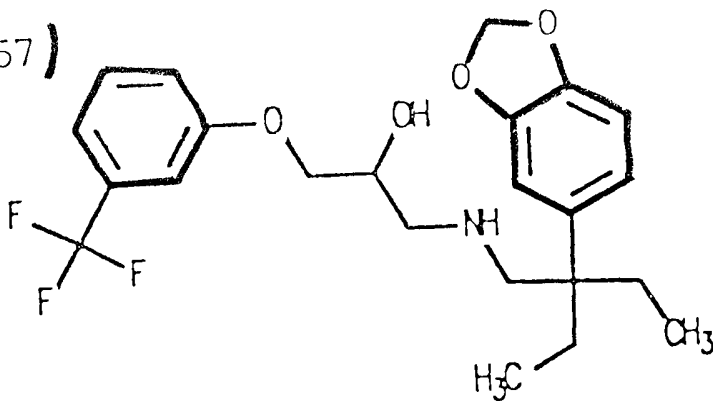
1750/91

10010

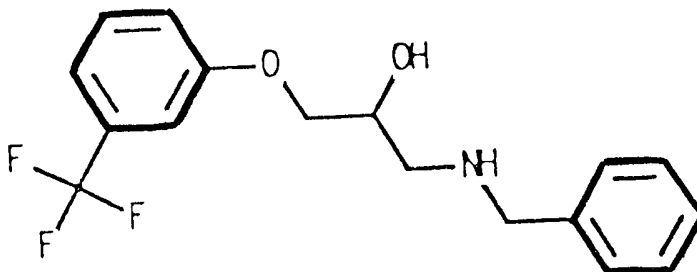
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

25/22

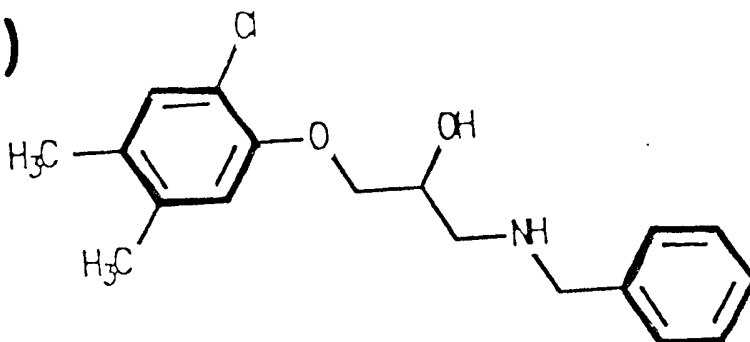
(57)



(58)

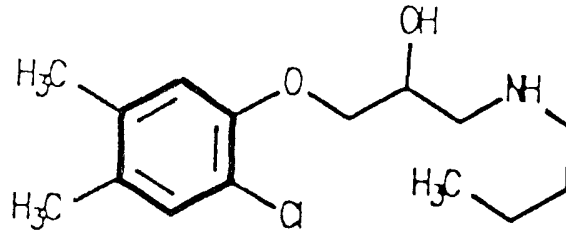


(59)

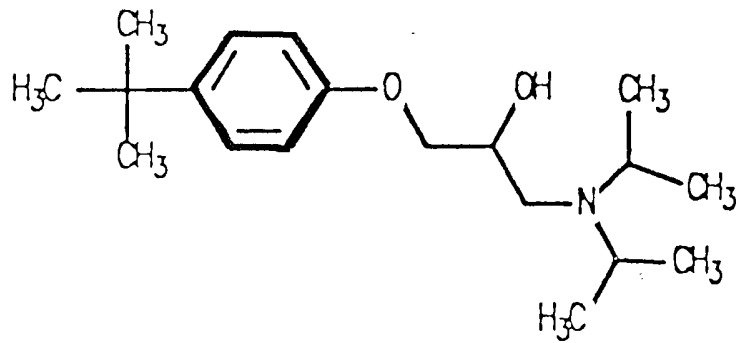


KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

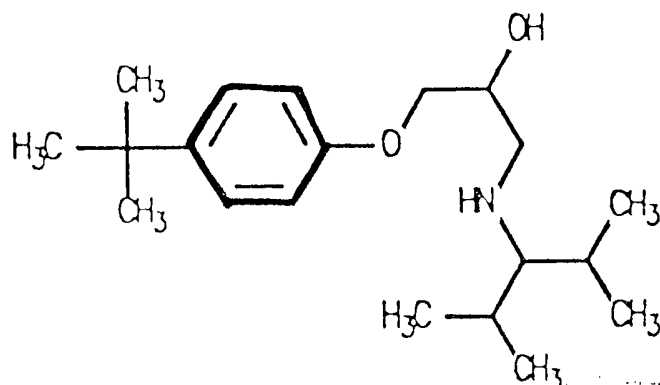
(60)



(61)

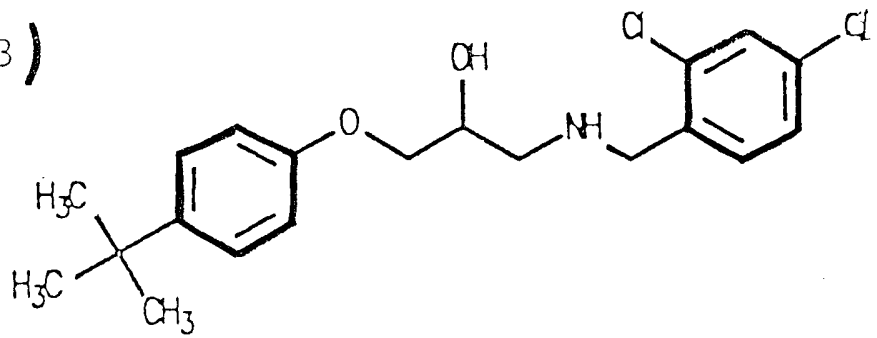


(62)

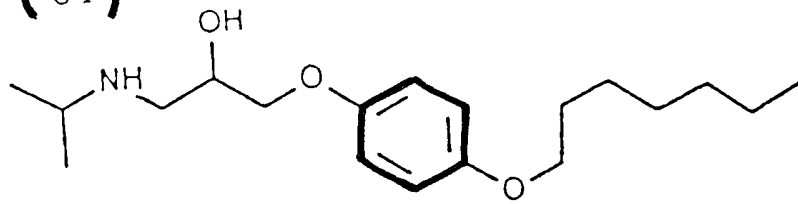


KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

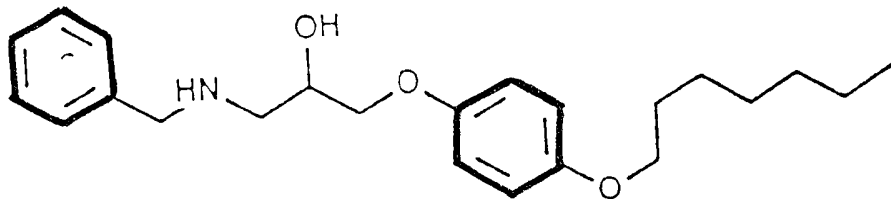
(63)



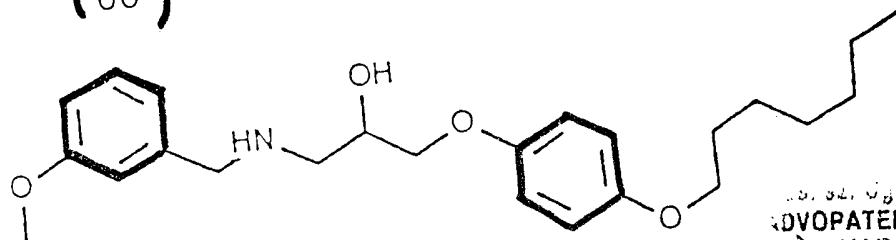
(64)



(65)

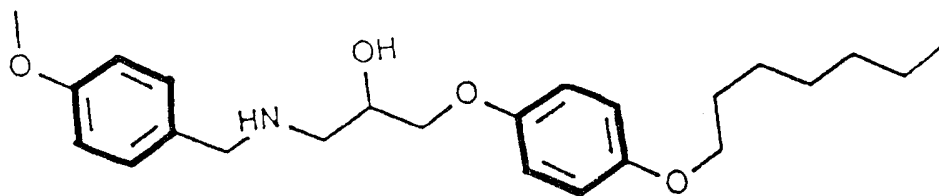


(66)

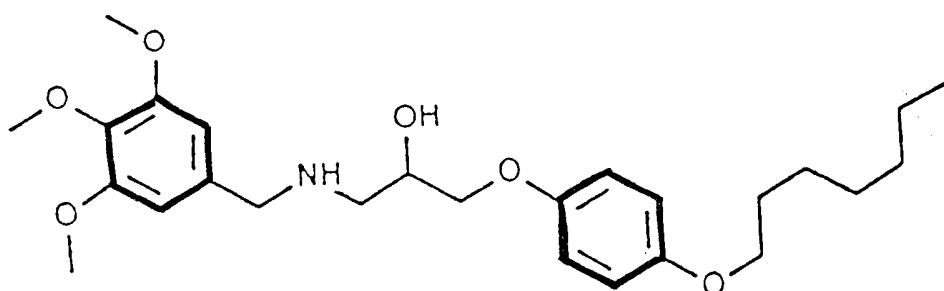


KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

(67)



(68)



(69)

