

2980/90

67349



KÖZZÉTÉTELI
PÉLDÁNY

57.997/SZE

K I V O N A T

Kinolin-származékok

französiszkeletés az ezek csatlakozása

Fujisawa Pharmaceutical Co., Ltd., OSAKA, JAPÁN

A bejelentés napja: 1992. 04. 21.

Elsőbbsége: 1991. 04. 22. (9108547.2),

NAGY-BRITANNIA

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/JP92/00510.

A nemzetközi közzététel száma: WO 92/18481

4. cikk (I) általános képletű vegyületek, és ezek gyógyászati-
tilag elfogadható sói, valamint az ezeket tartalmazó gyógyászati
készítmények, továbbá eljárás e vegyületek és készítmények elő-
állítására, ahol az (I) általános képletben

R¹ jelentése alkilcsoport vagy adott esetben helyettesített
arilcsoport,

R² jelentése hidroxilcsoport, védett hidroxilcsoport,
alkoxics csoport, halogénatom, adott esetben helyettesített
aminocsoport, merkaptocsoport vagy védett merkaptoc-
csoport,

R³ jelentése hidrogénatom, alkilcsoport, alkoxi-alkil-
-csoport vagy aril-alkil-csoport, és

R⁸ jelentése hidrogénatom, vagy pedig

R³ és R⁸ együttes jelentése alkilén-csoport,



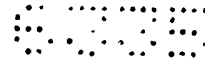
- R⁴ jelentése valamely szerves csoport,
- Z jelentése oxigénatom vagy kénatom, és
- n jelentése 0, 1 vagy 2.

~~Az (I) általános képletű vegyületek előállítására a ta-~~
lálmány értelmében úgy járnak el, hogy megfelelően helyettesített
kiindulási vegyületeket alkalmaznak, és ezeket önmagában ismert
~~módszerekkel~~ alakítják át a kívánt termékekké.

Handwritten note: Ezek a vegyületek általában csak a reakció során keletkeznek.

2983/83

67349



A

57.997/SZE

S.B.G. & K.
Budapesti Nemzetközi
Szabadalmi Iroda
H-1061 Budapest, Daiszínház u. 19.
Telefon: 153-3733, Fax: 153-3664

KÖZZÉTÉTELI
PÉLDÁNY

N^{ho} 6 COFD 215/56
215/36
401/06
401/04
413/04
417/12

COFD 411/06
AGIK 34/42

Kinolin-származékok

kinolin-származékok

Fujisawa Pharmaceutical Co., Ltd., OSAKA, JAPÁN

Feltalálók:

MATSUO Masaaki, *Tokushima*

TSUJI Kiyoshi, *Kinokuni*

NAKAMURA Katsuya, *Tokushima*

SPEARS Glen W., *USA*

OSAKA, JAPÁN

A bejelentés napja: 1992. 04. 21.

Elsőbbsége: 1991. 04. 22. (9108547.2),

NAGY-BRITANNIA

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/JP92/00510.

A nemzetközi közzététel száma: WO 92/18483



A jelen találmány tárgyát gyógyászati hatóanyagként használható új kinolin-származékok és ezek gyógyászatilag elfogadható sói képezik.

Bizonyos kinolin-származékok ismertek, ilyeneket irt le például a 4,547,511 és 4,127,574 számú amerikai szabadalmi leírás.

A jelen találmány tárgyát új kinolin-származékok képezik. Részletesebben, a jelen találmány tárgyát farmakológiai hatással rendelkező, új kinolin-származékok és ezek gyógyászatilag elfogadható sói, továbbá az ezeket a vegyületeket tartalmazó gyógyászati készítmények, valamint az ezen vegyületek előállítására és alkalmazására szolgáló eljárás képezik.

Ennek megfelelően, a jelen találmány tárgyát egyrészt olyan új és hasznos kinolin-származékok és ezek gyógyászatilag elfogadható sói képezik, amelyeknek erős immunmoduláló hatása (például az autoantitestek termelését gátló és más, hasonló hatása), gyulladásgátló hatása és rákellenes hatása van.

A jelen találmány tárgya továbbá eljárás e kinolin-származékok és sóik előállítására.

A jelen találmány tárgyát képezik továbbá a hatóanyagként valamely, említett kinolin-származékot vagy gyógyászatilag elfogadható sóját tartalmazó gyógyászati készítmények.

A jelen találmány tárgya továbbá eljárás az említett kinolin-származékok vagy ezek gyógyászatilag elfogadható sói olyan, gyógyászati hatóanyagként való alkalmazására, amelynek során e vegyületeket embereken vagy állatokon gyulladással ál-



lapotok, a fájdalom különféle formái, kollagén betegségek, auto-immun betegségek, különféle immunológiai betegségek, rák és más, hasonló kezelésére és/vagy megelőzésére használjuk.

A jelen találmány szerinti kinolin-származékok ujak, e vegyületeket az (I) általános képlettel jellemezhetjük, ahol e képletben

- R^1 jelentése rövidszénláncú alkilcsoport vagy adott esetben egy vagy több alkalmas csoporttal helyettesített arilcsoport,
- R^2 jelentése hidroxilcsoport, védett hidroxilcsoport, rövidszénláncú alkoxicssoport, halogénatom, aminocsoport, helyettesített aminocsoport, merkaptocsoport vagy védett merkaptocsoport,
- R^3 jelentése hidrogénatom, rövidszénláncú alkilcsoport, rövidszénláncú alkoxicssoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport vagy arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport, és
- R^8 jelentése hidrogénatom, vagy pedig
- R^3 és R^8 együttes jelentése rövidszénláncú alkilcsoport,
- R^4 jelentése valamely szerves csoport,
- Z jelentése oxigénatom vagy kénatom, és
- n jelentése 0, 1 vagy 2.

A jelen találmány szerinti (I) általános képletű vegyületeket az A-M-reakcióvázlattal szemléltetett a) - m) eljárásváltozattal állíthatjuk elő, ahol az említett reakcióvázlatokban szereplő általános képletekben

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^8 , Z és n

- jelentése a fenti,
- R^2_a jelentése halogénatom,
- R^2_b jelentése aminocsoport vagy védett aminocsoport,
- R^2_c jelentése védett merkaptocsoport,
- R^2_d jelentése rövidszénláncú alkoxicssoport,
- R^4_a jelentése védett karboxilcsoport,
- R^4_b jelentése védett karboxilcsoportot tartalmazó acil-
csoport,
- R^4_c jelentése karboxilcsoportot tartalmazó acilcsoport,
- R^4_d jelentése nitrocsoportot tartalmazó acilcsoport,
- R^4_e jelentése aminocsoportot tartalmazó acilcsoport,
- R^4_f jelentése acil-amino-csoportot tartalmazó acilcso-
port,
- R^5 jelentése lehasadó csoport,
- a $-CO-R^6$ általános képletű csoport
jelentése amidált karboxilcsoport,
- X^1, X^2 és X^3
jelentése egyaránt lehasadó csoport,
- M^1 és M^2 jelentése egyaránt alkálifém atom, és
- m jelentése 1 vagy 2.

A kiindulási vegyületeket és ezek sóit az N-U-reakció-
vázlattal szemléltetett n) - u) eljárásváltozattal állíthatjuk
elő, ahol az említett reakcióvázlatokban szereplő általános kép-
letekben

- $R^1, R^3, R^4, R^5, R^8, X^2, Z$ és n
jelentése a fenti,
- R^3_a jelentése rövidszénláncú alkilcsoport, rövidszénláncú

alkoxicsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil- csoport vagy arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport,

R^7 , R^9 , R^{10} , X^4 , X^5 és X^6

jelentése egyaránt lehasadó csoport, és

R^{12} jelentése védett karboxilcsoport.

A jelen találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek alkalmas, gyógyászatilag elfogadható sói a szokásos, nem-toxikus sók, például a bázisokkal vagy savakkal képzett addiciós sók lehetnek. Ilyenek például a szervetlen bázisokkal képzett sók, mint például az alkálifémsók (például nátriumsó, káliumsó és más, hasonló), az alkáli-földfémsók (például kalciumsó, magnéziumsó és más, hasonló), az ammóniumsók; a szerves bázisokkal képzett sók, mint például egy szerves aminnal képzett só (például trietil-aminnal, piridinnel, pikolinnal, etanol-aminnal, trietanol-aminnal, diciklohexil-aminnal, N,N'-dibenzil-etilén-diaminnal képzett só és más, hasonló); a szervetlen savakkal képzett savaddiciós sók (például hidroklorid, hidrobromid, szulfát, foszfát és más, hasonló); a szerves karbonsavakkal vagy szulfonsavakkal képzett addiciós sók (például a formiát, acetát, trifluor-acetát, maleát, tartarát, metán-szulfonát, benzol-szulfonát, toluol-szulfonát és más, hasonló); valamint a bázikus vagy savas jellegű aminosavakkal képzett sók (például az argininrel, aszparaginsavval, glutaminsavval és más, hasonlókkal képzett sók).

A jelen leírásban a fentiekben és az alábbiakban az egyes meghatározásokra alkalmas példákat adunk, e példák szemléltetik a jelen találmány oltalmi körét, a továbbiakban e meghatározásokat részletesen kifejtjük.

A "rövidszénláncú" kifejezés 1-6 szénatomos csoportot jelöl, ha nem adjuk meg másképp.

A "hosszuszénláncú" kifejezés 7-20 szénatomos csoportot jelöl, ha nem adjuk meg másképp.

A "rövidszénláncú alkoxicsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport" és az "arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport" részét képező, alkalmas "rövidszénláncú alkilcsoport" lehet például egy egyenes vagy elágazó szénláncú ilyen csoport, mint például a metilcsoport, etilcsoport, propilcsoport, izopropilcsoport, butilcsoport, terciér-butyl-csoport, pentilcsoport, neopentilcsoport, hexilcsoport és más, hasonló, ahol legelőnyösebbek például az 1-5 szénatomos alkilcsoportok.

A "rövidszénláncú alkoxicsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport" részét képező, alkalmas "rövidszénláncú alkoxicsoport" lehet például metoxicsoport, etoxicsoport, propoxicsoport, izopropoxicsoport, butoxicsoport, izobutoxicsoport, terciér-butoxi-csoport, pentiloxicsoport, terciér-pentiloxi-csoport, hexiloxicsoport és más, hasonló.

Az "arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport" részét képező "arilcsoport" lehet például fenilcsoport, naftilcsoport és más, hasonló.

Egy alkalmas "rövidszénláncú alkilénecsoprot" lehet például egy egyenes vagy elágazó szénláncu ilyen csoport, mint például a metilénecsoprot, etilénecsoprot, trimetilénecsoprot, tetrametilénecsoprot, pentametilénecsoprot, hexametilénecsoprot, metil-metilén-csoport, etil-etilén-csoport, propilénecsoprot és más, hasonlók, ahol előnyösek például az 1-4 szénatomos alkilénecsoprotok és legelőnyösebb az etilénecsoprot.

Egy alkalmas "halogénatom" lehet például klóratom, brómatom, jódatom vagy fluoratom.

Egy alkalmas "alkálifém" lehet például nátrium, kálium és más, hasonlók.

Az "adott esetben egy vagy több alkalmas csoporttal helyettesített arilcsoport" kifejezésben szereplő helyettesítő lehet például egy rövidszénláncú alkilcsoport (például metilcsoport, etilcsoport, propilcsoport, izopropilcsoport, butilcsoport, izobutilcsoport, terciér-butil-csoport, pentilcsoport, neopentilcsoport, terciér-pentil-csoport, hexilcsoport és más, hasonlók), rövidszénláncú alkoxicsoprot (például metoxicsoprot, etoxicsoprot, propoxicsoprot, izopropoxicsoprot, izobutoxicsoprot, terciér-butoxi-csoport, pentiloxicsoprot, neopentiloxicsoprot, terciér-pentiloxi-csoport, hexiloxicsoprot és más, hasonlók), rövidszénláncú alkenilcsoport (például vinilcsoport, 1-propenil-csoport, allilcsoport, 1-metil-allil-csoport, 1-, 2- vagy 3-but-enil-csoport, 1-, 2-, 3- vagy 4-pentenil-csoport, 1-, 2-, 3-, 4- vagy 5-hexenil-csoport és más, hasonlók), rövidszénláncú alkinilcsoport (például etinilcsoport, 1-propinil-csoport, propargilcsoport, 1-metil-propargil-csoport, 1-, 2- vagy 3-butinil-csoport,



1-, 2-, 3- vagy 4-pentinil-csoport, 1-, 2-, 3-, 4- vagy 5-hexinil-csoport és más, hasonló), egy, két vagy három halogénatommal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport (például fluor-metil-csoport, difluor-metil-csoport, trifluor-metil-csoport, klór-metil-csoport, diklór-metil-csoport, triklór-metil-csoport, bróm-metil-csoport, dibróm-metil-csoport, tribróm-metil-csoport, 1- vagy 2-fluor-etil-csoport, 1- vagy 2-bróm-etil-csoport, 1- vagy 2-klór-etil-csoport, 1,1-difluor-etil-csoport, 2,2-difluor-etil-csoport és más, hasonló), egy két vagy három halogénatommal helyettesített rövidszénláncú alkoxicssoport (például fluor-metoxi-csoport, difluor-metoxi-csoport, trifluor-metoxi-csoport, klór-metoxi-csoport, diklór-metoxi-csoport, triklór-metoxi-csoport, bróm-metoxi-csoport, dibróm-metoxi-csoport, tribróm-metoxi-csoport és más hasonló), halogénatom (például klóratom, bróm-atom, fluoratom vagy jódatom), karboxilcsoport, védett karboxilcsoport, hidroxilcsoport, védett hidroxilcsoport, arilcsoport (például fenilcsoport, naftilcsoport és más, hasonló), arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport, mint például fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport (például benzilcsoport, fenil-etil-csoport, fenil-propil-csoport és más, hasonló), karboxilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport, ahol a rövidszénláncú alkilcsoport például valamely, a fentiekben említett ilyen csoport lehet, védett karboxilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport, ahol a rövidszénláncú alkilcsoport például valamely, a fentiekben említett ilyen csoport lehet, és a védett karboxilcsoport valamely, az alábbiakban példaképpen említett csoport

lehet; aminocsoport, védett aminocsoport, di(rövidszénláncú alkil)-amino-csoport (például dimetil-amino-csoport, dietil-amino-csoport, diizopropil-amino-csoport, etil-metil-amino-csoport, izopropil-metil-amino-csoport, etil-izopropil-amino-csoport és más, hasonló), hidroxilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport, védett hidroxilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport, nitrocsoport, acilcsoport, cianocsoport, merkaptocsoport, rövidszénláncú alkil-tio-csoport (például metil-tio-csoport, etil-tio-csoport, propil-tio-csoport, izopropil-tio-csoport, butil-tio-csoport és más, hasonló), iminocsoport és más, hasonló.

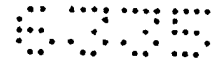
Egy alkalmas "acilcsoport" lehet például karbamoil-csoport, tiokarbamoilcsoport, egy alifás acilcsoport, vagy egy aromás csoportot tartalmazó acilcsoport (amelyet aromás acilcsoportként említünk), valamint egy heterociklusos csoportot tartalmazó acilcsoport (amelyet heterociklusos acilcsoportnak nevezünk).

Az alábbiakban szemléltetésképpen megadunk néhány alkalmas acilcsoportot:

karbamoilcsoport;

tiokarbamoilcsoport;

alifás acilcsoport, például egy rövidszénláncú vagy hosszuszénláncú alkanoilcsoport (például formilcsoport, acetilcsoport, propanoilcsoport, butanoilcsoport, 2-metil-propanoil-csoport, pentanoilcsoport, 2,2-dimetil-propanoil-csoport, hexanoilcsoport, heptanoilcsoport, oktanoilcsoport, nonanoilcsoport, dekanoilcsoport, undekanoilcsoport, dodekanoilcsoport, tridekanoil-



csoport, tetradekanoilcsoport, pentadekanoilcsoport, hexadekanoilcsoport, heptadekanoilcsoport, oktadekanoilcsoport, nonadekanoilcsoport, ikozanoilcsoport és más, hasonlók;

rövidszénláncú vagy hosszuszénláncú alkoxi-karbonil-csoport (például metoxi-karbonil-csoport, etoxi-karbonil-csoport, terciér-butoxi-karbonil-csoport, terciér-pentiloxi-karbonil-csoport, heptiloxi-karbonil-csoport és más, hasonlók);

rövidszénláncú vagy hosszuszénláncú alkil-szulfonil-csoport (például metil-szulfonil-csoport, etil-szulfonil-csoport és más, hasonlók);

rövidszénláncú vagy hosszuszénláncú alkoxi-szulfonil-csoport (például metoxi-szulfonil-csoport, etoxi-szulfonil-csoport és más, hasonlók);

amino-szulfonil-csoport és más, hasonlók;

egy aromás acilcsoport, mint például egy aroilcsoport (például benzoilcsoport, toluilcsoport, naftoilcsoport és más, hasonlók);

arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkanoilcsoport /például fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkanoilcsoport (például fenil-acetil-csoport, fenil-propanoil-csoport, fenil-butanoil-csoport, fenil-izobutiril-csoport, fenil-pentanoil-csoport, fenil-hexanoil-csoport és más, hasonlók), naftilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkanoilcsoport (például naftil-acetil-csoport, naftil-propanoil-csoport, naftil-butanoil-csoport és más, hasonlók), és más, hasonlók/;

arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkenoilcsoport /például fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkenoil-



csoport (például fenil-propenoil-csoport, fenil-butenoil-csoport, fenil-metakriloil-csoport, fenil-pentenoil-csoport, fenil-hexenoil-csoport és más, hasonló), naftilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkenoilcsoport (például naftil-propenoil-csoport, naftil-butenoil-csoport, naftil-pentenoil-csoport és más, hasonló) és más, hasonló/;

arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkoxi-karbonil-csoport /például fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkoxi-karbonil-csoport (például benziloxi-karbonil-csoport és más, hasonló), és más, hasonló/;

arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú cikloalkil-karbonil-csoport /például fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú cikloalkil-karbonil-csoport (például 1-fenil-1-ciklopropil-karbonil-csoport, 1-fenil-1-ciklopentil-karbonil-csoport és más, hasonló), és más, hasonló/;

ariloxi-karbonil-csoport (például fenoxi-karbonil-csoport, naftiloxi-karbonil-csoport és más, hasonló);

ariloxicssoporttal helyettesített rövidszénláncú alkanoilcsoport (például fenoxi-acetil-csoport, fenoxi-propionil-csoport és más, hasonló);

aril-glioxiloil-csoport (például fenil-glioxiloil-csoport, naftil-glioxiloil-csoport és más, hasonló);

aril-szulfonil-csoport (például benzol-szulfonil-csoport, p-toluol-szulfonil-csoport és más, hasonló);

arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfonil-csoport /például fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfonil-csoport (például benzil-szulfonil-csoport és más,



hasonlók), és más, hasonlók/; és más, hasonlók;

heterociklusos acilcsoport, például egy heterociklusos karbonsavból lezármasztatható acilcsoport;

heterociklusos csoporttal helyettesített rövidszénláncú alkanoilcsoport (például heterociklusos csoporttal helyettesített acilcsoport, propanoilcsoport, butanoilcsoport, pentanoilcsoport, hexanoilcsoport és más, hasonlók);

heterociklusos csoporttal helyettesített rövidszénláncú alkenoilcsoport (például heterociklusos csoporttal helyettesített propenoilcsoport, butenoilcsoport, pentenoilcsoport, hexenoilcsoport és más, hasonlók);

heterociklusos csoporttal helyettesített glioxiloilcsoport (például tiazolil-glioxiloil-csoport, tienil-glioxiloil-csoport és más, hasonlók); és más, hasonlók;

ahol a "heterociklusos karbonsavból lezármasztatható acilcsoport", a "heterociklusos csoporttal helyettesített rövidszénláncú alkanoilcsoport", a "heterociklusos csoporttal helyettesített rövidszénláncú alkenoilcsoport" és a "heterociklusos csoporttal helyettesített glioxiloilcsoport" kifejezésekben szereplő, alkalmas heterociklusos csoport részletesebben például egy telített vagy telítetlen, monociklusos (egyetlen gyűrűből álló) vagy policiklusos (több gyűrűből álló), legalább egy heteroatomot, például oxigénatomot, kénatomot és/vagy nitrogénatomot tartalmazó heterociklusos csoport, vagy más, hasonló lehet.

Különösen előnyösek lehetnek az alábbi heterociklusos csoportok:

telítetlen, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), 1-4 nitrogénatomot tartalmazó, monociklusos heterociklusos csoport, például pirrolilcsoport, pirrolinilcsoport, imidazolilcsoport, pirazolilcsoport, piridilcsoport és N-oxidja, dihidropiridilcsoport, pirimidilcsoport, pirazinilcsoport, piridazinilcsoport, dihidropiridazinilcsoport, tetrahidropiridazinilcsoport, triazolilcsoport (például 4H-1,2,4-triazolilcsoport, 1H-1,2,3-triazolilcsoport, 2H-1,2,3-triazolilcsoport és más, hasonló), tetrazolilcsoport (például 1H-tetrazolilcsoport, 2H-tetrazolilcsoport és más, hasonló), és más, hasonló;

telített, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu) 1-4 nitrogénatomot tartalmazó, monociklusos heterociklusos csoport, például pirrolidinilcsoport, imidazolidinilcsoport, piperidilcsoport, piperazinilcsoport és más, hasonló;

telítetlen, kondenzált, 1-4 nitrogénatomot tartalmazó heterociklusos csoport, például indolilcsoport, izoindolilcsoport, indolinilcsoport, indolizinilcsoport, benzimidazolilcsoport, kinolilcsoport, izokinolilcsoport, indazolilcsoport, benzotriazolilcsoport, és más, hasonló;

telítetlen, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), 1-2 oxigénatomot és 1-3 nitrogénatomot tartalmazó, monociklusos heterociklusos csoport, például oxazolilcsoport, izoxazolilcsoport, oxadiazolilcsoport (például 1,2,4-oxadiazolilcsoport, 1,3,4-oxadiazolilcsoport, 1,2,5-oxadiazolilcsoport és más, hasonló) és más, hasonló;

telített, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), 1-2 oxigénatomot és 1-3 nitrogénatomot tartalmazó, monociklusos hetero-

ciklusos csoport, például morfolinilcsoport, szidnonilcsoport és más, hasonlók;

telitetlen, kondenzált, 1-2 oxigénatomot és 1-3 nitrogénatomot tartalmazó, heterociklusos csoport, például benzoxazolilcsoport, benzoxadiazolilcsoport dihidro-benzoxazinil-csoport (például 2H-3,4-dihidro-1,4-benzoxazinil-csoport és más, hasonlók);

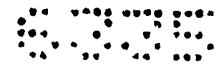
telitetlen, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), 1-2 kénatomot és 1-3 nitrogénatomot tartalmazó, monociklusos heterociklusos csoport, például tiazolilcsoport, izotiazolilcsoport, tiadiazolilcsoport (például 1,2,3-tiadiazolil-csoport, 1,2,4-tiadiazolil-csoport, 1,3,4-tiadiazolil-csoport, 1,2,5-tiadiazolil-csoport), dihidro-tiadiazolil-csoport és más, hasonlók;

telített, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), 1-2 kénatomot és 1-3 nitrogénatomot tartalmazó, monociklusos heterociklusos csoport, például tiazolidinilcsoport és más, hasonlók;

telitetlen, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), 1-2 kénatomot tartalmazó, monociklusos heterociklusos csoport, például tienilcsoport, dihidro-tiinil-csoport, dihidro-ditionil-csoport és más, hasonlók;

telitetlen, kondenzált, 1-2 kénatomot és 1-3 nitrogénatomot tartalmazó heterociklusos csoport, például benzotiazolilcsoport, benzotiadiazolilcsoport, benzotiazinilcsoport (például 2H-1,4-benzotiazinil-csoport és más, hasonlók), dihidro-benzotiazinil-csoport (például 2H-3,4-dihidro-benzotiazinil-csoport és más, hasonlók), és más, hasonlók;

telitetlen, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), egy oxigénatomot tartalmazó, monociklusos heterociklusos csoport, pél-



dául furilcsoport és más, hasonlók;

telítetlen, 1-2 oxigénatomot tartalmazó kondenzált heterociklusos csoport, például benzodioxolilcsoport (például 1,3-benzodioxolilcsoport és más, hasonlók), és más, hasonlók;

telítetlen, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), egy oxigénatomot és 1-2 kénatomot tartalmazó monociklusos heterociklusos csoport, például dihidro-oxatiinil-csoport és más, hasonlók;

telítetlen, kondenzált, 1-2 kénatomot tartalmazó heterociklusos csoport, például benzotienilcsoport, benzoditiinilcsoport és más, hasonlók;

telítetlen, kondenzált, egy oxigénatomot és 1-2 kénatomot tartalmazó heterociklusos csoport, például benzoxatiinilcsoport és más, hasonlók; és más, hasonlók.

Amint ezt a fentiekben említettük, az acilcsoport 1-10, egymásközt azonos vagy egymástól eltérő, alkalmas csoporttal helyettesített lehet, ilyen alkalmas helyettesítő csoport például egy

(IDE NEM JÖN BE VALAMI???)-----

rövidszénláncu alkilcsoport; rövidszénláncú alkoxics csoport (például metoxics csoport, etoxics csoport, propoxics csoport és más, hasonlók); rövidszénláncú alkil-tio-csoport (például metil-tio-csoport, etil-tio-csoport és más, hasonlók); rövidszénláncú alkil-amino-csoport (például metil-amino-csoport és más, hasonlók); rövidszénláncú cikloalkilcsoport (például ciklopentilcsoport, ciklohexilcsoport és más, hasonlók); rövidszénláncú cikloalkenilcsoport (például ciklohexenilcsoport és más, hasonlók); halogén-



atom, aminocsoport, védett aminocsoport, hidroxilcsoport, védett hidroxilcsoport, cianocsoport, nitrocsoport, karboxilcsoport, védett karboxilcsoport, szulfocsoport, szulfamoilcsoport, iminocsoport, oxocsoport, aminocsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport (például amino-metil-csoport, amino-etil-csoport és más, hasonló); karbamoiloxicssoport; hidroxilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport (például hidroxil-metil-csoport, 1- vagy 2-hidroxil-etil-csoport, 1-, 2- vagy 3-hidroxil-propil-csoport és más, hasonló); arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport /például fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport (például benzilcsoport, fenil-propil-csoport, fenil-butyl-csoport és más, hasonló); és más, hasonló/; 1-3, egymásközt azonos vagy egymástól eltérő, alkalmas csoporttal helyettesített arilcsoport /ahol a helyettesítő például rövidszénláncú alkilcsoport, halogénatom, rövidszénláncú alkoxicssoport, rövidszénláncú alkil-tio-csoport, di(rövidszénláncú alkil)-amino-csoport (például dimetil-amino-csoport, dietil-amino-csoport, dipropil-amino-csoport és más, hasonló); cianocsoport; egy, két vagy három halogénatommal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport (például fluor-metil-csoport, klór-metil-csoport, bróm-metil-csoport, difluor-metil-csoport, diklór-metil-csoport, dibróm-metil-csoport, trifluor-metil-csoport, triklór-metil-csoport, tribróm-metil-csoport, 1- vagy 2-fluor-etil-csoport, 1- vagy 2-klór-metil-csoport, 1- vagy 2-bróm-metil-csoport és más, hasonló); egy, két vagy három halogénatommal helyettesített rövidszénláncú alkoxicssoport (például fluor-metoxi-csoport, klór-metoxi-csoport,

bróm-metoxi-csoport, difluor-metoxi-csoport, diklór-metoxi-csoport, dibró-m-metoxi-csoport, trifluor-metoxi-csoport, tri-klór-metoxi-csoport, tribróm-metoxi-csoport, 1- vagy 2-fluor-etoxi-csoport, 1- vagy 2-klór-etoxi-csoport, 1- vagy 2-bróm-etoxi-csoport és más, hasonló(k)); karboxilcsoport; védett karboxilcsoport /például észteresített karboxilcsoport (például rövidszénláncú alkoxi-karbonil-csoport (például metoxi-karbonil-csoport, etoxi-karbonil-csoport, propoxi-karbonil-csoport és más, hasonló(k)), és más, hasonló(k)/, és más, hasonló(k)/; acilcsoport /például rövidszénláncú alkanoilcsoport (például formilcsoport, acetyl-csoport, propanoilcsoport, butanoilcsoport és más, hasonló(k)), és más, hasonló(k)/; nitrocsoport; aminocsoport; védett aminocsoport /például acil-amino-csoport /például rövidszénláncú alkanoil-amino-csoport (például formil-amino-csoport, acetyl-amino-csoport és más, hasonló(k)), és más, hasonló(k)/, és más, hasonló(k)/, és más, hasonló csoportok lehetnek/; (a) általános képletű csoport, ahol

A jelentése rövidszénláncú alkiléncsoport, amint ezt a fentiekben példaképpen megadtuk;

adott esetben egy vagy több alkalmas csoporttal helyettesített heterociklusos csoport (ahol az említett helyettesítő csoport például rövidszénláncú alkilcsoport; rövidszénláncú alkoxi-csoport; rövidszénláncú alkil-tio-csoport; rövidszénláncú alkil-amino-csoport; rövidszénláncú cikloalkilcsoport; rövidszénláncú cikloalkenilcsoport; halogénatom; aminocsoport; védett aminocsoport és más, hasonló(k) lehetnek/; és más, hasonló(k).

Egy alkalmas "védett hidroxilcsoport" lehet például

aciloxicsoport és más, hasonlók.

Egy alkalmas "védett merkaptocsoport" lehet például acil-tio-csoport és más, hasonlók.

Egy alkalmas "helyettesített aminocsoport" lehet például védett aminocsoport vagy rövidszénláncú alkil-amino-csoport és más, hasonlók.

Egy alkalmas "védett aminocsoport" lehet például acil-amino-csoport és más, hasonlók.

Az "aciloxicsoport"-ban, "acil-tio-csoport"-ban és "acil-amino-csoport"-ban szereplő, alkalmas acilcsoport lehet például valamely, a fentiekben példaképpen megadott csoport. A "rövidszénláncú alkil-amino-csoport" kifejezésben szereplő, alkalmas "rövidszénláncú alkilcsoport" lehet például valamely, a fentiekben példaképpen megadott csoport.

Egy alkalmas "lehasadó csoport" lehet például rövidszénláncú alkoxicsoport (például metoxicsoport, etoxicsoport, propoxicsoport, izopropoxicsoport, butoxicsoport, izobutoxicsoport, terciér-butoxi-csoport, pentiloxicsoport és más, hasonlók), ariloxicsoport (például fenoxicsoport, naftiloxicsoport és más, hasonlók), egy savmaradék-csoport, ahol egy alkalmas "savmaradék-csoport" lehet például halogénatom (például klóratom, bróm-atom, jódatom és más, hasonlók), szulfoniloxicsoport (például metán-szulfoniloxi-csoport, benzol-szulfoniloxi-csoport, toluol-szulfoniloxi-csoport és más, hasonlók), és más, hasonlók.

Egy alkalmas "amidált karboxilcsoport" lehet például adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal helyettesített karbamoilcsoport, (b) általános képletű csoport, ahol

az ezen csoport részét képező (c) általános képletű csoport egy legalább egy nitrogénatomot tartalmazó heterociklusos csoport, és más, hasonlók.

Egy alkalmas "szerves csoport" lehet például rövidszénláncú alkilcsoport, rövidszénláncú alkenilcsoport, rövidszénláncú alkinilcsoport, arilcsoport, arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport, karboxilcsoport, arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfinil-csoport, arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-tio-csoport, cianocsoport, acilcsoport, egy vagy több alkalmas csoporttal helyettesített heterociklusos csoport és más, hasonlók.

Az "arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport"-ban, az "arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfinil-csoport"-ban és az "arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-tio-csoport"-ban szereplő, alkalmas "rövidszénláncú alkilcsoport" lehet például valamely, a fentiekben példaképpen megadott ilyen csoport.

Egy alkalmas "rövidszénláncú alkenilcsoport" lehet például vinilcsoport, 1-propenil-csoport, allilcsoport, 1-metil-allil-csoport, 1-, 2- vagy 3-butenil-csoport, 1-, 2-, 3- vagy 4-pentenil-csoport, 1-, 2-, 3-, 4- vagy 5-hexenil-csoport és más, hasonlók.

Egy alkalmas "rövidszénláncú alkinilcsoport" lehet például etinilcsoport, 1-propinil-csoport, propargilcsoport, 1-metil-propargil-csoport, 1-, 2- vagy 3-butinil-csoport, 1-, 2-, 3- vagy 4-pentinil-csoport, 1-, 2-, 3-, 4- vagy 5-hexinil-csoport és más, hasonlók.

Az "arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport"-ban, az "arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfinil-csoport"-ban és az "arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-tio-csoport"-ban szereplő, alkalmas "arilcsoport" lehet például valamely, a fentiekben példaképpen megadott ilyen csoport.

Egy alkalmas "acilcsoport" lehet például valamely, a fentiekben példaképpen megadott ilyen csoport.

Egy alkalmas "heterociklusos csoport" lehet például valamely, a fentiekben példaképpen megadott ilyen csoport.

Az "adott esetben egy vagy több alkalmas csoporttal helyettesített heterociklusos csoport"-ban szereplő, alkalmas "helyettesítő csoport" lehet például egy rövidszénláncú alkilcsoport (például metilcsoport, etilcsoport, propilcsoport, izopropilcsoport, butilcsoport, izobutilcsoport, tercier-butyl-csoport, pentilcsoport, neopentilcsoport, tercier-pentil-csoport, hexilcsoport és más, hasonló), rövidszénláncú alkoxics csoport (például metoxics csoport, etoxics csoport, propoxics csoport, izopropoxics csoport, izobutoxics csoport, tercier-butoxi-csoport, pentiloxics csoport, neopentiloxics csoport, tercier-pentiloxi-csoport, hexiloxics csoport és más, hasonló), rövidszénláncú alkenilcsoport (például vinilcsoport, 1-propenil-csoport, allilcsoport, 1-metil-allil-csoport, 1-, 2- vagy 3-butenil-csoport, 1-, 2-, 3- vagy 4-pentenil-csoport, 1-, 2-, 3-, 4- vagy 5-hexenil-csoport és más, hasonló), rövidszénláncú alkinilcsoport (például etinilcsoport, 1-propinil-csoport, propargilcsoport, 1-metil-propargil-csoport, 1-, 2- vagy 3-butinil-csoport,

1-, 2-, 3- vagy 4-pentil-csoport, 1-, 2-, 3-, 4- vagy 5-hexil-csoport és más, hasonló), egy, két vagy három halogénatommal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport (például fluor-metil-csoport, difluor-metil-csoport, trifluor-metil-csoport, klór-metil-csoport, diklór-metil-csoport, triklór-metil-csoport, bróm-metil-csoport, dibróm-metil-csoport, tribróm-metil-csoport, 1- vagy 2-fluor-etil-csoport, 1- vagy 2-bróm-etil-csoport, 1- vagy 2-klór-etil-csoport, 1,1-difluor-etil-csoport, 2,2-difluor-etil-csoport és más, hasonló), halogénatom (például klóratom, brómatom, fluoratom vagy jódatom), karboxilcsoport, védett karboxilcsoport, hidroxilcsoport, védett hidroxilcsoport, arilcsoport (például fenilcsoport, naftilcsoport és más, hasonló), arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport, mint például fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport (például benzilcsoport, fenil-etil-csoport, fenil-propil-csoport és más, hasonló), karboxilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport, ahol a rövidszénláncú alkilcsoport például valamely, a fentiekben említett ilyen csoport lehet, védett karboxilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport, ahol a rövidszénláncú alkilcsoport például valamely, a fentiekben említett ilyen csoport lehet, és a védett karboxilcsoport valamely, az alábbiakban példaképpen említett csoport lehet; aminocsoport, védett aminocsoport, di(rövidszénláncú alkil)-amino-csoport (például dimetil-amino-csoport, dietil-amino-csoport, diizopropil-amino-csoport, etil-metil-amino-csoport, izopropil-metil-amino-csoport, etil-izopropil-amino-csoport és más, hasonló), hidroxilcsoporttal helyettesített

rövidszénláncú alkilcsoport, védett hidroxilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport, nitrocsoport, acilcsoport, cianocsoport, merkaptocsoport, rövidszénláncú alkil-tio-csoport (például metil-tio-csoport, etil-tio-csoport, propil-tio-csoport, izopropil-tio-csoport, butil-tio-csoport és más, hasonló), iminocsoport és más, hasonló.

Az "adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal helyettesített karbamoilcsoport" kifejezésben szereplő, alkalmas "helyettesítő csoport" lehet például egy rövidszénláncú alkilcsoport; rövidszénláncú alkoxicssoport (például metoxicssoport, etoxicssoport, propoxicssoport és más, hasonló); rövidszénláncú alkil-tio-csoport (például metil-tio-csoport, etil-tio-csoport és más, hasonló); rövidszénláncú alkil-amino-csoport (például metil-amino-csoport és más, hasonló); rövidszénláncú cikloalkilcsoport (például ciklopentilcsoport, ciklohexilcsoport és más, hasonló); rövidszénláncú cikloalkenilcsoport (például ciklohexenilcsoport és más, hasonló); halogénatom, aminocsoport, védett aminocsoport, hidroxilcsoport, védett hidroxilcsoport, cianocsoport, nitrocsoport, karboxilcsoport, védett karboxilcsoport, szulfocsoport, szulfamoilcsoport, iminocsoport, oxocsoport, aminocsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport (például amino-metil-csoport, amino-etil-csoport és más, hasonló); karbamoiloxicssoport; hidroxilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport (például hidroxil-metil-csoport, 1- vagy 2-hidroxi-etil-csoport, 1-, 2- vagy 3-hidroxi-propil-csoport és más, hasonló); arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport /például fenil-

csoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport (például benzilcsoport, fenil-propil-csoport, fenil-butyl-csoport és más, hasonló); és más, hasonló/; 1-3, egymásközt azonos vagy egymástól eltérő, alkalmas csoporttal helyettesített arilcsoport /ahol a helyettesítő például rövidszénláncú alkilcsoport, halogénatom, rövidszénláncú alkoxicssoport, rövidszénláncú alkil-tio-csoport, di(rövidszénláncú alkil)-amino-csoport (például dimetil-amino-csoport, dietil-amino-csoport, dipropil-amino-csoport és más, hasonló); cianocsoport; egy, két vagy három halogénatommal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport (például fluor-metil-csoport, klór-metil-csoport, bróm-metil-csoport, difluor-metil-csoport, diklór-metil-csoport, dibróm-metil-csoport, trifluor-metil-csoport, triklór-metil-csoport, tribróm-metil-csoport, 1- vagy 2-fluor-etil-csoport, 1- vagy 2-klór-metil-csoport, 1- vagy 2-bróm-metil-csoport és más, hasonló); egy, két vagy három halogénatommal helyettesített rövidszénláncú alkoxicssoport (például fluor-metoxi-csoport, klór-metoxi-csoport, bróm-metoxi-csoport, difluor-metoxi-csoport, diklór-metoxi-csoport, dibróm-metoxi-csoport, trifluor-metoxi-csoport, triklór-metoxi-csoport, tribróm-metoxi-csoport, 1- vagy 2-fluor-etoxi-csoport, 1- vagy 2-klór-etoxi-csoport, 1- vagy 2-bróm-etoxi-csoport és más, hasonló); karboxilcsoport; védett karboxilcsoport /például észteresített karboxilcsoport (például rövidszénláncú alkoxi-karbonil-csoport (például metoxi-karbonil-csoport, etoxi-karbonil-csoport, propoxi-karbonil-csoport és más, hasonló), és más, hasonló/, és más, hasonló/; acilcsoport /például rövidszénláncú alkanoilcsoport (például formilcsoport,

acetilcsoport, propanoilcsoport, butanoilcsoport és más, hasonló), és más, hasonló/; nitrocsoport; aminocsoport; védett aminocsoport /például acil-amino-csoport /például rövidszénláncú alkanoil-amino-csoport (például formil-amino-csoport, acetyl-amino-csoport és más, hasonló), és más, hasonló/, és más, hasonló/, és más, hasonló csoportok lehetnek/; (a) általános képletű csoport, ahol

A jelentése rövidszénláncú alkilcsoport, amint ezt a fentiekben példaképpen megadtuk;

adott esetben egy vagy több alkalmas csoporttal helyettesített heterociklusos csoport (ahol az említett helyettesítő csoport például rövidszénláncú alkilcsoport; rövidszénláncú alkoxi-csoport; rövidszénláncú alkil-tio-csoport; rövidszénláncú alkil-amino-csoport; rövidszénláncú cikloalkilcsoport; rövidszénláncú cikloalkenilcsoport; halogénatom; aminocsoport; védett aminocsoport és más, hasonló lehetnek); és más, hasonló.

Egy alkalmas "heterociklusos csoport" lehet például valamely, a fentiekben példaképpen megadott ilyen csoport.

Egy alkalmas "heterociklusos csoport" lehet például valamely, a fentiekben példaképpen megadott ilyen csoport.

Egy alkalmas "védett karboxilcsoport" lehet például egy észtercsoporthoz tartozó karboxilcsoport és más, hasonló. Alkalmas ilyen észtercsoporthoz tartozó például egy rövidszénláncú alkil-észter (például metil-észter, etil-észter, propil-észter, izopropil-észter, butil-észter, izobutil-észter, terciér-butil-észter, pentil-észter, terciér-pentil-észter, hexil-észter, 1-ciklopropil-etil-észter és más, hasonló); rövidszénláncú alkenil-észter (például vinil-

-észter, allil-észter és más, hasonló); rövidszénláncú alkinil-
 -észter (például etinil-észter, propinil-észter és más, hasonló);
 rövidszénláncú alkoxi-alkil-észter (például metoxi-metil-észter,
 toxi-metil-észter, izopropoxi-metil-észter, 1-metoxi-etil-
 -észter, 1-etoxi-etil-észter és más, hasonló); rövidszénláncú
 alkil-tio-alkil-észter (például metil-tio-metil-észter, etil-tio-
 -metil-észter, etil-tio-etil-észter, izopropil-tio-metil-észter
 és más, hasonló); egy, két vagy három halogénatommal helyette-
 sitett rövidszénláncú alkil-észter (például 2-jód-etil-észter,
 2,2,2-triklór-etil-észter és más, hasonló); rövidszénláncú alka-
 noiloxicsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-észter
 (például acetoxi-metil-észter, propioniloxi-metil-észter, buti-
 riloxi-metil-észter, valeriloxi-metil-észter, pivaloiloxi-me-
 til-észter, hexanoiloxi-metil-észter, 2-acetoxi-etil-észter, 2-
 -propioniloxi-etil-észter és más, hasonló); rövidszénláncú al-
 kán-szulfonil-csoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-
 -észter (például mezil-metil-észter, 2-mezil-etil-észter és más,
 hasonló);

arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-észter, mint
 például az adott esetben egy vagy több alkalmas csoporttal he-
 lyettesített, fenilcsoportot viselő rövidszénláncú alkil-észter
 (például benzil-észter, 4-metoxi-benzil-észter, 4-nitro-benzil-
 -észter, fenil-etil-észter, tritil-észter, benzhidril-észter,
 bisz(metoxi-fenil)-metil-észter, 3,4-dimetoxi-benzil-észter,
 4-hidroxi-3,5-di-tercier-butyl-benzil-észter és más, hasonló);
 adott esetben egy vagy több alkalmas csoporttal helyettesített
 aril-észter, mint például egy helyettesített vagy helyettesitet-

len fenil-észter (például fenil-észter, toлил-észter, tercier-butil-fenil-észter, xilil-észter, mezitil-észter, kumenil-észter, 4-klór-fenil-észter, 4-metoxi-fenil-észter és más, hasonló); tri(rövidszénláncú alkil)-szilil-észter; rövidszénláncú alkil-tioészter (például metil-tioészter, etil-tioészter és más, hasonló), és más, hasonló.

Egy alkalmas "legalább egy nitrogénatomot tartalmazó heterociklusos csoport" lehet például egy telítetlen, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), 1-4 nitrogénatomot tartalmazó, monociklusos heterociklusos csoport, például pirrolilcsoport, pirrolinilcsoport, imidazolilcsoport, pirazolilcsoport, dihidro-piridil-csoport, pirazinilcsoport, piridazinilcsoport, triazolilcsoport (például 4H-1,2,4-triazolil-csoport, 1H-1,2,3-triazolil-csoport, 2H-1,2,3-triazolil-csoport és más, hasonló), tetrazolilcsoport (például 1H-tetrazolil-csoport, 2H-tetrazolil-csoport és más, hasonló), és más, hasonló;

telített, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), 1-4 nitrogénatomot tartalmazó, monociklusos heterociklusos csoport, például pirrolidinilcsoport, imidazolidinilcsoport, piperidil-csoport, piperazinilcsoport és más, hasonló;

telítetlen, kondenzált, 1-4 nitrogénatomot tartalmazó heterociklusos csoport, például indolilcsoport, izoindolilcsoport, indolinilcsoport, benzimidazolilcsoport, indazolilcsoport, benzotriazolilcsoport és más, hasonló;

telített, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), 1-2 oxigénatomot és 1-3 nitrogénatomot tartalmazó monociklusos hetero-

ciklusos csoport, például morfolinilcsoport és más, hasonlók;
telitetlen, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), 1-2 kén-
atomot és 1-3 nitrogénatomot tartalmazó monociklusos heterociklu-
sos csoport, például dihidro-tiazinil-csoport és más, hasonlók;
telített, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), 1-2 kénato-
mot és 1-3 nitrogénatomot tartalmazó monociklusos heterociklusos
csoport, például tiazolidinilcsoport és más, hasonlók;
telitetlen, kondenzált, 1-2 oxigénatomot és 1-3 nitrogénatomot
tartalmazó heterociklusos csoport, például benzoxazolilcsoport,
benzoxadiazolilcsoport, benzoxazinilcsoport, dihidro-benzoxazi-
nil-csoport (például 2H-3,4-dihidro-1,4-benzoxazinil-csoport és
más, hasonlók);
telitetlen, kondenzált, 1-2 kénatomot és 1-3 nitrogénatomot tar-
talmazó heterociklusos csoport, például benzotiazolilcsoport,
benzotiadiazolilcsoport, benzotiazinilcsoport, dihidro-benzotia-
zinil-csoport (például 2H-3,4-dihidro-benzotiazinil-csoport és
más, hasonlók), és más, hasonlók.

A jelen találmány szerinti vegyületek és a kiindulási
anyagok előállítására szolgáló eljárásváltozatokat az alábbiakban
részletesen ismertetjük.

a) eljárásváltozat

(A-reakcióvázlat)

Az (Ia) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy
állíthatjuk elő, hogy valamely (II) általános képletű vegyületet
vagy sóját egy (III) általános képletű vegyülettel vagy sójával
reagáltatjuk.

A reakciót általában valamely szokásos oldószerben, például kloroformban, dietil-éterben, tetrahidrofuránban, benzolban, N,N-dimetil-formamidban, N,N-dimetil-acetamidban vagy bármely más, olyan szerves oldószerben végezzük, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett végezzük.

A reakciót általában egy szervetlen vagy szerves bázis, például egy alkálifém-hidroxid, alkálifém-hidrogén-karbonát, alkálifém-karbonát, alkálifém-hidrid (például nátrium-hidrid és más, hasonló), alkálifém-acetát, di(rövidszénláncú alkil)-amin (például diizopropil-amin és más, hasonló), tri(rövidszénláncú alkil)-amin, piridin bázis (például piridin, lutidin, pikolin, dimetil-amino-piridin és más, hasonló), N-(rövidszénláncú -alkil)-morfolin, N,N-di(rövidszénláncú alkil)-benzil-amin, N,N-di(rövidszénláncú alkil)-anilin és más, hasonló jelenlétében hajtjuk végre.

b) eljárásváltozat

(B-reakcióvázlat)

Az (Ic) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (Ib) általános képletű vegyületet vagy ennek sóját oxidáljuk.

Az oxidációt valamely szokásos, önmagában ismert, olyan módszerrel végezzük, amely képes a kénatomot oxidált kénatommá oxidálni. Alkalmas oxidálószer az oxigéntartalmú savak, például egy perjodát (például nátrium-perjodát, kálium-perjodát és más,

használnak), a peroxisavak, mint például a peroxi-benzoésavak (például peroxi-benzoésav, m-klór-peroxi-benzoésav és más, hasonló), és más, hasonló.

A reakciót általában valamely szokásos oldószerben, például vízben, egy alkoholban (például metanolban, etanolban, izopropanolban és más, hasonlóban), tetrahidrofuránban, dioxánban, diklór-metánban, kloroformban, N,N-dimetil-acetamidban, N,N-dimetil-formamidban vagy bármely más, olyan oldószerben végezzük, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra. Ezek közül a hidrofíli oldószereket vízzel készült elegyek formájában is használhatjuk.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett végezzük el.

c) eljárásváltozat

(C-reakcióvázlat)

Az (Ie) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (Id) általános képletű vegyületet, ennek a karboxilcsoporton aktivált származékát vagy sóját amidálási reakcióba visszük.

A jelen amidálási reakcióhoz használható, alkalmas amidáló reagens lehet például valamely (XXIII) általános képletű, ahol

R^6 jelentése a fenti, vegyület, ennek reakcióképes származéka vagy sója, és más, hasonló.

Egy (XXIII) általános képletű vegyület alkalmas, reak-

cióképes származéka lehet például egy Schiff-bázis típusu imino-
-vegyület vagy ennek tautomerje, az enamín típusu izomerje, ame-
lyet egy (XXIII) általános képletű vegyület és egy karbonil-ve-
gyület, például egy aldehid, keton vagy más, hasonlók reakciója
utján állítunk elő; egy szilil-származék, amelyet úgy állítunk
elő, hogy egy (XXIII) általános képletű vegyületet egy szilil-
-vegyülettel, például bisz(trimetil-szilil)-acetamiddal, egy
mono(trimetil-szilil)-acetamiddal /például N-(trimetil-szilil)-
-acetamiddal/, bisz(trimetil-szilil)-karbamiddal vagy más, ha-
sonlókkal reagáltatunk; vagy egy olyan származék, amelyet egy
(XXIII) általános képletű vegyület és foszfor-triklorid vagy
foszgén, vagy más, hasonlók reagáltatása utján állítunk elő.

Egy (Id) általános képletű vegyületnek a karboxil-
csoporton aktivált alkalmas származéka lehet például egy sav-
halogenid, egy savanhidrid, egy aktivált amid, egy aktivált
észter és más, hasonlók. Egy alkalmas, reakcióképes ilyen
származék lehet például egy savklorid; egy savazid; valamely
savval, például egy helyettesített foszforsavval (például
dialkil-foszforsavval, fenil-foszforsavval, difenil-foszfor-
savval, dibenzil-foszforsavval, egy halogénezett foszforsavval és
más, hasonlókkal), dialkil-foszforossavval, kénessavval, tiokén-
savval, kénsavval, egy szulfonsavval (például metán-szulfonsav-
val és más, hasonlókkal), egy alifás karbonsavval (például ecet-
savval, propionsavval, vajsavval, izovajsavval, pivalinsavval,
pentánsavval, izopentánsavval, 2-etil-vajsavval, triklór-ecet-
savval és más, hasonlókkal), vagy egy aromás karbonsavval (pél-
dául benzoésavval és más, hasonlókkal) képzett vegyes anhidrid;

egy szimmetrikus savanhidrid; imidazollal, 4-helyettesített imidazollal, dimetil-pirazollal, triazollal vagy tetrazollal képzett aktivált amid; vagy egy aktivált észter (például ciano-metil-észter, metoxi-metil-észter, dimetil-imino-metil- $-(\text{CH}_3)_2\text{N}=\text{CH}-$ -észter, vinil-észter, etil-észter, propargil-észter, p-nitro-fenil-észter, 2,4-dinitro-fenil-észter, triklór-fenil-észter, pentaklór-fenil-észter, mezil-fenil-észter, fenilazo-fenil-észter, fenil-tioészter, p-nitro-fenil-tioészter, p-krezil-tioészter, karboxi-metil-tioészter, piranil-észter, piridil-észter, piperidil-észter, 8-kinolil-tioészter és más, hasonló), vagy egy N-hidroxi-vegyülettel (például N,N-dimetil-hidroxiil-aminnal, 1-hidroxi-2(1H)-piridonnal, N-hidroxi-szukcinimiddel, N-hidroxi-ftálimiddel, 1-hidroxi-1H-benzotriazollal és más, hasonlókkal) képzett észter. Egy ilyen reakcióképes származékot adott esetben az alkalmazni kívánt (Id) általános képletű vegyület jellege szerint választhatunk meg.

A reakciót általában valamely szokásos oldószerben, például vízben, egy alkoholban (például metanolban, etanolban és más, hasonlóban), acetonban, dioxánban, acetonitrilben, kloroformban, diklór-metánban, diklór-etánban, tetrahidrofuránban, toluolban, etil-acetátban, N,N-dimetil-formamidban, piridinben vagy bármely más, olyan szerves oldószerben végezzük, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra. E szokásos oldószereket vízzel készült elegyeik formájában is használhatjuk. Abban az esetben, ha a bázis és/vagy a kiindulási vegyület cseppfolyós halmazállapotú, akkor ezeket oldószerként is használhatjuk.

Ha e reakcióban az (Id) általános képletű vegyületet

szabad sav vagy ennek sója formájában használjuk, akkor a reakciót előnyösen valamely szokásos, önmagában ismert kondenzálószer jelenlétében végezzük. Ilyen kondenzálószeres példák az N,N-diciklohexil-karbodiimid; N-ciklohexil-N'-morfolino-etil-karbodiimid; N-ciklohexil-N'-(4-dietil-amino-ciklohexil)-karbodiimid; N,N'-dietil-karbodiimid; N,N'-diizopropil-karbodiimid; N-etil-N'-(3-dimetil-amino-propil)-karbodiimid; N,N-karbonil-bisz(2-metil-imidazol); pentametilén-ketén-N-ciklohexil-imin; difenil-ketén-N-ciklohexil-imin; etoxi-acetilén; 1-alkoxi-1-klór-etilén; trialkil-foszfát; etil-polifoszfát; izopropil-polifoszfát; foszfor-oxiklorid (foszforil-klorid); foszfor-triklorid; tionil-klorid; oxalil-klorid; a klór-hangyasav valamely rövidszénláncú alkil-észtere (például klór-hangyasav-etil-észter, klór-hangyasav-izopropil-észter és más, hasonló); trifenil-foszfín; 2-etil-7-hidroxi-benzizoxazólium-só; 2-etil-5-(m-szulfo-fenil)-izoxazólium-hidroxid belső só; 1-(p-klór-benzol-szulfoniloxi)-6-klór-1H-benzotriazol; az úgynevezett Vilsmeier-reagens, amelyet úgy állítunk elő, hogy N,N-dimetil-formamidot tionil-kloriddal, foszfénnel, klór-hangyasav-triklór-metil-észterrel, foszfor-oxikloriddal vagy más, hasonlókkal reagáltatunk; és más, hasonlók.

A reakciót elvégezhetjük egy szervetlen vagy szerves bázis, például egy alkálifém-hidrogén-karbonát, egy tri(rövidszénláncú alkil)-amin, piridin, egy N-(rövidszénláncú alkil)-morfolin, egy N,N-di(rövidszénláncú alkil)-benzil-amin és más, hasonlók jelenlétében is.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a

reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett hajtjuk végre.

d) eljárásváltozat

(D-reakcióvázlat)

Az (Id) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (If) általános képletű vegyületben vagy ennek sójában az R^4_a csoportban szereplő karboxi-védőcsoportot eltávolítjuk.

A hidrolízist előnyösen valamely bázis vagy valamely sav, beleértve a Lewis-savakat is, jelenlétében végezzük el.

Alkalmas bázisok például a szervetlen és szerves bázisok, mint például az alkálifémek (például nátrium, kálium és más, hasonló), ezek hidroxidjai, karbonátjai és hidrogén-karbonátjai, a trialkil-aminok (például trimetil-amin, trietil-amin és más, hasonló), pikolin, 1,5-diazabiciklo/4.3.0/non-5-én, 1,4-diazabiciklo/2.2.2/oktán, 1,8-diazabiciklo/5.4.0/undec-7-én és más, hasonló.

Egy alkalmas sav lehet például egy szerves sav (például hangyasav, ecetsav, propionsav, triklór-ecetsav, trifluor-ecetsav és más, hasonló), vagy egy szervetlen sav (például sósav, bróm-hidrogénsav, kénsav és más, hasonló). A Lewis-sav, mint például egy trihalogén-ecetsav (például triklór-ecetsav, trifluor-ecetsav és más, hasonló) és más, hasonló segítségével végzett védőcsoport-lehasítást előnyösen valamely, a kationokat megkötni képes reagens (például anizol, fenol és más, hasonló) jelenlétében végezzük. A reakciót általában valamely oldószerben, például vízben, egy alkoholban (például metanolban, etanolban és más, hasonlóban), N,N-dimetil-formamidban, diklór-metánban, tetrahidro-

furánban vagy ezek elegyeiben, vagy pedig bármely más, olyan oldószerben hajtjuk végre, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra. Egy cseppfolyós halmazállapotú bázist vagy savat oldószerként is használhatunk. A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett végezzük.

A redukciót valamely szokásos, önmagában ismert módon végezzük, ez lehet például kémiai redukció vagy katalitikus redukció.

A kémiai redukció céljaira használható, alkalmas redukálószeresek például egy fém (például ón, cink, vas és más, hasonló), vagy egy fémes vegyület (például króm(II)-klorid, króm(II)-acetát és más, hasonló), és egy szerves vagy szervetlen sav (például hangyasav, ecetsav, propionsav, trifluor-ecetsav, p-toluol-szulfonsav, sósav, bróm-hidrogénsav és más, hasonló kombinációi).

A katalitikus redukcióhoz használható, alkalmas katalizátorok a szokásos, önmagában ismert katalizátorok, mint például a platina katalizátorok (például platinalemez, platina-szivacs, platinakorom, kolloid platina, platina-oxid, platina-drót és más, hasonló), a palládium katalizátorok (például palládiumszivacs, palládiumkorom, palládium-oxid, csontszemes palládium, kolloid palládium, a bárium-szulfátra lecsapott palládium, a bárium-karbonátra lecsapott palládium és más, hasonló), a nikkel katalizátorok (például redukált nikkel, nikkel-oxid, Raney-nikkel és más, hasonló), a kobalt katalizátorok (például redukált kobalt, Raney-kobalt és más, hasonló), a vas

katalizátorok (például redukált vas, Raney-vas és más, hasonló), a réz katalizátorok (például redukált réz, Raney-réz, Ullman-réz és más, hasonló), és más, hasonló. A redukciót általában valamely olyan, szokásos oldószerben végezzük, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra. Ilyenek például a víz, metanol, etanol, propanol, N,N-dimetil-formamid, tetrahidrofurán és ezek keverékei. Továbbá, ha a kémiai redukció ismertetése során említett savak cseppfolyós halmazállapotúak, ezeket szintén használhatjuk oldószerként is.

E redukció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett hajtjuk végre. Továbbá, ha a kémiai redukció ismertetése során említett savak cseppfolyós halmazállapotúak, ezeket szintén használhatjuk oldószerként is, ezenkívül a katalitikus redukcióhoz használható, alkalmas oldószer lehet valamely, a fentiekben említett oldószer, vagy bármely más, szokásos oldószer, mint például a dietil-éter, dioxán, tetrahidrofurán és más, hasonló, valamint ezek keverékei.

E redukció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett végezzük el.

e) eljárásváltozat

(E-reakcióvázlat)

Az (Ih) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (Ig) általános képletű vegyületben vagy ennek sójában az R^4_D csoportban jelenlevő karboxi-védőcsoportot eltávolítjuk.

A védőcsoport eltávolítását a fentiekben ismertetett d)

eljárásváltozathoz hasonló módon hajtjuk végre, ezért az alkalmazott reagensek és a reakció körülményei (például az oldószer, a reakció hőmérséklete és más, hasonló) tekintetében itt csak utalunk a d) eljárásváltozat ismertetésénél leirtakra.

f) eljárásváltozat

(F-reakcióvázlat)

Az (Ii) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (IV) általános képletű

vegyületet vagy ennek sóját egy (V) általános képletű vegyülettel vagy sójával reagáltatjuk.

E reakciót általában valamely oldószerben, például vízben, egy alkoholban (például metanolban, etanolban és más, hasonlóknban), benzolban, N,N-dimetil-formamidban, tetrahidrofuranban, toluolban, diklór-metánban, diklór-etánban, kloroformban, dietil-éterben vagy bármely más, olyan oldószerben hajtjuk végre, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában melegítés vagy hevítés mellett végezzük.

Abban az esetben, ha a kiindulási vegyület cseppfolyós halmazállapotú, akkor ezt oldószerként is használhatjuk.

g) eljárásváltozat

(G-reakcióvázlat)

Az (Ia) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (VI) általános képletű

vegyületet vagy ennek sóját gyűrűbe zárjuk.

E reakciót általában valamely oldószerben, például vízben, egy alkoholban (például metanolban, etanolban és más, hasonlóknban), benzolban, N,N-dimetil-formamidban, tetrahidrofuránban, toluolban, diklór-metánban, diklór-etánban, kloroformban, dioxánban, dietil-éterben vagy bármely más, olyan oldószerben hajtjuk végre, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra. E szokásos oldószereket vízzel készült elegyeik formájában is alkalmazhatjuk.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett hajtjuk végre.

A reakciót általában egy szervetlen vagy szerves bázis segítségével végezzük, ilyen bázis például egy alkálifém (például nátrium, kálium és más, hasonló), egy alkálifém-hidroxid (például nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid és más, hasonló), egy alkálifém-hidrogén-karbonát (például nátrium-hidrogén-karbonát, kálium-hidrogén-karbonát és más, hasonló), egy alkálifém-karbonát (például nátrium-karbonát, kálium-karbonát és más, hasonló), egy tri(rövidszénláncú alkil)-amin (például trimetil-amin, trietil-amin, diizopropil-etil-amin és más, hasonló), egy alkálifém-hidrid (például nátrium-hidrid és más, hasonló), egy alkálifém rövidszénláncú alkoholátja (például nátrium-metilát, nátrium-etilát és más, hasonló), egy piridin bázis (például piridin, lutidin, pikolin, dimetil-amino-piridin és más, hasonló), egy N-(rövidszénláncú alkil)-morfolin, egy N,N-di(rövidszénláncú alkil)-benzil-amin, egy N,N-di(rövid-

szénláncú alkil)-anilin és más, hasonlók.

Abban az esetben, ha a bázis és/vagy a kiindulási vegyület cseppfolyós halmazállapotú, akkor ezeket oldószerként is használhatjuk.

h) eljárásváltozat

(H-reakcióvázlat)

Az (Ij) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (Ia) általános képletű vegyületet vagy ennek sóját halogénezzük.

E halogénezést általában valamely szokásos, önmagában ismert halogénezőszerszerrel végezzük, ilyen halogénezőszerszer például egy elemi halogén (például az elemi klór, elemi bróm és más, hasonlók), a foszfor-trihalogenidek (például foszfor-tribromid, foszfor-triklorid és más, hasonlók), a foszfor-pentahalogenidek (például foszfor-pentaklorid, foszfor-pentabromid és más, hasonlók), foszfor-oxiklorid (például foszfor-triklorid, foszfor-monoklorid és más, hasonlók), a tionil-halogenidek (például tionil-klorid, tionil-bromid és más, hasonlók), az oxalil-halogenidek (például oxalil-klorid, oxalil-bromid és más, hasonlók), és más, hasonlók.

E reakciót általában valamely oldószerben, például vízben, egy alkoholban (például metanolban, etanolban, izopropanolban és más, hasonlókban), benzolban, dioxánban, N,N-dimetil-formamidban, tetrahydrofuranban, diklór-metánban, diklór-etánban, kloroformban, dietil-éterben vagy bármely más, olyan oldószerben hajtjuk végre, amely nem gyakorol káros be-

folyást a reakcióra.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett végezzük.

Ha a kiindulási vegyület cseppfolyós halmazállapotú, akkor ezt oldószerként is használhatjuk.

i) eljárásváltozat

(I-reakcióvázlat)

Az (II) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (Ik) általános képletű vegyületet vagy ennek sóját egy (VII) általános képletű vegyülettel vagy sójával reagáltatjuk.

E reakciót általában valamely oldószerben, például vízben, egy alkoholban (például metanolban, etanolban és más, hasonlóknak), benzolban, N,N-dimetil-formamidban, tetrahidrofuranban, toluolban, diklór-metánban, diklór-etánban, kloroformban, dietil-éterben vagy bármely más, olyan oldószerben hajtjuk végre, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában melegítés vagy hevítés mellett végezzük.

Abban az esetben, ha a kiindulási vegyület cseppfolyós halmazállapotú, akkor ezt oldószerként is használhatjuk.

j) eljárásváltozat, 1. lépés

(J-reakcióvázlat)

Az (Im) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (Ik) általános képletű vegyületet vagy ennek sóját egy (VIII) általános képletű vegyülettel vagy sójával reagáltatjuk.

E reakciót általában valamely oldószerben, például vízben, egy alkoholban (például metanolban, etanolban és más, hasonlóknban), benzolban, N,N-dimetil-formamidban, tetrahidrofuranban, toluolban, diklór-metánban, acetonban, diklór-etánban,

kloroformban, dietil-éterben vagy bármely más, olyan oldószerben hajtjuk végre, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés közben végezzük.

j) eljárásváltozat, 2. lépés

(J-reakcióvázlat)

Az (In) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (Im) általános képletű vegyületben vagy sójában szereplő merkaptó-védőcsoportot lehasítjuk.

Ezt a védőcsoport lehasítást a fentiekben ismertetett d) eljárásváltozathoz hasonló módon hajtjuk végre, ezért az alkalmazott reagensek és a reakció körülményei (például az oldószer, a reakció hőmérséklete és más, hasonlókn) tekintetében itt csak utalunk a d) eljárásváltozat ismertetésénél leirtakra.



k) eljárásváltozat

(K-reakcióvázlat)

Az (Io) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (Ik) általános képletű vegyületet vagy ennek sóját egy (IX) általános képletű vegyülettel vagy ennek sójával reagáltatjuk.

E reakciót általában valamely oldószerben, például vízben, egy alkoholban (például metanolban, etanolban és más,

hasonlókban), benzolban, N,N-dimetil-formamidban, tetrahidrofuranban, toluolban, diklór-metánban, diklór-etánban, kloroformban, dietil-éterben vagy bármely más, olyan oldószerben hajtjuk végre, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett végezzük.

l) eljárásváltozat

(L-reakcióvázlat)

Az (Iq) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (Ip) általános képletű vegyületet vagy ennek sóját redukáljuk.

A redukciót valamely szokásos, önmagában ismert módon végezzük, ez lehet például kémiai redukció vagy katalitikus redukció.

A kémiai redukció céljaira használható, alkalmas redukálószeres példák például a hidridek (például hidrogén-jodid, hidrogén-



-szulfid, litium-aluminium-hidrid, nátrium-bór-hidrid, nátrium-ciano-bór-hidrid és más, hasonló), továbbá egy fém (például ón, cink, vas és más, hasonló), vagy egy fémes vegyület (például króm(II)-klorid, króm(II)-acetát és más, hasonló), és egy szerves vagy szervetlen sav (például hangyasav, ecetsav, propionsav, trifluor-ecetsav, p-toluol-szulfonsav, sósav, bróm-hidrogénsav és más, hasonló) kombinációi.

A katalitikus redukcióhoz használható, alkalmas katalizátorok a szokásos, önmagában ismert katalizátorok, mint például a platina katalizátorok (például platinalemez, platina-szivacs, platinakorom, kolloid platina, platina-oxid, platina-drót és más, hasonló), a palládium katalizátorok (például palládiumszivacs, palládiumkorom, palládium-oxid, csontszenes palládium, kolloid palládium, a bárium-szulfátra lecsapott palládium, a bárium-karbonátra lecsapott palládium és más, hasonló), a nikkel katalizátorok (például redukált nikkel, nikkel-oxid, Raney-nikkel és más, hasonló), a kobalt katalizátorok (például redukált kobalt, Raney-kobalt és más, hasonló), a vas katalizátorok (például redukált vas, Raney-vas és más, hasonló), a réz katalizátorok (például redukált réz, Raney-réz, Ullman-réz és más, hasonló), és más, hasonló.

A redukciót általában valamely szokásos, olyan oldószerben hajtjuk végre, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra, ilyenek például a víz, az alkoholok (például metanol, etanol, propanol és más, hasonló), tetrahydrofuran, dioxán, N,N-dimetil-formamid és ezek keverékei.

Továbbá, abban az esetben, ha a kémiai redukció cél-

jaira használható, fent említett savak bármelyike cseppfolyós halmazállapotú, akkor ezt oldószerként is használhatjuk.

Ezenkívül, a katalitikus redukcióhoz használható, alkalmas oldószer lehet valamely, a fentiekben említett oldószer, továbbá egyéb oldószerek, mint például a dietil-éter, dioxán, tetrahydrofuran és más, hasonló, valamint ezek keverékei.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés közben végezzük.

mi eljárásváltozat

(~~M~~-reakcióvázlat)

Az (Ir) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (Iq) általános képletű vegyületet vagy az aminocsoporton aktivált származékát vagy sóját acilezzük.

A jelen acilezési reakcióhoz használható, alkalmas acilezőszer például egy (XXI) általános képletű, ahol R^{II} jelentése acilcsoport, vegyület, ennek reakcióképes származéka, vagy sója.

Egy (Iq) általános képletű vegyületnek az aminocsoporton aktivált, alkalmas származéka lehet például egy Schiff-bázis típusu imino-vegyület vagy ennek tautomerje, az enamintípusu izomerje, amelyet egy (Iq) általános képletű vegyület és egy karbonil-vegyület, például egy aldehid, keton vagy más, hasonló reakciója útján állítunk elő; egy szilil-származék, amelyet úgy állítunk elő, hogy egy (Iq) általános képletű vegyületet

egy szilil-vegyülettel, például N,O-bisz(trimetil-szilil)-acetamid-
amiddel, N-trimetil-szilil-acetamiddel vagy más, hasonlókkal rea-
gáltatunk; vagy egy olyan származék, amelyet az (Iq) általános
képletű vegyület és foszfor-triklorid vagy foszgén vagy más, ha-
sonlók reagáltatása útján állítunk elő.

Egy (XXI) általános képletű vegyület alkalmas, reak-
cióképes származéka lehet például egy savhalogenid, egy savan-
hidrid, egy aktivált amid, egy aktivált észter, egy izocianát és
más, hasonlók. Egy alkalmas, reakcióképes ilyen származék lehet
például egy savklorid; egy savazid; valamely savval, például egy
helyettesített foszforsavval (például dialkil-foszforsavval, fe-
nil-foszforsavval, difenil-foszforsavval, dibenzil-foszforsav-
val, egy halogénezett foszforsavval és más, hasonlókkal), dial-
kil-foszforsavval, kénessavval, tiokénsavval, egy alkán-szul-
fonsavval (például metán-szulfonsavval, etán-szulfonsavval és
más, hasonlókkal), kénsavval, egy alkil-szénsavval, egy alifás
karbonsavval (például pivalinsavval, pentánsavval, izopentán-
savval, 2-etil-vajsavval vagy triklór-ecetsavval és más, hason-
lókkal), vagy egy aromás karbonsavval (például benzoesavval és
más, hasonlókkal) képzett vegyes anhidrid; egy szimmetrikus sav-
anhidrid; imidazollal, 4-helyettesített imidazollal, dimetil-
pirazollal, triazollal vagy tetrazollal képzett, aktivált amid;
vagy egy aktivált észter (például ciano-metil-észter, metoxi-me-
til-észter, dimetil-imino-metil-/(CH₃)₂N=CH-/-észter, vinil-
észter, propargil-észter, p-nitro-fenil-észter, 2,4-dinitro-
fenil-észter, triklór-fenil-észter, pentaklór-fenil-észter,
mezil-fenil-észter, fenilazo-fenil-észter, fenil-tioészter,

p-nitro-fenil-tioészter, p-krezil-tioészter, karboxi-metil-tioészter, piranil-észter, piridil-észter, piperidil-észter, 8-kinolil-tioészter és más, hasonló), vagy egy N-hidroxi-vegyülettel (például N,N-dimetil-hidroxil-aminnal, 1-hidroxi-2(1H)-piridonnal, N-hidroxi-szukcinimiddal, N-hidroxi-benzotriazollal, N-hidroxi-ftálimiddal, 1-hidroxi-6-klór-1H-benzotriazollal és más, hasonlókkal) képzett észter; helyettesített vagy helyettesítetlen aril-izocianát; helyettesített vagy helyettesítetlen aril-izotiocianát és más, hasonló. Az ilyen reakcióképes származékokat adott esetben az alkalmazni kívánt (XXI) általános képletű vegyület jellege szerint választhatunk meg.

A reakciót általában valamely szokásos oldószerben, például vízben, acetonban, dioxánban, acetonitrilben, kloroformban, diklór-metánban, diklór-etánban, tetrahidrofuránban, etil-acetátban, N,N-dimetil-formamidban, piridinben vagy bármely más, olyan szerves oldószerben végezzük, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra. E szokásos oldószereket vízzel készült elegyeik formájában is használhatjuk.

Ha e reakcióban a XXI) általános képletű vegyületet szabad sav vagy ennek sója formájában használjuk, akkor a reakciót előnyösen valamely szokásos, önmagában ismert kondenzálószer jelenlétében végezzük. Ilyen kondenzálószer példaként az N,N-diciklohexil-karbodiimid; N-ciklohexil-N'-morfolino-etil-karbodiimid; N-ciklohexil-N'-(4-diethyl-amino-ciklohexil)-karbodiimid; N,N'-diethyl-karbodiimid; N,N'-diizopropil-karbodiimid; N-ethyl-N'-(3-dimetil-amino-propil)-karbodiimid; N,N-kar-

bonil-bisz(2-metil-imidazol); pentametilén-ketén-N-ciklohexil-
 -imin; difenil-ketén-N-ciklohexil-imin; etoxi-acetilén; 1-
 -alkoxi-1-klór-etilén; trialkil-foszfit; etil-polifoszfát; izo-
 propil-polifoszfát; foszfor-oxiklorid (foszforil-klorid);
 foszfor-triklorid; tionil-klorid; oxalil-klorid; a klór-
 -hangyasav valamely rövidszénláncú alkil-észtere (például klór-
 -hangyasav-etil-észter, klór-hangyasav-izopropil-észter és más,
 hasonló); trifenil-foszfin; 2-etil-7-hidroxi-benzizoxazólium-
 só; 2-etil-5-(m-szulfo-fenil)-izoxazólium-hidroxid belső só;
 1-(p-klór-benzol-szulfoniloxi)-6-klór-1H-benzotriazol; az ugy-
 nevezett Vilsmeier-reagens, amelyet úgy állítunk elő, hogy N,N-
 -dimetil-formamidot tionil-kloriddal, foszgénnel, klór-hangya-
 sav-triklór-metil-észterrel, foszfor-oxikloriddal vagy más, ha-
 sonlókkal reagáltatunk; és más, hasonlók.

A reakciót elvégezhetjük egy szervetlen vagy szerves
 bázis, például egy alkálifém-hidrogén-karbonát, egy tri(rövid-
 szénláncú alkil)-amin, piridin, egy N-(rövidszénláncú alkil)-
 -morfolin, egy N,N-di(rövidszénláncú alkil)-benzil-amin és más,
 hasonlók jelenlétében is.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a
 reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett hajtjuk végre.

n) eljárásváltozat

(N-reakcióvázlat)

A (IIb) általános képletű vegyületeket és ezek sóit
 úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (IIa) általános képletű
 vegyületet vagy ennek sóját egy (X) általános képletű ve-

gyülettel vagy ennek sójával reagáltatjuk.

E reakciót általában valamely szokásos oldószerben, például egy alkoholban (például metanolban, etanolban, etilén-glikolban és más, hasonlóknban), kloroformban, dietil-éterben, tetrahidrofuránban, benzolban, N,N-dimetil-formamidban, N,N-dimetil-acetamidban vagy bármely más, olyan oldószerben hajtjuk végre, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett végezzük.

A reakciót általában egy szervetlen vagy szerves bázis jelenlétében végezzük, ilyen bázis például egy alkálifém-hidroxid, egy alkálifém-hidrogén-karbonát, egy alkálifém-karbonát, egy alkálifém-hidrid (például nátrium-hidrid és más, hasonlókn), egy alkálifém-acetát, egy tri(rövidszénláncú alkil)-amin, egy piridin bázis (például piridin, lutidin, pikolin, dimetil-amino-piridin és más, hasonlókn), egy N-(rövidszénláncú alkil)-morfolin, egy N,N-di(rövidszénláncú alkil)-benzil-amin, egy N,N-di(rövidszénláncú alkil)-anilin és más, hasonlókn.

Abban az esetben, ha a bázis és/vagy a kiindulási vegyület cseppfolyós halmazállapotú, akkor ezeket oldószerként is használhatjuk.

o) eljárásváltozat

(O-reakcióvázlat)

A (III) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (XI) általános képletű

vegyületet vagy ennek sóját egy (XII) általános képletű vegyülettel vagy ennek sójával reagáltatjuk.

A reakciót általában valamely szokásos oldószerben, például egy alkoholban (például metanolban, etanolban, etilén-glikolban és más, hasonlóknak), kloroformban, dietil-éterben, tetrahidrofuranban, benzolban, hexánban, vagy bármely más, olyan szerves oldószerben hajtjuk végre, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett végezzük.

A reakciót általában egy szervetlen vagy szerves bázis jelenlétében végezzük, ilyen bázis például egy alkálifém-hidroxid, egy alkálifém-hidrogén-karbonát, egy alkálifém-karbonát, egy alkálifém-acetát, egy tri(rövidszénláncú alkil)-amin, egy rövidszénláncú alkil-alkálifém (például n-butil-lítium és más, hasonlóknak), egy piridin bázis (például piridin, lutidin, pikolin, dimetil-amino-piridin és más, hasonlóknak), egy N-(rövidszénláncú alkil)-morfolin, egy N,N-di(rövidszénláncú alkil)-benzil-amin, egy N,N-di(rövidszénláncú alkil)-anilin és más, hasonlóknak.

Abban az esetben, ha a bázis és/vagy a kiindulási vegyület cseppfolyós halmazállapotú, akkor ezeket oldószerként is használhatjuk.

p) eljárásváltozat

(P-reakcióvázlat)

A (XV) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (XIII) általános képletű vegyületet vagy ennek sóját egy (XIV) általános képletű vegyülettel vagy ennek sójával reagáltatjuk.

E reakciót általában valamely oldószerben, például vízben, egy alkoholban (például metanolban, etanolban és más, hasonlókban), benzolban, N,N-dimetil-formamidban, tetrahidrofuránban, toluolban, diklór-metánban, diklór-etánban, kloroformban, dioxánban, dietil-éterben vagy bármely más, olyan oldószerben hajtjuk végre, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra. E szokásos oldószereket vízzel képzett elegyeik formájában is alkalmazhatjuk.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett végezzük.

A reakciót általában egy szervetlen vagy szerves bázis jelenlétében végezzük, ilyen bázis például egy alkálifém (például nátrium, kálium és más, hasonlók), egy alkálifém-hidroxid (például nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid és más, hasonlók), egy alkálifém-hidrogén-karbonát (például nátrium-hidrogén-karbonát, kálium-hidrogén-karbonát és más, hasonlók), egy alkálifém-karbonát (például nátrium-karbonát, kálium-karbonát és más, hasonlók), egy tri(rövidszénláncú alkil)-amin (például trimetil-amin, trietil-amin, diizopropil-etil-amin és más, hasonlók), egy alkálifém-hidrid (például nátrium-hidrid és más, hasonlók), egy alkálifém rövidszénláncú alkoholátja (például nátrium-metilát, nátrium-etilát és más, hasonlók), egy piridin bázis (például piridin, lutidin, pikolin, dimetil-amino-piridin és más,

hasonlók), egy N-(rövidszénláncú alkil)-morfolin, egy N,N-di(rövidszénláncú alkil)-benzil-amin, egy N,N-di(rövidszénláncú alkil)-anilin és más, hasonló.

Abban az esetben, ha a bázis és/vagy a kiindulási vegyület cseppfolyós halmazállapotú, akkor ezeket oldószerként is alkalmazhatjuk.

g) eljárásváltozat

(Q-reakcióvázlat)

A (XVIb) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (XV) általános képletű vegyületet vagy ennek sóját redukáljuk.

E reakciót az 5. példával szemléltetett módon vagy valamely más, hasonló módon hajthatjuk végre.

r) eljárásváltozat

(R-reakcióvázlat)

A (II) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (XVIa) általános képletű vegyületet vagy ennek sóját egy (XVII) általános képletű vegyülettel vagy ennek sójával reagáltatjuk.

E reakciót általában valamely oldószerben, például vízben, egy alkoholban (például metanolban, etanolban és más, hasonlóknban), benzolban, N,N-dimetil-formamidban, tetrahidro-

furánban, toluolban, diklór-metánban, diklór-etánban, kloroformban, dioxánban, dietil-éterben vagy bármely más, olyan oldószerben hajtjuk végre, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra. E szokásos oldószereket vízzel képzett elegyeik formájában is alkalmazhatjuk.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett végezzük.

A reakciót általában egy szervetlen vagy szerves bázis jelenlétében végezzük, ilyen bázis például egy alkálifém (például nátrium, kálium és más, hasonló), egy alkálifém-hidroxid (például nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid és más, hasonló), egy alkálifém-hidrogén-karbonát (például nátrium-hidrogén-karbonát, kálium-hidrogén-karbonát és más, hasonló), egy alkálifém-karbonát (például nátrium-karbonát, kálium-karbonát és más, hasonló), egy tri(rövidszénláncú alkil)-amin (például trimetil-amin, trietil-amin, diizopropil-etil-amin és más, hasonló), egy alkálifém-hidrid (például nátrium-hidrid és más, hasonló), egy alkálifém rövidszénláncú alkoholátja (például nátrium-metilát, nátrium-etilát és más, hasonló), egy piridin bázis (például piridin, lutidin, pikolin, dimetil-amino-piridin és más, hasonló), egy N-(rövidszénláncú alkil)-morfolin, egy N,N-di(rövidszénláncú alkil)-benzil-amin, egy N,N-di(rövidszénláncú alkil)-anilin és más, hasonló.

Abban az esetben, ha a bázis és/vagy a kiindulási vegyület cseppfolyós halmazállapotú, akkor ezeket oldószerként is alkalmazhatjuk.

s) eljárásváltozat

(S-reakcióvázlat)

A (VI) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (XVIc) általános képletű vegyületet, ennek reakcióképes származékát vagy sóját egy (XVIII) általános képletű vegyülettel, ennek reakcióképes származékával vagy ennek sójával reagáltatjuk.

Egy (XVIc) általános képletű vegyület alkalmas, reakcióképes származéka lehet például egy Schiff-bázis típusu imino-vegyület vagy ennek tautomerje, az enamín típusu izomerje, amelyet egy (XVIc) általános képletű vegyület és egy karbonil-vegyület, például egy aldehid, keton vagy más, hasonlók reakciója útján állítunk elő; egy szilil-származék, amelyet úgy állítunk elő, hogy egy (XVIc) általános képletű vegyületet egy szilil-vegyülettel, például bisz(trimetil-szilil)-acetamiddal, mono(trimetil-szilil)-acetamiddal /például N-(trimetil-szilil)-acetamiddal/, bisz(trimetil-szilil)-karbamiddal vagy más, hasonlókkal reagáltatunk; vagy egy olyan származék, amelyet a (XVIc) általános képletű vegyület és foszfor-triklorid vagy foszgén, vagy más, hasonlók reagáltatása útján állítunk elő.

Egy (XVIII) általános képletű vegyület alkalmas, reakcióképes származéka lehet például valamely szokásos ilyen származék, mint például egy savhalogenid, egy savanhidrid, egy aktivált amid, egy aktivált észter és más, hasonlók.

Egy alkalmas, reakcióképes ilyen származék lehet például egy savklorid; egy savazid; valamely savval, például egy helyettesített foszforsavval (például dialkil-foszforsavval, fe-

nil-foszforsavval, difenil-foszforsavval, dibenzil-foszforsavval, egy halogénezett foszforsavval és más, hasonlókkal), dialkil-foszforossavval, kénessavval, tiokénsavval, kénsavval, egy szulfonsavval (például metán-szulfonsavval és más, hasonlókkal), egy alifás karbonsavval (például ecetsavval, propionsavval, vajsavval, izovajsavval, pivalinsavval, pentánsavval, izopentánsavval, 2-etil-vajsavval, triklór-ecetsavval és más, hasonlókkal), vagy egy aromás karbonsavval (például benzoesavval és más, hasonlókkal) képzett vegyes anhidrid; egy szimmetrikus sav-anhidrid; imidazollal, 1-hidroxi-1H-benzotriazollal, 4-helyettesített imidazollal, dimetil-pirazollal, triazollal vagy tetrazollal képzett, aktivált amid; vagy egy aktivált észter (például ciano-metil-észter, metoxi-metil-észter, dimetil-imino-metil-/ $(\text{CH}_3)_2\text{N}=\text{CH}$ -/észter, vinil-észter, propargil-észter, p-nitro-fenil-észter, 2,4-dinitro-fenil-észter, triklór-fenil-észter, pentaklór-fenil-észter, mezil-fenil-észter, fenilazo-fenil-észter, fenil-tioészter, p-nitro-fenil-tioészter, p-krezil-tioészter, benzotiazolil-tioészter, karboxi-metil-tioészter, piranil-észter, piridil-észter, piperidil-észter, 8-kinolil-tioészter és más, hasonlók), vagy egy N-hidroxi-vegyülettel (például N,N-dimetil-hidroxil-aminnal, 1-hidroxi-2(1H)-piridonnal, N-hidroxi-szukcinimiddal, N-hidroxi-ftálimiddal, 1-hidroxi-1H-benzotriazollal és más, hasonlókkal) képzett észter. Egy ilyen reakcióképes származékot adott esetben az alkalmazni kívánt (XVIII) általános képletű vegyület jellege szerint választhatunk meg.

A reakciót általában valamely szokásos oldószerben,

például vízben, egy alkoholban (például metanolban, etanolban és más, hasonlóknban), acetonban, dioxánban, acetonitrilben, kloroformban, diklór-metánban, diklór-etánban, tetrahidrofuránban, etil-acetátban, N,N-dimetil-formamidban, piridinben vagy bármely más, olyan szerves oldószerben hajtjuk végre, amely nem gyakorol káros befolyást a reakcióra. E szokásos oldószereket vízzel képzett elegyeik formájában is használhatjuk.

Ha e reakcióban a (XVIII) általános képletű vegyületet szabad sav vagy ennek sója formájában használjuk, akkor a reakciót előnyösen valamely szokásos, önmagában ismert kondenzálószer jelenlétében végezzük. Ilyen kondenzálószeres példák az N,N-diciklohexil-karbodiimid; N-ciklohexil-N'-morfolino-etil-karbodiimid; N-ciklohexil-N'-(4-dietyl-amino-ciklohexil)-karbodiimid; N,N'-dietyl-karbodiimid; N,N'-diizopropil-karbodiimid; N-etyl-N'-(3-dimetil-amino-propil)-karbodiimid; N,N-karbonil-bisz(2-metil-imidazol); pentametilén-ketén-N-ciklohexil-imin; difenil-ketén-N-ciklohexil-imin; etoxi-acetilén; 1-alkoxi-1-klór-etylén; trialkil-foszfit; etil-polifoszfat; izopropil-polifoszfat; foszfor-oxiklorid (foszforil-klorid); foszfor-triklorid; tionil-klorid; oxalil-klorid; a klór-hangyasav valamely rövidszénláncú alkil-észtere (például klór-hangyasav-etyl-észter, klór-hangyasav-izopropil-észter és más, hasonló); trifenil-foszfin; 2-etyl-7-hidroxi-benzizoxazólium-só; 2-etyl-5-(m-szulfo-fenil)-izoxazólium-hidroxiid belső só; 1-(p-klór-benzol-szulfoniloxi)-6-klór-1H-benzotriazol; az úgynevezett Vilsmeier-reagens, amelyet úgy állítunk elő, hogy N,N-

-dimetil-formamidot tionil-kloriddal, foszgénnel, klór-hangyasav-triklór-metil-észterrel, foszfor-oxikloriddal vagy más, hasonlókkal reagáltatunk; és más, hasonlók.

A reakciót elvégezhetjük egy szervetlen vagy szerves bázis, például egy alkálifém-hidrogén-karbonát, egy tri(rövidszénláncú alkil)-amin, piridin, egy N-(rövidszénláncú alkil)-morfolin, egy N,N-di(rövidszénláncú alkil)-benzil-amin és más, hasonlók jelenlétében is.

A reakció hőmérséklete nem döntő jelentőségű, és a reakciót általában hűtés vagy melegítés mellett hajtjuk végre.

t) eljárásváltozat

(T-reakcióvázlat)

A (XV) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (XIX) általános képletű vegyületet vagy ennek sóját egy (XX) általános képletű vegyülettel vagy ennek sójával reagáltatjuk.

E reakciót a 9. példával szemléltetett módon, vagy valamely más, hasonló módon végezhetjük el.

u) eljárásváltozat

(U-reakcióvázlat)

A (XVIIIa) általános képletű vegyületeket és ezek sóit úgy állíthatjuk elő, hogy valamely (XXII) általános képletű vegyületről vagy ennek sójáról lehasítjuk a karboxi-védőcsoportot.

E reakciót a 11. példával szemléltetett módon, vagy valamely más, hasonló módszerrel végezhetjük el.

A jelen találmány szerinti vegyületek alkalmas sói, továbbá az a) - u) eljárásváltozatokban alkalmazott kiindulási vegyületeknek és ezek reakcióképes származékainak alkalmas sói ugyanolyanok lehetnek, mint amelyeket az (I) általános képletű vegyületek esetében példaképpen megadtunk.

A jelen találmány szerinti (I) általános képletű új kinolin-származékoknak és gyógyászatilag elfogadható sóiknak erős immunmoduláló hatásuk (például az autoantitestek termelését gátló hatásuk és más, hasonló hatásuk), gyulladáscsökkentő hatásuk és rákellenes hatásuk van, és ezáltal e vegyületeket immunmoduláló szerként (például az autoantitestek termelését gátló és más, hasonló hatású szerekként), gyulladáscsökkentő szerekként és rákellenes szerekként használhatjuk.

Ennek megfelelően, az (I) általános képletű új kinolin-származékokat és gyógyászatilag elfogadható sóikat embereken és állatokon gyulladásos állapotok, a fájdalom különféle formái, kollagén betegségek, autoimmun betegségek, különféle immunológiai betegségek, rák (például tüdőrák, gyomorrák, vastagbél rák, veserák, májrák és más, hasonló), és más, hasonló kezelésére és/vagy megelőzésére használhatjuk. Részletesebben, e vegyületeket az ízületek és izmok gyulladása és fájdalma (például reumás ízületi gyulladás, reumás csigolyagyulladás, csont- és ízületi gyulladás, köszvényes ízületi gyulladás és más, hasonló); a bőr gyulladásos állapotai (például napozás okozta leégés, ekcéma és más, hasonló), a szem gyulladásos állapotai (például kötőhártyagyulladás és más, hasonló), a tüdő gyulladásos megbetegedései

(például asztma, hörghurut, a galambtenyésztők tüdőbetegsége, a farmerek tüdőbetegsége és más, hasonló); a gyomor- és bélrendszer gyulladással járó állapotai /például aftás fekély, Crohn-kór, atrófiás gyomorhurut, gastritis varialoforme (a gyomorhurut különféle formái), fekélyes vastagbél gyulladás, coeliákia, tájéki csipőbélgyulladás, bél-tulérzékenységi tünetegyüttes és más, hasonló/, fogínygyulladás (sebészeti műtétet követő gyulladás, fájdalom vagy duzzanat), lázas állapot, a gyulladással kapcsolatos fájdalom és egyéb állapotok, szövetátültetés után az átültetett szövet kilökődése, szisztémás lupus erythematosus, scleroderma (a bőr megkeményedése), kiterjedt izomgyulladás, kiterjedt porcgyulladás, az artériák körüli csomós gyulladás, ízületmerevedéssel járó csigolyabántalom, a vesék idült gyulladással járó állapota (például glomerulonephritis, membrán nephritis és más, hasonló), reumás láz, Sjögren-tünetegyüttes, Behcet-kór, pajzsmirigy-gyulladás, I típusú cukorbetegség, dermatomyositis (a bőr és az alatta levő izmok kollagén betegsége), idült aktív májgyulladás, súlyos izomgyengeség, spontán trópusi zsirszéklet, Grave-kór, multiple sclerosis (általános elmeszesedés), elsődleges epe-cirrózis, Reiter-tünetegyüttes, a vérösszetételének autoimmun eredetű rendellenességei (például Crosby-tünetegyüttes, tisztán a vörösvértestek hiányából fakadó vérszegénység, elsődleges vérlemezkeszám-csökkenés, rendellenes fejlődésből eredő vérszegénység és más, hasonló), a szem üvegtestjének gyulladása, fertőző bőrgyulladás, pikkelysömör, Kawasaki-kór, sarcoidosis, Wegner-granulomatosis, Hodgkin-kór, rák (például tüdőrák, gyomorrák, vastagbél rák, veserák, májrák és

más, hasonló), és más, hasonló kezelésére és/vagy megelőzésére használhatjuk.

A jelen találmány szerinti (I) általános képletű kinolin-származékok és gyógyászatilag elfogadható sóik hasznosságának szemléltetése céljából az alábbiakban megadjuk néhány jellemző (I) általános képletű kinolin-származék farmakológiai vizsgálati eredményét.

Az anti-dezoxi-ribonukleinsav antitest termelés és a fehérje-vizelés gátlása

1. VIZSGÁLATI MÓDSZER

A vizsgálathoz 6 hetes (57BL/6 x DBA/2) F_1 és DBA/2 törzsbeli, nőstény egereket használunk. Az (57BL/6 x DBA/2) F_1 egereken graft-versus-host (idegen szövet által a gazdaszervezetben okozott) betegséget hozunk létre oly módon, hogy az állatokba kétszer, 5 napos időbeli eltéréssel DBA/2 lépsejteket injektálunk. Mindkét alkalommal 5×10^7 sejtet viszünk be. Három nappal a második sejt-injekció után elkezdjük a hatóanyagot adagolni, mégpedig 8 héten át napi egyszeri orális (szájon át adott) dózisban.

Az autoimmun betegség jellemzésére 4 héttel az utolsó sejt-injekció után az anti-(egyszálas dezoxi-ribonukleinsav) antitesteket ELISA (enzyme-linked immunosorbent assay, enzimhez kötött immunszorbens meghatározási) módszerrel, a T. Fujitsu

és munkatársai /International J. Immunopharmacol, 8, 897. (1986)/
mérjük. A vesebetegség súlyosságának megállapítása céljából 8
héttel az utolsó sejt-injekció után meghatározzuk a fehérjevi-
zelés mértékét. A szérum albumin koncentrációját a vizeletben
egyszeri radiális (sugárirányu) immundiffúziós módszerrel mér-
jük, nyul anti-(egér szérum albumin) antiszérumot használva.
Csoportonként 10 egeret használunk. A hatóanyag aktivitását az
anti-dezoxi-ribonukleinsav antitest termelés és a fehérjevizelés
százalékos gátlásával jellemezzük.

2. VIZSGÁLT VEGYÜLET

1-Metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-
-metil-szulfinil-1,2-dihidro-kinolin

3. VIZSGÁLATI EREDMÉNY

Dózis (mg/kg)	G á t l á s (%)	
	Anti-DNS antitest	Fehérjevizelés
100	68*	100*

* = Szignifikánsan eltér a kontrollcsoporttól, $p < 0,01$.

B16 melanoma metasztázisok (áttételek) gátlása

1. VIZSGÁLATI MÓDSZER

A kísérletet az alábbiakban példaképpen megadott kísér-

leti ütemterv szerint végezzük.

8 hetes, C57BL/6 törzsbeli, nőstény egereknek a 0. napon egér B16 melanoma sejteket (5×10^5 sejt) adunk be intravénás injekció formájában.

A 16. napon az állatokat leöljük, és a tüdejükben található rákos sejttelések számát metszetvizsgáló mikroszkóp alatt megszámláljuk.

A vizsgált vegyületet naponta egyszer, orálisan adjuk be.

A vizsgált vegyületeknek a daganatra kifejtett hatását a sejttelések számának a kontrollhoz viszonyított értékével jellemezzük.

A kísérleti ütemtervet az 1. ábrán mutatjuk be.

2. VIZSGÁLT VEGYÜLET

1-Metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

3. VIZSGÁLATI EREDMÉNY

Dózis (mg/kg)	Gátlás (%)
10	34*
100	63

* = Szignifikánsan különbözik a kontrollcsoporttól,

$p < 0,01$.

Gyógyászati célokra a jelen találmány szerinti (I) általános képletű vegyületeket és gyógyászatilag elfogadható sóikat a szokásos, önmagában ismert gyógyászati készítmények formájában alkalmazzuk, amely készítményekben a hatóanyag valamely szokásos, önmagában ismert, gyógyászatilag elfogadható vivőanyag, például egy szerves vagy szervetlen, szilárd vagy cseppfolyós halmazállapotú, orális, parenterális vagy külsőleges adagolásra alkalmas töltőanyag kíséretében van jelen. Egy ilyen gyógyászati készítményt elkészíthetünk szilárd formában, ilyenek például a granulátum, kapszula, tablettá, drázsé és a kup, vagy a készítmény lehet cseppfolyós halmazállapotú is, mint például egy oldat, injekciós szuszpenzió vagy emulzió, szájon át beadandó oldat, szemcsepp és más, hasonló. Szükség esetén e készítmények tartalmazhatnak segédanyagokat is, így például stabilizálószereket, nedvesítőszereket, emulgeálószereket, pufferanyagokat vagy bármely más, szokásosan alkalmazott adalékanyagot.

A hatóanyagot általában 0,01 mg/kg és 500 mg/kg közötti dózisegységben alkalmazzuk, előnyösen naponta 1 - 4 alkalommal, 0,01 mg/kg és 10 mg/kg közötti mennyiségben. A fenti dózist növelhetjük vagy csökkenthetjük, azonban a beteg életkorától, testtömegétől és állapotától, továbbá az adagolás módjától függően.

Előnyös (I) általános képletű vegyületek azok, amelyekben

R¹ jelentése rövidszénláncú alkilcsoport vagy adott eset-

- ben egy vagy több alkalmas csoporttal helyettesített fenilcsoport (még előnyösebben adott esetben halogén-atommal helyettesített fenilcsoport; legelőnyösebben fenilcsoport vagy halogén-fenil-csoport),
- R^2 jelentése hidroxilcsoport, védett hidroxilcsoport (még előnyösebben aciloxicssoport), rövidszénláncú alkoxilcsoport, halogénatom, aminocsoport, rövidszénláncú alkil-amino-csoport, védett aminocsoport (még előnyösebben acil-amino-csoport), merkaptocsoport vagy védett merkaptocsoport (még előnyösebben acil-tio-csoport; és legelőnyösebben rövidszénláncú alkanoil-tio-csoport),
- R^3 jelentése hidrogénatom, rövidszénláncú alkilcsoport, rövidszénláncú alkoxicssoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport vagy arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport (még előnyösebben fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport; és legelőnyösebben benzilcsoport),
- R^8 jelentése hidrogénatom, vagy pedig
- R^3 és R^8 együttesen rövidszénláncú alkiléncsoportot képez,
- R^4 jelentése acilcsoport (még előnyösebben adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal helyettesített karbamoilcsoport); adott esetben 1-3 (még előnyösebben 1-2) alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal, halogénatommal, rövidszénláncú alkoxicssoporttal, rövidszénláncú alkil-tio-csoporttal, acilcsoporttal, di(rövid-

szénláncu alkil)-amino-csoporttal, cianocsoporttal, egy, két vagy három halogénatommal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoporttal, egy, két vagy három halogénatommal helyettesített rövidszénláncú alkoxi-csoporttal, karboxilcsoporttal, védett karboxilcsoporttal, nitrocsoporttal, aminocsoporttal és/vagy acil-amino-csoporttal helyettesített fenilcsoport; adott esetben rövidszénláncú alkilcsoporttal helyettesített heterociklusos csoport; fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport; rövidszénláncú cikloalkilcsoport vagy (a) általános képletű csoport, ahol A jelentése rövidszénláncú alkilcsoport; adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal és/vagy arilcsoporttal helyettesített tiokarbamoilcsoport; rövidszénláncú alkoxi-karbonil-csoport; adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal és/vagy arilcsoporttal helyettesített amino-szulfonil-csoport; aroilcsoport; arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú cikloalkil-karbonil-csoport; arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfonil-csoport; vagy egy heterociklusos karbonsavból lezármaztatható acilcsoport; legelőnyösebben adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal, fenilcsoporttal, egy vagy két rövidszénláncú alkil-

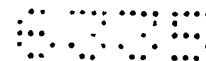
csoportot viselő fenilcsoporttal, egy vagy két halogénatomot viselő fenilcsoporttal, rövidszénláncú alkoxi-fenil-csoporttal, rövidszénláncú alkil-tio-fenil-csoporttal, rövidszénláncú alkanoil-fenil-csoporttal, di(rövidszénláncú alkil)-amino-fenil-csoporttal, ciano-fenil-csoporttal, három halogénatomot viselő rövidszénláncú alkil-fenil-csoporttal, három halogénatomot viselő rövidszénláncú alkoxi-fenil-csoporttal, karboxi-fenil-csoporttal, rövidszénláncú alkoxi-karbonil-fenil-csoporttal, nitro-fenil-csoporttal, amino-fenil-csoporttal, rövidszénláncú alkanoil-amino-fenil-csoporttal, piridilcsoporttal, rövidszénláncú alkil-pirazolil-csoporttal, pirrolilcsoporttal, tiazolilcsoporttal, tiadiazolilcsoporttal, benzodioxolilcsoporttal, fenilcsoportot viselő rövidszénláncú alkilcsoporttal, rövidszénláncú cikloalkilcsoporttal és/vagy indanilcsoporttal helyettesített karbamoilcsoport;

adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal és/vagy fenilcsoporttal helyettesített tiokarbamoilcsoport;

rövidszénláncú alkoxi-karbonil-csoport;

adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal és/vagy fenilcsoporttal helyettesített amino-szulfonil-csoport;

benzoilcsoport; fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú cikloalkil-karbonil-csoport; fenil-



csoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfonil-csoport; indolinil-karbonil-csoport, dihidro-benzoxazinil-karbonil-csoport; vagy dihidro-benzotiazinil-karbonil-csoport/;

karboxilcsoport;

arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfonil-csoport (még előnyösebben fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfonil-csoport; és legelőnyösebben benzil-szulfonil-csoport);

arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-tio-csoport (még előnyösebben fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-tio-csoport; és legelőnyösebben benzil-tio-csoport); cianocsoport;

adott esetben egy vagy több alkalmas csoporttal helyettesített heterociklusos csoport /még előnyösebben telítetlen, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), 1-4 nitrogénatomot tartalmazó, monociklusos heterociklusos csoport, amely adott esetben arilcsoporttal helyettesített lehet,

telítetlen, 3-8-tagu (még előnyösebben 5- vagy 6-tagu), 1-2 oxigénatomot és 1-3 nitrogénatomot tartalmazó, monociklusos heterociklusos csoport, amely adott esetben arilcsoporttal helyettesített lehet, vagy

telítetlen, kondenzált, 1-4 nitrogénatomot tartalmazó heterociklusos csoport, amely adott esetben rövidszénláncu alkilcsoporttal helyettesített lehet;

és legelőnyösebben imidazolinilcsoport, fenil-imida-

zolinil-csoport, tetrazolilcsoport, fenil-tetrazolil-
-csoport, oxadiazolilcsoport, fenil-oxadiazolil-
-csoport, benzimidazolilcsoport, rövidszénláncú al-
kil-benzimidazolil-csoport, kinolilcsoport vagy izo-
kinolilcsoport/,

z jelentése oxigénatom vagy kénatom, és
n jelentése 0, 1 vagy 2.

A jelen találmány szerinti vegyületeket és a jelen ta-
lálmány szerinti eljárást az alábbiakban - a találmány oltalmi
körének szűkítése nélkül - példákkal szemléltetjük.

1. példa

13 g 6-metil-tio-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-dion 130 ml
N,N-dimetil-acetamiddal készült oldatához lassan hozzáadagolunk
2,74 g nátrium-hidridet (60 %-os, ásványi olajat tartalmazó ké-
szítmény), majd az elegyet 1 órán át szobahőmérsékleten keverjük.
Ezután hozzáadunk 4,26 ml metil-jodidot, és a reakcióelegyet
3 órán át szobahőmérsékleten keverjük. Ezt követően 650 ml jeges
vizre öntjük, a csapadékot kiszűrjük, vízzel mossuk, és megszá-
ritjuk. Ily módon sárgaszínű, kristályos anyag formájában 12,8 g
1-metil-6-metil-tio-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-diont kapunk,
op.: 183 - 191°C.

IR-spektrum (nujol): 1770, 1720, 1610, 1590 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.54 (3H, s), 3.45 (3H, s),

7.3-7.8 (3H, m).

2. példa

25 g N-metil-N-fenil-metán-szulfonamid 250 ml tetrahidrofuránnal készült oldatához hozzáadunk 89 ml 1,6 mólos, hexános n-butyl-litium-oldatot, és eközben a reakcióelegy hőmérsékletét 20°C alatt tartjuk. Utána hozzáadunk 8,2 ml dietil-karbonát 40 ml tetrahidrofuránnal készült oldatát, és eközben a reakcióelegy hőmérsékletét -30°C alatt tartjuk. Ezután hagyjuk az elegyet szobahőmérsékletre melegedni, és az oldószert csökkentett nyomáson ledesztilláljuk. A maradékhoz vizet adunk, a kapott oldatot megsavanyítjuk, és kloroformmal kirázzuk. Az oldószert ledesztillálva 30 g olajat kapunk, amelyet egy 200 g szilikagéllal töltött oszlopon kromatografálva tisztítunk, eluensként toluolt használunk. Ily módon sárgaszínű olaj formájában 12,5 g (N-metil-N-fenil-amino)-szulfonil-ecetsav-etil-észtert kapunk.

IR-spektrum (film): 1740, 1600, 1495, 1355 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (CDCl_3), delta: 1.31 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 3.41 (3H, s), 3.94 (2H, s), 4.25 (2H, q, $J=7.1\text{Hz}$), 7.1-7.6 (5H, m).

Tömegspektrum (m/z): 257 (M^+).

3. példa

Az alábbi vegyületeket az 1. példában leirthez hasonló módon eljárva állítjuk elő.

1) 6-Etil-tio-1-metil-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-dion

Op.: 143 - 150°C.

IR-spektrum (nujol): 1785, 1730, 1610, 1590 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.23 (3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.99 (2H, q, $J=7.3\text{Hz}$), 3.45 (3H, s), 7.41 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 7.7-7.9 (2H, m).

Tömegspektrum (m/z): 237 (M^+).

2) 1-Metil-6-(neopentil-tio)-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-dion

Op.: 128 - 131°C.

IR-spektrum (nujol): 1780, 1765, 1735, 1610, 1580 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.00 (9H, s), 2.98 (2H, s), 3.45 (3H, s), 7.3-7.9 (3H, m).

Tömegspektrum (m/z): 279 (M^+).

3) 1-Etil-6-metil-tio-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-dion

Op.: 135 - 145°C.

IR-spektrum (nujol): 1780, 1720, 1605, 1580 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.22 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2.54 (3H, s), 4.08 (2H, q, $J=7.1\text{Hz}$), 7.4-7.8 (3H, m).

4) 1-Benzil-6-metil-tio-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-dion

Op.: 169 - 171°C.

IR-spektrum (nujol): 1780, 1720, 1620, 1580 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.51 (3H, s), 5.28 (2H, s), 7.1-7.8 (8H, m).

Tömegspektrum (m/z): 299 (M^+).

5) 1-Metoxi-metil-6-metil-tio-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-dion

Op.: 122 - 126°C.

IR-spektrum (nujol): 1780, 1760, 1725, 1605, 1585 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.54 (3H, s), 3.36 (3H, s),
5.43 (2H, s), 7.3-7.8 (3H, m).

6) 6-Metil-tio-1-propil-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-dion

Op.: 126 - 131°C.

IR-spektrum (nujol): 1775, 1730, 1605, 1580 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 0.95 (3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 1.64
(2H, szextett, $J=7.3\text{Hz}$), 2.54 (3H, s), 3.95 (2H,
t, $J=7.3\text{Hz}$), 7.46 (1H, d, $J=8.9\text{Hz}$), 7.7-7.8
(2H, m).

7) 1-Metil-6-fenil-tio-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-dion

Op.: 118 - 121°C.

IR-spektrum (nujol): 1790, 1770, 1735, 1610 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 3.45 (3H, s), 7.3-7.5 (6H, m),
7.7-7.9 (2H, m).

Tömegspektrum (m/z): 285 (M^+).

8) 6-(4-Fluor-fenil-tio)-1-metil-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-
-dion

Op.: 131 - 133°C.

IR-spektrum (nujol): 1780, 1745, 1715, 1610, 1585 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 3.45 (3H, s), 7.2-7.9 (7H, m).

Tömegspektrum (m/z): 303 (M^+).

4. példa

4 g 5-merkaptó-2-nitro-benzoésav és 2,76 g kálium-kar-
bonát 40 ml 2-metoxi-etanolal készült elegyét 10 percig kever-
jük, utána hozzáadunk 6,3 g neopentil-tozilátot, és a reakció-

elegyet 1,5 órán át forraljuk. Ezt követően az oldószert le-desztilláljuk, a maradékot feloldjuk vízben, az oldatot diizo-propil-éterrel mossuk, majd sósavval megsavanyítjuk, és diklór-metánnal kirázzuk. A szerves részről az oldószert ledesztillálva sárgaszínű, szilárd anyag formájában 5,2 g 5-(neopentil-tio)-2-nitro-benzoésavat kapunk, op.: 145 - 198°C.

IR-spektrum (nujol): 1715, 1605, 1570, 1515 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO-d_6), delta: 1.03 (9H, s), 3.10 (2H, s),
7.5-8.1 (3H, m).

Tömegspektrum (m/z): 269 (M^+).

5. példa

1) 4,8 g 5-(neopentil-tio)-2-nitro-benzoésav, 0,86 g nátrium-hidroxid, 0,29 g vas(III)-klorid, 0,2 g csontszén és 2 ml izopropil-alkohol 34 ml vízzel készült elegyéhez 75°C hőmérsékleten hozzáadunk 2,1 ml hidrazin-hidrátot. Az elegyet 90 percig 75 - 80°C hőmérsékleten keverjük, majd egy celitből készült szűrőrétegen átszűrjük. A szűrletet lehütjük, és pH = 4,6-ra savanyítjuk. A kivált csapadékot kiszűrjük, vízzel mossuk, és megszárítjuk. Ily módon sárgaszínű, szilárd anyag formájában 2,7 g 5-(neopentil-tio)-antranilsavat kapunk, op.: 115 - 122°C.

IR-spektrum (nujol): 3550, 3430, 1680, 1620, 1580, 1560 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO-d_6), delta: 0.95 (9H, s), 2.73 (2H, s),
6.72 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.30 (1H, dd, $J=8.6,$
2.1Hz), 7.75 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 8.71 (2H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 239 (M^+).

Az alábbi vegyületet az 5. példa 1) pontjában leírt-hoz hasonló módon eljárva állítjuk elő.

2) 5-(4-Fluor-fenil-tio)-antranilsav

Op.: 184 - 186°C.

IR-spektrum (nujol): 3520, 3400, 1680, 1610, 1580, 1550 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 6.8-7.4 (6H, m), 7.86 (1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 8.8 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 263 (M^+).

6. példa

3,5 g 5-(etil-tio)-antranilsav, 1,42 g nátrium-hidroxid és 8,9 g szárazjég 89 ml vízzel készült elegyébe szobahőmérsékleten, 10 percen át 1,62 ml klór-hangyasav-(triklór-metil)-észterből és 0,2 g aktív szénből készített foszgént vezetünk. Utána az elegyet 2 órán át keverjük, majd a kivált csapadékot kiszűrjük, vízzel mossuk, és levegőn megszárítjuk. Ily módon zöldessárga színű, kristályos anyag formájában 2,9 g 6-etil-tio-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-diont kapunk, op.: $> 300^\circ\text{C}$.

IR-spektrum (nujol): 3150, 3080, 1780, 1740, 1715, 1620 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.22 (3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.99 (2H, q, $J=7.3\text{Hz}$), 7.12 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.6-7.8 (2H, m), 11.8 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 233 (M^+).

7. példa

1) 5,8 g 5-(neopentil-tio)-antranilsav és 11,6 ml klór-

-hangyasav-etil-észter 58 ml xilollal készült elegyét 24 órán át forraljuk, majd lehütjük. A kivált csapadékot kiszűrjük, és di-
etil-éterrel mossuk. Ily módon szürkészinű, porszerű anyag formá-
jában 1,9 g 6-(neopentil-tio)-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-diont
kapunk, op.: 221 - 225°C.

IR-spektrum (nujol): 3250, 1790, 1765, 1700, 1615 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 0.99 (9H, s), 2.95 (2H, s),
7.0-7.8 (3H, m), 11.7 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 265 (M^+).

Az alábbi vegyületeket a 7. példa 1) pontjában leirt-
hoz hasonló módon eljárva állítjuk elő.

2) 6-Fenil-tio-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-dion

Op.: 135 - 138°C.

IR-spektrum (nujol): 3250, 1790, 1765, 1700, 1615 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 7.1-7.5 (6H, m), 7.7-7.8
(2H, m), 11.88 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 271 (M^+), 227.

3) 6-(4-Fluor-fenil-tio)-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-dion

Op.: 237 - 240°C.

IR-spektrum (nujol): 3250, 3180, 1790, 1760, 1695, 1615,
1585 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 7.1-7.8 (7H, m), 11.85 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 289 (M^+), 245.

8. példa

1) 2,25 g 2-(metil-amino)-5-(metil-tio)-benzoesav-etil-
-észter, 1,9 g benzoil-ecetsav, 2,7 g 1-etil-3-(3-dimetil-amino-
-propil)-karbodiimid-hidroklorid és 10 mg 4-dimetil-amino-piridin
50 ml diklór-metánnal készült elegyét éjszakán át szobahőmérsék-
leten keverjük. Utána az oldatot telített nátrium-klorid-oldattal
mossuk, megszáritjuk, és az oldószert csökkentett nyomáson le-
desztilláljuk. A 4,2 g maradékot egy 70 g szilikagéllal töltött
oszlopon kromatografálva tisztítjuk, eluensként etil-acetát és
n-hexán 1 : 3 arányu elegyét használjuk. Ily módon sárgaszinű
olaj formájában 2,9 g 2-/N-metil-N-(2-benzoil-acetil)-amino/-5-
-(metil-tio)-benzoesav-etil-észtert kapunk.

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.17 ((3H, t, J=7Hz),
2.58 (3H, s), 3.22 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=7Hz),
5.18 (1H, s), 7.3-8.1 (8H, m), 15.1 (1H, s).

Az alábbi vegyületeket a 8. példa 1) pontjában leirt-
hoz hasonló módon eljárva állítjuk elő.

2) 2-//2-(N-Fenil-N-metil-karbamoil)-acetil/-amino/-5-(metil-
-tio)-benzoesav-etil-észter

Op.: 115 - 117°C.

IR-spektrum (nujol): 1705, 1680, 1660, 1595, 1495 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.32 (3H, t, J=7.1Hz),
2.49 (3H, s), 3.21 (3H, s), 3.27 (2H, s), 4.31
(2H, q, J=7.1Hz), 7.3-8.2 (8H, m), 10.6 (1H, s).

3) 2-/N-Metil-N-/3-oxo-3-(1-fenil-ciklopropil)-propionil/-

-amino/-5-(metil-tio)-benzoesav-etil-észter

IR-spektrum (film): 1725, 1705, 1660, 1615, 1490 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.1-1.2 (2H, m), 1.27 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 1.5-1.6 (2H, m), 2.55 (3H, s), 3.10 (3H, s), 4.26 (2H, q, $J=7.1\text{Hz}$), 6.73 (1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.1-7.4 (6H, m), 7.74 (1H, d, $J=2.3\text{Hz}$).

Tömegspektrum (m/z): 411 (M^+).

9. példa

6,5 g 4-fluor-tiofenol és 10,1 g 5-klór-2-nitro-benzoesav 30 ml metanollal készült elegyéhez nitrogén atmoszférában hozzáadjuk 7,3 g kálium-hidroxid 40 ml metanollal és 3 ml vízzel készült oldatát. Az elegyet 6 órán át forraljuk, majd lehütjük, és 350 ml vízre öntjük. A kapott oldatot megsavanyítjuk, a kivált csapadékot kiszűrjük, és vízzel mossuk. A terméket etanol és víz elegyéből kétszer átkristályosítva fehérszinű, porszerű anyag formájában 10 g 5-(4-fluor-fenil-tio)-2-nitro-benzoesavat kapunk, op.: 150 - 153°C.

IR-spektrum (nujol): 1710, 1590, 1570, 1535 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 7.3-7.8 (6H, m), 7.95 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 14.0 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 293 (M^+).

10. példa

5 g 1-acetil-1-fenil-ciklopropán és 18,8 ml dietil-karbonát 62 ml tetrahidrofuránnal készült oldatához hozzáadunk

1,5 g nátrium-hidridet. Az elegyet 1 órán át forraljuk, majd lehütjük, és telített, vizes ammónium-klorid-oldattal higitjuk. A kapott elegyet dietil-éterrel kirázzuk, a szerves részt telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, megszáritjuk, és az oldószeret ledesztilláljuk. A maradékot (7,7 g) egy 230 g szilikagéllal töltött oszlopon kromatografálva tisztítjuk, eluensként dietil-éter és hexán 3 : 20 arányu elegyét használjuk. Ily módon világos-narancssárga színű olaj formájában 5 g 3-oxo-3-(1-fenil-1-ciklopropil)-propionsav-etil-észtert kapunk.

IR-spektrum (film): 1745, 1700, 1605, 1500 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.1-1.3 (5H, m), 1.6-1.8 (2H, m), 3.34 (2H, s), 4.10 (2H, q, $J=7.1\text{Hz}$), 7.3-7.5 (5H, m).

Tömegspektrum (m/z): 232 (M^+).

11. példa

4,9 g 3-oxo-3-(1-fenil-1-ciklopropil)-propionsav-etil-észter és 21 ml 1 normál, vizes nátrium-hidroxid-oldat elegyét éjszakán át szobahőmérsékleten keverjük. A kapott oldatot dietil-éterrel mossuk, majd sósavval megsavanyítjuk, és diklórmetánnal kirázzuk. A diklórmetános részt megszáritjuk, és az oldószeret ledesztilláljuk. A maradékot hűtőszekrényben tartva fehérszínű, porszerű anyag formájában 3,9 g 3-oxo-3-(1-fenil-1-ciklopropil)-propionsavat kapunk, op.: 50 - 55°C.

IR-spektrum (film): 1745, 1710, 1605, 1500 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.3-1.4 (2H, m), 1.7-1.8

(2H, m), 3.39 (2H, s), 7.37 (5H, s).

Tömegspektrum (m/z): 204.

12. példa

1) 16,8 g 3-(N-metil-N-fenil-amino)-3-oxo-propionsav-
-etil-észter 48 ml N,N-dimetil-acetammal készült oldatához
lassan hozzáadunk 3,03 g 60 %-os nátrium-hidridet, és az elegyet
30 percig szobahőmérsékleten keverjük. Utána 80°C hőmérsékleten
hozzácepesztjük 16 g 1-metil-6-metil-tio-2H-3,1-benzoxazin-
-2,4(1H)-dion 160 ml N,N-dimetil-acetammal készült oldatát. Ezt
követően a reakcióelegyet 5 órán át 120°C hőmérsékleten kever-
jük. Utána az elegyet 1 l jeges vízre öntjük, és 7 ml tömény só-
savval semlegesítjük. A kivált csapadékot kiszűrjük, vízzel mos-
suk, és feloldjuk 250 ml kloroformban. Az oldatot megsűrjük, és
a szűrletről az oldószert ledesztilláljuk. A maradékot etanolban
melegítjük, majd az elegyet lehütjük. Ily módon világosbarna
szinű, kristályos anyag formájában 13,4 g 1-metil-2-oxo-3-(N-me-
til-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolint
kapunk, op.: 200 - 202°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1650, 1635, 1615, 1590, 1565, 1500 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.49 (3H, s), 3.29 (3H, s),
3.42 (3H, s), 7.0-7.8 (8H, m), 11.3 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 354 (M^+).

Analízis a $\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 64,39, H: 5,12, N: 7,91;

talált: C: 64,54, H: 5,07, N: 7,69.

Az alábbi vegyületeket a 12. példa 1) pontjában leírt-hoz hasonló módon eljárva állítjuk elő.

2) 1-Metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-amino-szulfonil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 154 - 156°C.

IR-spektrum (nujol): 1635, 1560 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.51 (3H, s), 3.51 (3H, s),
3.60 (3H, s), 7.2-7.8 (8H, m).

Tömegspektrum (m/z): 390 (M^+).

Analízis a $\text{C}_{18}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}_2$ képlet alapján:

számított: C: 55,37, H: 4,65, N: 7,18;

talált: C: 55,08, H: 4,59, N: 7,11.

3) 1-Metil-2-oxo-3-etoxi-karbonil-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 114 - 115°C.

IR-spektrum (nujol): 1660, 1630, 1565, 1490 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.30 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$),
2.54 (3H, s), 3.51 (3H, s), 4.32 (2H, q, $J=7.1\text{Hz}$),
7.4-7.9 (3H, m).

Tömegspektrum (m/z): 293 (M^+).

4) 1-Metil-2-oxo-3-benzil-szulfonil-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 157 - 159°C.

IR-spektrum (nujol): 1645, 1575 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.51 (3H, s), 3.63 (3H, s),
5.00 (2H, s), 7.32 (5H, s), 7.5-7.8 (3H, m).

Tömegspektrum (m/z): 375 (M^+).

Analízis a $C_{18}H_{17}NO_4S_2$ képlet alapján:

számított: C: 57,58, H: 4,56, N: 3,73, S: 17,08;

talált: C: 57,40, H: 4,50, N: 3,69, S: 17,09.

13. példa

1,45 g 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin 40 ml diklór-metánnal készült, jeges fürdőben lehűtött oldatához részletekben hozzáadunk 0,883 g 80 %-os m-klór-perbenzoesavat. Az elegyet 1 órán át 5°C hőmérsékleten keverjük, majd vízzel mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton megszárítjuk, és az oldószert csökkentett nyomáson ledesztilláljuk. A maradékot acetontól kristályosítva szintelen, kristályos anyag formájában 1,5 g 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-szulfonil-1,2-dihidro-kinolint kapunk, op.: 218 - 219°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1635, 1595, 1500 cm^{-1} .

1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.75 (3H, s), 3.30 (3H, s), 3.48 (3H, s), 7.0-8.2 (8H, m), 11.7 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 370 (M^+).

Analízis a $C_{19}H_{18}N_2O_4S \cdot 1/7H_2O$ képlet alapján:

számított: C: 61,18, H: 4,94, N: 7,51;

talált: C: 60,95, H: 5,00, N: 7,24.

14. példa

2 g 1-metil-2-oxo-3-etoxi-karbonil-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin és 0,94 ml indolin 10 ml piridinnel ké-

szült elegyét 4 órán át 100°C hőmérsékleten keverjük. Utána az oldószert ledesztilláljuk, és a maradékot feloldjuk kloroformban. A kapott oldatot megsűrjük, és a szürletről az oldószert csökkentett nyomáson ledesztilláljuk. A maradékot etanolból kristályosítva világosbarna színű, kristályos anyag formájában 2,1 g 1-metil-2-oxo-3-(1-indolinil-karbonil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolint kapunk, op.: 220 - 222°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1655, 1625, 1605, 1580, 1560 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.55 (3H, s), 3.08 (2H, t, $J=8.3\text{Hz}$), 3.59 (3H, s), 3.88 (2H, t, $J=8.3\text{Hz}$), 7.0-8.3 (7H, m), 11.5 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 366 (M^+).

Analízis a $\text{C}_{20}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_3\text{S} \cdot 0,28\text{H}_2\text{O}$ képlet alapján:

számított: C: 64,66, H: 5,04, N: 7,54;

talált: C: 64,47, H: 4,92, N: 7,42.

15. példa

2,2 g 1-metil-2-oxo-3-etoxi-karbonil-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin és 1,7 ml bróm-hidrogénsav 6 ml ecetsavval készült elegyét 4 órán át 70°C hőmérsékleten keverjük.

Utána az elegyet 5°C hőmérsékletre hűtjük, a kivált csapadékot kiszűrjük, vízzel mossuk, és csökkentett nyomáson, 60°C hőmérsékleten megszáritjuk. Ily módon halványsárga színű, kristályos anyag formájában 1,8 g 1-metil-2-oxo-3-karboxi-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolint kapunk, op.: 162 - 163°C.

IR-spektrum (nujol): 1690, 1630, 1600, 1490 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.57 (3H, s), 3.67 (3H, s),

7.6-7.9 (3H, m).

Tömegspektrum (m/z): 265 (M^+).

16. példa

2,99 g N-metil-4-fluor-anilin 18 ml toluollal készült oldatához keverés közben hozzácsepegtetünk 0,347 ml foszfor-tri-kloridot. Az elegyet 30 percig szobahőmérsékleten keverjük, majd a kapott oldathoz hozzáadunk 2,11 g 1-metil-2-oxo-3-karboxi-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolint. A reakcióelegyet 2 órán át 100°C hőmérsékleten melegítjük, majd lehütjük. Ezután 2 normál nátrium-hidroxid-oldattal kirázzuk, a vizes részt só-savval megsavanyítjuk, és kloroformmal kirázzuk. A kloroformos részt magnézium-szulfáton megszáritjuk, a száritószert kiszűrjük, és az oldószert ledesztilláljuk. A maradékot acetonnal mosuk, és csökkentett nyomáson megszáritjuk. Ily módon világos-barna színű, kristályos anyag formájában 2,1 g 1-metil-2-oxo-3-/N-(4-fluor-fenil)-N-metil-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolint kapunk, op.: 201 - 203°C.

IR-spektrum (nujol): 1650, 1635, 1615, 1595, 1570, 1510 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.50 (3H, s), 3.28 (3H, s), 3.43 (3H, s), 7.0-7.8 (7H, m), 11.4 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 372 (M^+).

Analízis a $\text{C}_{19}\text{H}_{17}\text{FN}_2\text{O}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 61,27, H: 4,60, N: 7,52;

talált: C: 61,29, H: 4,50, N: 7,45.

17. példa

Az alábbi vegyületeket a 12. példa 1) pontjában leirt-

hoz hasonló módon eljárva állítjuk elő.

1) 1-Metil-2-oxo-3-ciano-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-
-kinolin

Op.: 258 - 260°C.

IR-spektrum (nujol): 2240, 1620, 1585, 1550 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO-d_6), delta: 2.53 (3H, s), 3.53 (3H, s),
7.4-8.0 (3H, m).

Tömegspektrum (m/z): 246 (M^+).

2) 1-Metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-amino-tiokarbonil)-4-
-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 174 - 176°C.

IR-spektrum (nujol): 1620, 1570 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO-d_6), delta: 2.48 (3H, s), 3.41 (3H, s),
3.74 (3H, s), 7.1-7.7 (8H, m), 10.9 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 370 (M^+), 263.

Analízis a $\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_2\text{S}_2$ képlet alapján:

számított: C: 61,60, H: 4,90, N: 7,56, S: 17,31;

talált: C: 61,29, H: 4,87, N: 7,42, S: 17,09.

3) 1-Metil-2-oxo-3-(1-fenil-5-tetrazolil)-4-hidroxi-6-metil-
-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 263 - 265°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1630, 1605, 1590, 1560, 1515 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO-d_6), delta: 2.53 (3H, s), 3.51 (3H, s),
7.52 (5H, s), 7.4-7.9 (3H, m).

Tömegspektrum (m/z): 365 (M^+), 337.

4) 1-Metil-2-oxo-3-(5-fenil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-4-hidroxi-
-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 240 - 242°C.

IR-spektrum (nujol): 1660, 1640, 1580, 1535 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO-d_6), delta: 2.57 (3H, s), 3.79 (3H, s),
7.2-8.3 (8H, m).

Tömegspektrum (m/z): 365 (M^+).

5) 1-Metil-2-oxo-3-(1-metil-1H-benzimidazol-2-il)-4-
-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 198 - 204°C.

IR-spektrum (nujol): 1605, 1575, 1530 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO-d_6), delta: 2.51 (3H, s), 3.53 (3H, s),
3.79 (3H, s), 7.3-8.0 (7H, m).

Tömegspektrum (m/z): 351 (M^+).

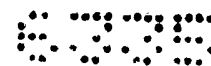
6) 1-Metil-2-oxo-3-(1-fenil-imidazolin-2-il)-4-hidroxi-
-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 120 - 130°C.

IR-spektrum (nujol): 1590, 1560, 1525 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO-d_6), delta: 2.45 (3H, s), 3.27 (3H, s),
3.88 (2H, t, $J=8.9\text{Hz}$), 4.25 (2H, t, $J=8.9\text{Hz}$),
7.0-7.8 (8H, m), 10.4 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 365 (M^+).



7) 1-Metil-2-oxo-3-(1-izokinolil)-4-hidroxi-6-metil-tio-
-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 136 - 140°C.

IR-spektrum (nujol): 1645, 1620, 1610, 1585, 1565, 1515 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.53 (3H, s), 3.56 (3H, s),
7.4-8.5 (9H, m).

Tömegspektrum (m/z): 347.

8) 1-Metil-2-oxo-3-(2-kinolil)-4-hidroxi-6-metil-tio-
-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 225 - 227°C.

IR-spektrum (nujol): 1640, 1610, 1570, 1505 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.55 (3H, s), 3.60 (3H, s),
7.4-8.1 (7H, m), 8.63 (1H, d, $J=9.4\text{Hz}$), 9.49
(1H, d, $J=9.4\text{Hz}$).

Tömegspektrum (m/z): 348 (M^+).

9) 1-Metil-2-oxo-3-/N-(2-metoxi-fenil)-N-metil-karbamoil/-4-
-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 178 - 180°C.

IR-spektrum (nujol): 1610, 1570, 1490 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.49 (3H, s), 3.21 (3H, s),
3.36 (3H, s), 3.71 (3H, s), 6.6-7.8 (7H, m),
11.0 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 384 (M^+), 247.

Analízis a $\text{C}_{20}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 62,48, H: 5,24, N: 7,29;

talált: C: 62,17, H: 5,29, N: 7,15.

10) 1-Metil-2-oxo-3-/N-(2-klór-fenil)-N-metil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 175 - 183°C.

IR-spektrum (nujol): 1630, 1620, 1585, 1570 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.50 (3H, s), 3.27 (3H, s),
3.38 (3H, s), 7.1-8.0 (7H, m), 11.3 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 388 (M^+), 247.

11) 1-Metil-2-oxo-3-/N-metil-N-(2-metil-fenil)-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 188 - 194°C.

IR-spektrum (nujol): 1635, 1620, 1595, 1575, 1495 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.34 (3H, s), 2.49 (3H, s),
3.20 (3H, s), 3.38 (3H, s), 6.9-8.0 (7H, m).

Tömegspektrum (m/z): 368 (M^+), 247.

Analízis a $\text{C}_{20}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 65,20, H: 5,47, N: 7,60;

talált: C: 65,75, H: 5,79, N: 7,30.

12) 1-Metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-etil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 140 - 148°C.

IR-spektrum (nujol): 1650, 1610, 1585, 1560, cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.19 (3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.93
(2H, q, $J=7.3\text{Hz}$), 3.30 (3H, s), 3.43 (3H, s),

7.1-7.8 (8H, m), 11.3 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 368 (M⁺), 261.

13) 1-Metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-(neopentil-tio)-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 121 - 123°C.

IR-spektrum (nujol): 1655, 1630, 1610, 1585 cm⁻¹.

¹H-NMR-spektrum (DMSO-d₆), delta: 0.98 (9H, s), 2.92 (2H, s),
3.29 (3H, s), 3.42 (3H, s), 7.1-7.9 (8H, m),
11.3 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 410 (M⁺).

14) 1-Etil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 174 - 180°C.

IR-spektrum (nujol): 1640, 1620, 1580 cm⁻¹.

¹H-NMR-spektrum (DMSO-d₆), delta: 1.23 (3H, t, J=7Hz), 2.49
(3H, s), 3.29 (3H, s), 4.10 (2H, q, J=7Hz),
7.0-7.8 (8H, m), 11.3 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 368 (M⁺).

Analízis a C₂₀H₂₀N₂O₃S képlet alapján:

számított:	C: 65,20,	H: 5,47,	N: 7,60,	S: 8,70;
talált:	C: 65,52,	H: 5,59,	N: 7,34,	S: 8,74.

15) 1-Benzil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 185 - 195°C.

IR-spektrum (nujol): 1640, 1620, 1590, 1500 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.45 (3H, s), 3.33 (3H, s),
6.7-7.8 (13H, m), 11.5 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 430 (M^+).

Analízis a $\text{C}_{25}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 65,20, H: 5,47, N: 7,60, S: 8,70;

talált: C: 65,52, H: 5,59, N: 7,34, S: 8,74.

16) 1-Metoxi-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-
-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 152 - 156°C.

IR-spektrum (nujol): 1645, 1605, 1580, 1560 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.49 (3H, s), 2.95 (3H, s),
3.30 (3H, s), 5.49 (2H, s), 7.0-7.8 (8H, m),
11.6 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 384 (M^+).

17) 1-Propil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-
-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 142 - 152°C.

IR-spektrum (nujol): 1640, 1630, 1605, 1580 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 0.76 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 1.3-1.6
(2H, m), 2.48 (3H, s), 3.29 (3H, s), 3.9-4.1
(2H, m), 7.0-7.8 (8H, m), 11.3 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 382 (M^+).

Analízis a $\text{C}_{21}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 65,95, H: 5,80, N: 7,32, S: 8,38;

talált: C: 66,07, H: 6,22, N: 7,08, S: 8,38.

18) 1-Metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-fenil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 110 - 115°C.

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 3.28 (3H, s), 3.44 (3H, s),
7.0-8.0 (13H, m).

19) 1-Metil-2-tioxo-3-etoxi-karbonil-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 135 - 137°C.

IR-spektrum (nujol): 1690, 1610, 1530 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.28 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2.57
(3H, s), 4.17 (3H, s), 4.26 (2H, q, $J=7.1\text{Hz}$),
7.6-8.0 (3H, m).

20) 1-Metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-(4-fluor-fenil-tio)-1,2-dihidro-kinolin

IR-spektrum (nujol): 1640, 1615, 1585, 1550, 1510 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 3.26 (3H, s), 3.37 (3H, s),
7.0-7.6 (11H, m), 8.02 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 327.

18. példa

Az alábbi vegyületeket a 13. példában leirthez hasonló módon eljárva állítjuk elő.

1) 1-Metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-metoxi-6-metil-szulfinil-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 322 - 325°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1640, 1630, 1595, 1495 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.74 (3H, s), 3.36 (3H, s),
3.53 (3H, s), 4.15 (3H, s), 7.1-8.4 (8H, m).

Tömegspektrum (m/z): 384 (M^+).

2) 1-Metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-fenil-szulfinil-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 216 - 223°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1640, 1600, 1590, 1495 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 3.29 (3H, s), 3.42 (3H, s),
7.0-8.3 (13H, m), 11.7 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 432 (M^+).

Analízis a $\text{C}_{24}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 66,65, H: 4,66, N: 6,48;

talált: C: 66,55, H: 4,67, N: 6,37.

19. példa

Az alábbi vegyületeket a 14. példában leirthez hasonló módon eljárva állítjuk elő.

1) 1-Metil-2-oxo-3-(N-benzil-N-metil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 186 - 188°C.

IR-spektrum (nujol): 1645, 1635, 1605, 1575, 1500 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.54 (3H, s), 2.79 (3H, s),
3.58 (3H, s), 4.3-4.8 (2H, m), 7.2-8.0 (8H, m).

Tömegspektrum (m/z): 368 (M^+), 247.

Analízis a $\text{C}_{20}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 65,19, H: 5,47, N: 7,60;

talált: C: 65,52, H: 5,46, N: 7,52.

2) 1-Metil-2-oxo-3-/N-(2-tiazolil)-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 264 - 267°C.

IR-spektrum (nujol): 1630, 1600, 1540 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.58 (3H, s), 3.69 (3H, s),
7.4-8.0 (5H, m).

Tömegspektrum (m/z): 347 (M^+), 247.

Analízis a $\text{C}_{15}\text{H}_{13}\text{N}_3\text{O}_3\text{S}_2$ képlet alapján:

számított: C: 51,86, H: 3,77, N: 12,10;

talált: C: 51,39, H: 3,56, N: 11,85.

3) 1-Metil-2-oxo-3-(N-ciklohexil-N-metil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 144 - 147°C.

IR-spektrum (nujol): 1645, 1635, 1590, 1570, 1500 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.0-1.8 (10H, m), 2.52 (3H, s),
2.78 (3H, s), 3.3-3.6 (1H, m), 3.54 (3H, s),
7.4-7.9 (3H, m).

Tömegspektrum (m/z): 360 (M^+), 247.

Analízis a $\text{C}_{19}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 63,30, H: 6,71, N: 7,77;

talált: C: 63,01, H: 6,85, N: 7,48.

4) 1-Metil-2-oxo-3-/N-(2-piridil)-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 212 - 213°C.

IR-spektrum (nujol): 1640, 1630, 1600, 1570, 1550, 1530 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.57 (3H, s), 3.67 (3H, s),

7.1-8.5 (7H, m), 13.0 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 341 (M^+), 247.

Analízis a $\text{C}_{17}\text{H}_{15}\text{N}_3\text{O}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 59,81, H: 4,43, N: 12,31;

talált: C: 59,90, H: 4,34, N: 12,23.

5) 1-Metil-2-oxo-3-(N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 176 - 178°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1650, 1600, 1590, 1565 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.57 (3H, s), 3.67 (3H, s),

7.1-8.0 (8H, m), 12.7 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 340 (M^+), 247.

Analízis a $\text{C}_{18}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 63,51, H: 4,74, N: 8,23;

talált: C: 63,52, H: 4,57, N: 8,14.

6) 1-Metil-2-oxo-3-/N-(2-metil-fenil)-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 159 - 160°C.

IR-spektrum (nujol): 1640, 1625, 1590, 1565 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.37 (3H, s), 2.57 (3H, s),
3.67 (3H, s), 7.1-8.2 (7H, m), 12.6 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 354 (M^+), 247.

Analízis a $\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 64,39, H: 5,12, N: 7,91;

talált: C: 64,06, H: 4,97, N: 7,83.

7) 1-Metil-2-oxo-3-/N-(2-klór-fenil)-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 189 - 190°C.

IR-spektrum (nujol): 1660, 1640, 1590, 1580, 1555 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.57 (3H, s), 3.67 (3H, s),
7.1-8.4 (7H, m), 13.1 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 374 (M^+), 247.

Analízis a $\text{C}_{18}\text{H}_{15}\text{N}_2\text{ClO}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 57,67, H: 4,03, N: 7,48;

talált: C: 57,68, H: 3,76, N: 7,38.

8) 1-Metil-2-oxo-3-/N-(2,6-diklór-fenil)-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 198 - 200°C.

IR-spektrum (nujol): 1645, 1635, 1600, 1565, 1520 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.57 (3H, s), 3.69 (3H, s),
7.4-8.0 (6H, m), 12.2 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 408 (M^+), 247.

9) 1-Metil-2-oxo-3-/N-(2,6-dimetil-fenil)-karbamoil/-4-hidroxi-
-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 215 - 216°C.

IR-spektrum (nujol): 1640, 1600, 1580, 1555 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO-d_6), delta: 2.21 (6H, s), 2.57 (3H, s),
3.68 (3H, s), 7.16 (3H, s), 7.6-7.9 (3H, m),
11.9 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 368 (M^+), 247.

10) 4-Oxo-5-(1-indolinil-karbonil)-6-hidroxi-8-metil-tio-
1,2-dihidro-4H-pirrolo/3,2,1-ij/kinolin

Op.: 246 - 249°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1655, 1610, 1550, 1495 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO-d_6), delta: 2.52 (3H, s), 3.08 (2H, t,
($J=8\text{Hz}$), 3.37 (2H, t, $J=8\text{Hz}$), 3.89 (2H, t,
 $J=8\text{Hz}$), 4.27 (2H, t, $J=8\text{Hz}$), 6.9-8.2 (6H, m),
11.3 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 378 (M^+).

20. példa

Az alábbi vegyületeket a 15. példában leirthez ha-
sonló módon eljárva állítjuk elő.

1) 4-Oxo-5-karboxi-6-hidroxi-8-metil-tio-1,2-dihidro-4H-pir-
rolo/3,2,1-ij/kinolin

Op.: 270 - 278°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1680, 1630, 1600 cm^{-1} .

Tömegspektrum (m/z): 277 (M^+), 259.

2) 1-Metil-2-tioxo-3-karboxi-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-
-kinolin

Op.: 139 - 148°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1680, 1610, 1550 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.60 (3H, s), 4.19 (3H, s),

7.6-8.0 (3H, m).

Tömegspektrum (m/z): 281 (M^+).

21. példa

Az alábbi vegyületeket a 16. példában leirthez hasonló módon eljárva állítjuk elő.

1) 1-Metil-2-oxo-3-/N-(4-metoxi-fenil)-N-metil-karbamoil/-
-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 171 - 173°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1640, 1620, 1590, 1560, 1510 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.49 (3H, s), 3.25 (3H, s),

3.43 (3H, s), 3.62 (3H, s), 6.75 (2H, d,

$J=8.8\text{Hz}$), 7.21 (2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.3-7.8 (3H, m),

11.2 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 247.

Analízis a $\text{C}_{20}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 62,48, H: 5,24, N: 7,29;

talált: C: 62,54, H: 5,31, N: 7,20.

2) 1-Metil-2-oxo-3-(N-etil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-
-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 204 - 205°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1645, 1605, 1580, 1560 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.07 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$),
2.49 (3H, s), 3.41 (3H, s), 3.80 (2H, q,
 $J=7.0\text{Hz}$), 7.1-7.8 (8H, m), 11.2 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 247.

Analizis a $\text{C}_{20}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 65,19, H: 5,47, N: 7,60;

talált: C: 65,26, H: 5,59, N: 7,62.

3) 1-Metil-2-oxo-3-/N-(5-indanil)-N-metil-karbamoil/-4-
-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 136 - 140°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1650, 1630, 1595, 1565 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.04 (2H, kvintett, $J=7.3\text{Hz}$),
2.55 (3H, s), 2.84 (4H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 3.36 (3H, s),
3.46 (3H, s), 6.9-8.0 (6H, m).

Tömegspektrum (m/z): 247.

Analizis a $\text{C}_{22}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 66,98, H: 5,62, N: 7,10;

talált: C: 66,56, H: 5,70, N: 6,81.

4) 1-Metil-2-oxo-3-/(3,4-dihidro-2H-1,4-benzotiazin-4-il)-



-karbonil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 191 - 194°C.

IR-spektrum (nujol): 3300, 1640, 1620, 1585 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.52 (3H, s), 3.29 (2H, br s),
3.49 (3H, s), 3.92 (2H, br s), 6.7-8.0 (7H, m),
11.5 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 398 (M^+), 247.

Analízis a $\text{C}_{20}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}_2$ képlet alapján:

számított: C: 60,28, H: 4,55, N: 7,03;

talált: C: 60,02, H: 4,53, N: 6,88.

5) 1-Metil-2-oxo-3-/(3,4-dihidro-2H-1,4-benzoxazin-4-il)-
-karbonil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 202 - 204°C.

IR-spektrum (nujol): 1640, 1600, 1585, 1560, 1495 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.54 (3H, s), 3.54 (3H, s),
3.72 (2H, s), 4.30 (2H, s), 6.5-8.4 (7H, m),
11.6 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 382 (M^+), 247.

Analízis a $\text{C}_{20}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 62,81, H: 4,74, N: 7,33;

talált: C: 62,47, H: 4,58, N: 7,20.

6) 1-Metil-2-oxo-3-/N-metil-N-(4-metil-tio-fenil)-karmoil/-
-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 168 - 169°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1645, 1625, 1565, 1495 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.36 (3H, s), 2.49 (3H, s),
 3.27 (3H, s), 3.44 (3H, s), 7.0-7.8 (7H, m),
 11.3 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 400 (M^+), 247.

Analízis a $\text{C}_{20}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}_2$ képlet alapján:

számított: C: 59,98, H: 5,03, N: 7,00;

talált: C: 60,08, H: 5,25, N: 6,75.

7) 1-Metil-2-oxo-3-/N-(1,3-benzodioxol-5-il)-N-metil-karbamoil/-
 -4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 141 - 144°C.

IR-spektrum (nujol): 1640, 1620, 1600, 1565, 1500 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.50 (3H, s), 3.24 (3H, s),
 3.45 (3H, s), 5.93 (2H, s), 6.6-7.8 (6H, m),
 11.2 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 398 (M^+), 247.

Analízis a $\text{C}_{20}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 60,29, H: 4,55, N: 7,03;

talált: C: 60,08, H: 4,93, N: 6,72.

8) 1-Metil-2-oxo-3-/N-metil-N-(4-metil-fenil)-karbamoil/-
 -4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 192 - 193°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1650, 1630, 1590, 1565, 1515 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.14 (3H, s), 2.49 (3H, s),
 3.26 (3H, s), 3.43 (3H, s), 6.9-7.8 (7H, m),
 11.3 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 368 (M^+), 247.

Analízis a $C_{20}H_{20}N_2O_3S$ képlet alapján:

számított: C: 65,19, H: 5,47, N: 7,60;

talált: C: 65,14, H: 5,55, N: 7,49.

9) 1-Metil-2-oxo-3-/N-(2,4-difluor-fenil)-N-metil-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 129 - 131°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1650, 1600, 1565, 1515 cm^{-1} .

1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.51 (3H, s), 3.27 (3H, s),
3.40 (3H, s), 6.8-8.0 (6H, m), 11.5 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 390 (M^+), 274.

Analízis a $C_{19}H_{16}N_2F_2O_3S$ képlet alapján:

számított: C: 58,45, H: 4,13, N: 7,18;

talált: C: 58,56, H: 3,88, N: 7,08.

10) 4-Oxo-5-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-6-hidroxi-8-metil-tio-1,2-dihidro-4H-pirrolo/3,2,1-ij/kinolin

Op.: 120 - 121°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 3400, 1640, 1630, 1590, 1495 cm^{-1} .

1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.46 (3H, s), 3.29 (3H, s),
3.2-3.4 (2H, m), 4.0-4.2 (2H, m),
7.0-7.5 (7H, m), 11.1 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 259.

11) 1-Metil-2-tioxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-



-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 130 - 150°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1620, 1595, 1565, 1500 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO-d_6), delta: 2.53 (3H, s), 3.30 (3H, s),
4.06 (3H, s), 7.0-8.0 (8H, m).

Tömegspektrum (m/z): 370 (M^+), 263.

12) 1-Metil-2-oxo-3-/N-metil-/N-4-(trifluor-metoxi)-fenil/-
-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

IR-spektrum (nujol): 1640, 1620, 1565, 1510 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (CDCl_3), delta: 2.55 (3H, s), 3.28 (3H, s),
3.49 (3H, s), 7.0-8.0 (7H, m).

Tömegspektrum (m/z): 438 (M^+), 247.

13) 1-Metil-2-oxo-3-/N-metil-/N-3-(trifluor-metil)-fenil/-
-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

IR-spektrum (nujol): 1640, 1625, 1610, 1570, 1495 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (CDCl_3), delta: 2.56 (3H, s), 3.28 (3H, s),
3.52 (3H, s), 7.1-7.6 (6H, m), 7.97 (1H, d,
 $J=2.2\text{Hz}$), 12.5 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 422 (M^+), 247.

22. példa

1) 1 g 1-metil-2-oxo-3-karboxi-4-hidroxi-6-metil-tio-
-1,2-dihidro-kinolin, 451 mg 2-metil-amino-1,3,4-tiadiazol és
986 mg 1,3-diciklohexil-karbodiimid 10 ml toluollal készült ele-
gyét 1 órán át 90°C hőmérsékleten keverjük. Utána az elegyet le-

hűtjük, az oldatlan részeket kiszűrjük, toluollal mossuk, majd 12 ml 2 normál, vizes nátrium-hidroxid-oldatban szuszpendáljuk. A szuszpenziót megsűrjük, és a szűrletet sósavval megsavanyítjuk. A megsavanyított elegyet kloroformmal kirázzuk, a szerves részt megszárítjuk, és az oldószert ledesztilláljuk. A maradékot acetontól átkristályosítva halványsárga színű, kristályos anyag formájában 0,47 g 1-metil-2-oxo-3-/N-metil-N-(1,3,4-tiadiazol-2-il)-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolint kapunk, op.: 187 - 189°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1660, 1610, 1580 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.55 (3H, s), 3.60 (6H, s),
7.5-8.0 (3H, m), 9.30 (1H, s), 11.9 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 247.

Analízis a $\text{C}_{15}\text{H}_{14}\text{N}_4\text{O}_3\text{S}_2$ képlet alapján:

számított: C: 49,71, H: 3,89, N: 14,46;

talált: C: 49,55, H: 3,84, N: 15,15.

Az alábbi vegyületeket a 22. példa 1) pontjában leírtához hasonló módon eljárva állítjuk elő.

2) 1-Metil-2-oxo-3-/N-metil-N-(2-piridil)-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 151 - 154°C.

IR-spektrum (nujol): 1655, 1620, 1605, 1575 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.52 (3H, s), 3.37 (3H, s),
3.50 (3H, s), 7.1-8.4 (7H, m).

Tömegspektrum (m/z): 247.

3) 1-Metil-2-oxo-3-/N-metil-N-(1-metil-5-pirazolil)-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 114 - 118°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 3380, 1665, 1600, 1570, 1550 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.51 (3H, s), 3.22 (3H, s),
3.45 (3H, s), 3.72 (3H, s), 6.0-8.0 (5H, m),
11.5 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 247.

Analizis a $\text{C}_{17}\text{H}_{18}\text{N}_4\text{O}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 54,24, H: 5,35, N: 14,89;

talált: C: 54,04, H: 5,45, N: 14,69.

4) 1-Metil-2-oxo-3-/N-(4-acetil-fenil)-N-metil-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 110 - 112°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1690, 1645, 1600, 1565, 1500 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.50 (6H, s), 3.34 (3H, s),
3.47 (3H, s), 7.3-7.9 (7H, m), 11.5 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 396 (M^+), 247.

Analizis a $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 1/6\text{H}_2\text{O}$ képlet alapján:

számított: C: 63,14, H: 5,13, N: 7,01;

talált: C: 63,10, H: 5,35, N: 6,79.

5) 1-Metil-2-oxo-3-/N-/4-(dimetil-amino)-fenil/-N-metil-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 165 - 168°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1640, 1615, 1565, 1525 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.49 (3H, s), 2.77 (6H, s),
3.21 (3H, s), 3.43 (3H, s), 6.49 (2H, d, $J=8.7\text{Hz}$),
7.10 (2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.3-7.7 (3H, m).

Tömegspektrum (m/z): 397 (M^+), 247.

6) 1-Metil-2-oxo-3-/N-/4-(metoxi-karbonil)-fenil/-N-metil-
-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 149 - 151°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1725, 1645, 1630, 1605, 1565,
1500 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.50 (3H, s), 3.34 (3H, s),
3.46 (3H, s), 3.77 (3H, s), 7.3-7.9 (7H, m),
11.5 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 412 (M^+), 247.

Analizis a $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 61,15, H: 4,89, N: 6,79;

talált: C: 60,91, H: 5,00, N: 6,53.

7) 1-Metil-2-oxo-3-/N-metil-N-(1-pirrolil)-karbamoil/-4-
-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 116 - 118°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 3030, 1680, 1620, 1600, 1575, 1500 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ -spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.50 (3H, s), 3.39 (3H, s),
3.45 (3H, s), 5.83 (2H, br s), 6.77 (2H, br s),
7.3-7.8 (3H, m), 11.5 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 343 (M^+).

Analízis a $C_{17}H_{17}N_3O_3S \cdot EtOH$ képlet alapján:

számított: C: 58,59, H: 5,95, N: 10,79;

talált: C: 58,77, H: 6,22, N: 10,77.

8) 1-Metil-2-oxo-3-/N-(4-ciano-fenil)-N-metil-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 171 - 181°C.

IR-spektrum (nujol): 2230, 1645, 1630, 1590, 1565, 1510 cm^{-1} .

1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.51 (3H, s), 3.34 (3H, s),
3.47 (3H, s), 7.3-7.9 (7H, m), 11.6 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 379 (M^+), 247.

9) 1-Metil-2-oxo-3-/N-metil-N-(4-nitro-fenil)-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 112 - 116°C.

IR-spektrum (nujol): 1640, 1630, 1610, 1580, 1525, 1495 cm^{-1} .

1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.51 (3H, s), 3.37 (3H, s),
3.48 (3H, s), 7.3-8.2 (7H, m), 11.6 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 399 (M^+), 247.

23. példa

0,55 g 1-metil-2-oxo-3-/N-/4-(metoxi-karbonil)-fenil/-N-metil-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin és 0,21 g nátrium-hidroxid 6 ml vízzel készült elegyét 2 órán át szobahőmérsékleten keverjük. Utána az elegyet megsűrjük, és a

szűrletet sósavval megsavanyítjuk. A kivált csapadékot kiszűrjük, és vízzel mossuk. Ily módon halványsárga színű, kristályos anyag formájában 0,5 g 1-metil-2-oxo-3-/N-(4-karboxi-fenil)-N-metil-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolint kapunk, op.: 123 - 137°C.

IR-spektrum (nujol): 1710, 1630, 1600, 1570, 1500 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.50 (3H, s), 3.33 (3H, s),
3.47 (3H, s), 7.3-7.9 (7H, m), 11.5 (1H, br s),
12.9 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 399 (M^+), 354.

24. példa

2,5 g 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin és 3,8 g m-klór-perbenzoesav 70 ml diklór-metánnal készült elegyét 7 órán át szobahőmérsékleten keverjük. Utána az elegyet vizes nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal kirázzuk, és a vizes részt sósavval megsavanyítjuk. A kivált csapadékot kiszűrjük, majd egy 150 g szilikagéllal töltött oszlopon kromatografálva tisztítjuk, eluensként kloroform és etanol 20 : 1 arányu elegyét, majd kloroform, etanol és ecetsav 100 : 10 : 1 arányu elegyét használjuk. Az így megtisztított terméket etanollal mosva világosbarna színű, kristályos anyag formájában 1,2 g 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-szulfonil-1,2-dihidro-kinolint kapunk, op.: 221 - 223°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1640, 1620, 1590, 1550, 1495 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 3.23 (3H, s), 3.31 (3H, s),
3.49 (3H, s), 7.0-8.4 (8H, m), 11.9 (1H, br s).

Tömegspektrum (m/z): 386 (M^+).

25. példa

2 g 5-(metil-tio)-indolin és 3,1 ml tri(etoxi-karbonil)-metán elegyét 1 órán át 150°C hőmérsékleten, utána 1 órán át 200°C hőmérsékleten, és végül 1,5 órán át 220°C hőmérsékleten keverjük. A terméket egy 60 g szilikagéllal töltött oszlopon kromatografálva tisztítjuk, eluensként etil-acetát és etanol 10 : 1 arányu elegyét használjuk. Ily módon barnaszínű, szilárd anyag formájában 1,3 g 4-oxo-5-etoxi-karbonil-6-hidroxi-8-metil-tio-1,2-dihidro-4H-pirrolo/3,2,1-ij/kinolint kapunk.

IR-spektrum (CHCl_3): 1655, 1620, 1560, 1490 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO-d_6), delta: 1.29 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2.51 (3H, s), 3.32 (2H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 4.1-4.4 (4H, m), 7.47 (1H, s), 7.51 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 305 (M^+), 259.

26. példa

0,5 g benzil-szulfonil-ecetsav-etil-észter és 0,49 g 1-metil-6-metil-tio-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-dion 11 ml tetrahidrofuránnal készült elegyéhez 3°C hőmérsékleten, keverés közben hozzáadunk 0,18 g nátrium-hidridet. 30 perc múlva a reakciót víz hozzáadásával befagyasztjuk, majd az elegyet 5 ml 1 normál sósavval megsavanyítjuk, és diklór-metánnal kirázzuk. A szerves részt megszárítjuk, és az oldószert ledesztilláljuk. A maradékot feloldjuk 15 ml toluolban, és az oldatot éjszakán át szobahőmérsékleten állni hagyjuk. A kivált csapadékot kiszűrjük, és toluollal

mossuk. Ily módon szintelen, kristályos anyag formájában 0,39 g 1-metil-2-oxo-3-benzil-szulfinil-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolint kapunk, op.: 158 - 160°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1615, 1565 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.49 (3H, s), 3.59 (3H, s),
4.33 (1H, d, J=13Hz), 4.60 (1H, d, J=13Hz),
7.1-7.8 (8H, m).

Tömegspektrum (m/z): 359 (M^+).

27. példa

2,8 ml diizopropil-amin és 12,5 ml 1,6 mólos, hexános n-butyl-litium-oldat 75 ml tetrahydrofuranal készült elegyét 10 percig 5°C hőmérsékleten keverjük. Utána -78°C hőmérsékleten hozzáadunk 2,1 g (benzil-tio)-ecetsav-etil-észtert, majd az elegyet 1 órán át keverjük. Ezt követően 2,2 g 1-metil-6-metil-tio-2H-3,1-benzoxazin-2,4(1H)-diont adunk hozzá, és a reakcióelegyet lassan szobahőmérsékletre melegítjük. Ezen a hőmérsékleten 2 órán át keverjük, majd a reakciót vizes ammónium-klorid-oldat hozzáadásával befagyasztjuk. Az elegyet diklór-metánnal kirázzuk, a szerves részt megszárítjuk, és az oldószert ledesztilláljuk. A maradékot feloldjuk 25 ml toluolban, és az oldatot 90 percig forraljuk. Ezt követően az oldószert ledesztilláljuk, és a kapott maradékot egy 150 g szilikagéllal töltött oszlopon kromatografálva tisztítjuk, eluensként diklór-metán és izopropanol 20 : 1 arányu elegyét használjuk. A kromatografált anyagot acetontól átkristályosítva szintelen, kristályos anyag formájában 0,86 g

1-metil-2-oxo-3-benzil-tio-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-
-kinolint kapunk, op.: 110 - 112°C.

IR-spektrum (nujol): 1635, 1610, 1585, 1560 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.51 (3H, s), 3.61 (3H, s),
4.06 (2H, s), 7.0-7.7 (8H, m), 10.45 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 343 (M^+).

Analízis a $\text{C}_{18}\text{H}_{17}\text{NO}_2\text{S}_2$ képlet alapján:

számított: C: 62,95, H: 4,99, N: 4,08, S: 18,67;

talált: C: 62,91, H: 4,92, N: 4,00, S: 18,54.

28. példa

1) 2,9 g 2-/N-metil-N-(2-benzoil-acetil)-amino/-5-(metil-
-tio)-benzoesav-etil-észter és 1,1 g nátrium-etilát 39 ml etanol-
lal készült elegyét 2 órán át szobahőmérsékleten keverjük. Utána
hozzáadunk 6 ml 3 normál sósavat, a kivált csapadékot kiszűrjük,
és etanollal mossuk. Ily módon sárgaszínű, szilárd anyag formá-
jában 2 g 1-metil-2-oxo-3-benzoil-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-di-
hidro-kinolint kapunk, op.: 170 - 171°C.

IR-spektrum (nujol): 1650, 1625, 1595, 1565 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.55 (3H, s), 3.54 (3H, s)
7.4-8.0 (8H, m), 11.8 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 324.

Analízis a $\text{C}_{18}\text{H}_{15}\text{NO}_3\text{S}$ képlet alapján:

számított: C: 66,44, H: 4,65, N: 4,30, S: 9,85;

talált: C: 66,31, H: 4,60, N: 4,31, S: 9,84.

Az alábbi vegyületeket a 28. példa 1) pontjában leirt-

hoz hasonló módon eljárva állítjuk elő.

2) 2-Oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-tio-
-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 259°C (bomlik).

IR-spektrum (nujol): 1650, 1625, 1595, 1500 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.46 (3H, s), 3.29 (3H, s)
7.0-7.7 (8H, m), 11.25 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 340, (M^+), 233.

3) 1-Metil-2-oxo-3-(1-fenil-1-ciklopropil-karbonil)-4-hidroxi-
-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 170 - 173°C.

IR-spektrum (nujol): 1665, 1590, 1565 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 1.3-1.4 (2H, m), 1.5-1.6 (2H,
m), 2.51 (3H, s), 3.43 (3H, s) 7.1-7.6 (7H, m),
7.82 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 11.86 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 365, (M^+), 337.

Analízis a $\text{C}_{21}\text{H}_{19}\text{NO}_3\text{S} \cdot 1/4\text{H}_2\text{O}$ képlet alapján:

számított: C: 68,18, H: 5,31, N: 3,79;

talált: C: 68,27, H: 5,12, N: 3,79.

29. példa

2,35 g 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-
-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin és 7,05 ml foszfor-oxi-
klorid elegyét 1 órán át 80°C hőmérsékleten keverjük. Utána jeges

vizet adunk hozzá, és a csapadékot kiszűrjük. Ily módon halvány-sárga színű, kristályos anyag formájában 2 g 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-klór-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolint kapunk, op.: 209 - 210°C.

IR-spektrum (nujol): 1645, 1630, 1590, 1560 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.51 (3H, s), 3.36 (3H, s)
3.56 (3H, s), 7.1-7.9 (8H, m).

Tömegspektrum (m/z): 372, (M^+), 337, 266.

30. példa

1) 2,4 g 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-klór-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin és 10 ml 28 %-os ammónium-hidroxid-oldat 20 ml metanollal készült elegyét 48 órán át zárt csőben, 100°C hőmérsékleten melegítjük. Utána az oldószert le-desztilláljuk, és a maradékot egy szilikagéllal töltött oszlopon komatografálva tisztítjuk, eluensként kloroform és metanol 20 : 1 arányu elegyét használjuk. Ily módon szintelen, kristályos anyag formájában 1,1 g 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-amino-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolint kapunk, op.: 138 - 140°C.

IR-spektrum (nujol): 3370, 3200, 1620, 1590, 1560, 1495 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.51 (3H, s), 3.29 (3H, s)
3.37 (3H, s), 6.55 (2H, s), 7.0-7.5 (7H, m),
7.84 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 353 (M^+).

Az alábbi vegyületet a 30. példa 1) pontjában leírt-hoz hasonló módon eljárva állítjuk elő.

2) 1-Metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-metil-amino-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin

Op.: 244 - 246°C.

IR-spektrum (nujol): 3350, 1620, 1585, 1550 cm^{-1} .

Tömegspektrum (m/z): 367 (M^+), 261.

31. példa

1,5 g 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-klór-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin, 1,8 g S-kálium-tioacetát és 10 mg nátrium-jodid 30 ml acetonnal készült elegyét 48 órán át forraljuk. Utána az oldószert ledesztilláljuk, a maradékot feloldjuk kloroformban, és az oldatot vízzel mossuk. A szerves részt vizes nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal kirázzuk, a kapott vizes részt sósavval megsavanyítjuk, és kloroformmal kirázzuk. A szerves részről az oldószert ledesztillálva, majd a maradékot acetontól kristályosítva sárgaszínű, kristályos anyag formájában 0,5 g 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-merkaptó-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolint kapunk, op.: 210 - 212°C.

IR-spektrum (nujol): 1610, 1580, 1540, 1480 cm^{-1} .

^1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.49 (3H, s), 3.37 (3H, s)

3.53 (3H, s), 7.1-7.7 (8H, m),

7.82 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 11.86 (1H, s).

Tömegspektrum (m/z): 370 (M^+).



Analízis a $C_{19}H_{18}N_2O_2S_2$ képlet alapján:

számított: C: 61,60, H: 4,90, N: 7,56;

talált: C: 61,60, H: 4,78, N: 7,45.

32. példa

0,3 g 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-
-klór-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin és 0,11 g nátrium-metilát
5 ml metanollal készült elegyét 3,5 órán át 40°C hőmérsékleten
keverjük. Utána az elegyét megsűrjük, és a szürletről az oldó-
szert ledesztilláljuk. A maradékot vízzel mossuk, ily módon
szintelen, kristályos anyag formájában 0,28 g 1-metil-2-oxo-3-
-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-metoxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-
-kinolint kapunk, op.: 148 - 151°C.

IR-spektrum (nujol): 1640, 1620, 1590, 1575, 1495 cm^{-1} .

1H -NMR-spektrum (DMSO- d_6), delta: 2.48 (3H, s), 3.35 (3H, s)

3.47 (3H, s), 4.10 (3H, s), 7.1-7.9 (8H, m).

Tömegspektrum (m/z): 368 (M^+), 262.

33. példa

0,28 g 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-(4-nitro-fenil)-
-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin, 0,28 g
vaspor és 30 mg ammónium-klorid 8 ml etanollal és 3 ml vízzel
készült elegyét 2 órán át keverve forraljuk. Utána az oldószert
ledesztilláljuk, a maradékot kloroform és víz kétfázisú elegyé-
ben szuszpendáljuk, és az oldatlan részeket kiszűrjük. A szer-
ves részt elválasztjuk, megszáritjuk, és az oldószert ledesz-
tilláljuk. A maradékot (0,26 g) etanollal mosva barnaszínű, por-



szerű anyag formájában 0,1 g 1-metil-2-oxo-3-/N-(4-amino-fenil)-
-N-metil-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolint
kapunk.

IR-spektrum (nujol): 3450, 3350, 3250, 1630, 1610, 1570,
1540, 1515 cm^{-1} .

Tömegspektrum (m/z): 369 (M^+).

34. példa

51 μl hangyasav és 128 μl ecetsav-anhidrid elegyét 30
percig 50°C hőmérsékleten keverjük, majd lehütjük. Hozzáadunk
0,1 g 1-metil-2-oxo-3-/N-(4-amino-fenil)-N-metil-karbamoil/-4-
-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolint, és az elegyet 40 per-
cig szobahőmérsékleten keverjük. Ezután hozzáadunk 0,5 ml ecet-
sav-anhidridet, és az elegyet 3 órán át keverjük. Ezt követően a
reakcióelegyet jeges vízre öntjük, a csapadékot kiszűrjük, és
vizzel mossuk. A kapott terméket feloldjuk 1 ml 0,4 normál ná-
trium-hidroxid-oldatban, és az oldatot megsűrjük. A szűrletet só-
savval megsavanyítjuk, és a csapadékot kiszűrjük. Ily módon
barnaszínű, porszerű anyag formájában 58 mg 1-metil-2-oxo-3-/N-
-/4-(formil-amino)-fenil/-N-metil-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-
-tio-1,2-dihidro-kinolint kapunk.

IR-spektrum (nujol): 3450, 3250, 1630, 1565, 1510 cm^{-1} .

Tömegspektrum (m/z): 397 (M^+), 247.

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. (I) általános képletű, ahol
- R^1 jelentése rövidszénláncú alkilcsoport vagy adott esetben egy vagy több alkalmas csoporttal helyettesített arilcsoport,
- R^2 jelentése hidroxilcsoport, védett hidroxilcsoport, rövidszénláncú alkoxics csoport, halogénatom, aminocsoport, helyettesített aminocsoport, merkaptocsoport vagy védett merkaptocsoport,
- R^3 jelentése hidrogénatom, rövidszénláncú alkilcsoport, rövidszénláncú alkoxics csoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport vagy arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport, és
- R^8 jelentése hidrogénatom, vagy pedig
- R^3 és R^8 együttes jelentése rövidszénláncú alkilcsoport,
- R^4 jelentése valamely szerves csoport,
- Z jelentése oxigénatom vagy kénatom, és
- n jelentése 0, 1 vagy 2,
- vegyületek és ezek gyógyászatilag elfogadható sói.

2. Az 1. igénypont szerinti, olyan (I) általános képletű vegyületek, ahol
- R^1 jelentése rövidszénláncú alkilcsoport vagy adott esetben halogénatommal helyettesített fenilcsoport,
- R^2 jelentése hidroxilcsoport, aciloxics csoport, rövidszénláncú alkoxics csoport, halogénatom, aminocsoport,

rövidszénláncú alkil-amino-csoport, védett amino-csoport, merkaptocsoport vagy acil-tio-csoport,

R^3 jelentése hidrogénatom, rövidszénláncú alkilcsoport, rövidszénláncú alkoxicsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport vagy fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport, és

R^8 jelentése hidrogénatom, vagy pedig

R^3 és R^8 együttes jelentése rövidszénláncú alkiléncsoport, és

R^4 jelentése acilcsoport, karboxilcsoport, arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfinil-csoport, arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-tio-csoport, cianocsoport vagy adott esetben egy vagy több alkalmas csoporttal helyettesített heterociklusos csoport.

3. A 2. igénypont szerinti, olyan általános képletű vegyületek, ahol

R^1 jelentése rövidszénláncú alkilcsoport, fenilcsoport vagy halogén-fenil-csoport,

R^2 jelentése hidroxilcsoport, aciloxicsoport, rövidszénláncú alkoxicsoport, halogénatom, aminocsoport, rövidszénláncú alkil-amino-csoport, acil-amino-csoport, merkaptocsoport vagy rövidszénláncú alkanoil-tio-csoport, és

R^4 jelentése adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal helyette-



sitett karbamoilcsoport; adott esetben 1-3 alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal, halogénatommal, rövidszénláncú alkoxics csoporttal, rövidszénláncú alkil-tio-csoporttal, acilcsoporttal, di(rövidszénláncú alkil)-amino-csoporttal, cianocsoporttal, egy, két vagy három halogénatommal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoporttal, egy, két vagy három halogénatommal helyettesített rövidszénláncú alkoxics csoporttal, karboxilcsoporttal, védett karboxilcsoporttal, nitrocsoporttal, aminocsoporttal és/vagy acil-amino-csoporttal helyettesített fenilcsoport; adott esetben rövidszénláncú alkilcsoporttal helyettesített heterociklusos csoport; fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkilcsoport; rövidszénláncú cikloalkilcsoport vagy (a) általános képletű csoport, ahol

A jelentése rövidszénláncú alkilén-csoport; adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal és/vagy arilcsoporttal helyettesített tiokarbamoilcsoport; rövidszénláncú alkoxi-karbonil-csoport; adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal és/vagy arilcsoporttal helyettesített amino-szulfonil-csoport; aroilcsoport; arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú cikloalkil-karbonil-csoport; arilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfonil-csoport; egy hetero-

ciklusos karbonsavból leszármaztatható acilcsoport;
 karboxilcsoport; arilcsoporttal helyettesített
 rövidszénláncú alkil-szulfinil-csoport; arilcsoport-
 tal helyettesített rövidszénláncú alkil-tio-csoport;
 cianocsoport; vagy adott esetben rövidszénláncú alkil-
 csoporttal vagy arilcsoporttal helyettesített hetero-
 ciklusos csoport.

4. A 3. igénypont szerinti, olyan (I) általános képletű
 vegyületek, ahol

R^4 jelentése adott esetben egy vagy két alkalmas csoport-
 tal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal, fenil-
 csoporttal, egy vagy két rövidszénláncú alkilcsoportot
 viselő fenilcsoporttal, egy vagy két halogénatomot vi-
 selő fenilcsoporttal, rövidszénláncú alkoxics csoportot
 viselő fenilcsoporttal, rövidszénláncú alkil-tio-cso-
 portot viselő fenilcsoporttal, rövidszénláncú alkanoil-
 csoportot viselő fenilcsoporttal, N,N-di(rövidszénláncú
 alkil)-amino-csoportot viselő fenilcsoporttal, ciano-
 -fenil-csoporttal, három halogénatomot tartalmazó
 rövidszénláncú alkilcsoportot viselő fenilcsoporttal,
 három halogénatomot tartalmazó rövidszénláncú alkoxi-
 csoportot viselő fenilcsoporttal, karboxi-fenil-
 -csoporttal, rövidszénláncú alkoxi-karbonil-csoportot
 viselő fenilcsoporttal, nitro-fenil-csoporttal,
 amino-fenil-csoporttal, rövidszénláncú alkanoil-
 -amino-csoportot viselő fenilcsoporttal, piridil-

csoporttal, rövidszénláncú alkilcsoportot viselő pirazolilcsoporttal, pirrolilcsoporttal, tiazolilcsoporttal, tiadiazolilcsoporttal, benzodioxolilcsoporttal, fenilcsoportot viselő rövidszénláncú alkilcsoporttal, rövidszénláncú cikloalkilcsoporttal és/vagy indanilcsoporttal helyettesített karbamoilcsoport;

adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal és/vagy fenilcsoporttal helyettesített tiokarbamoilcsoport; rövidszénláncú alkoxi-karbonil-csoport;

adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal és/vagy fenilcsoporttal helyettesített amino-szulfonil-csoport;

benzoilcsoport; fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú cikloalkil-karbonil-csoport; fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfonil-csoport; indolinil-karbonil-csoport; dihidro-benzoxazinil-karbonil-csoport; dihidro-benzotiazinil-karbonil-csoport; karboxilcsoport; fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfonil-csoport; fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-tio-csoport; cianocsoport; adott esetben arilcsoporttal helyettesített imidazolinilcsoport vagy

tetrazolilcsoport; adott esetben arilcsoporttal helyettesített oxadiazolilcsoport; vagy adott esetben

rövidszénláncú alkilcsoporttal helyettesített benzimidazolilcsoport, kinolilcsoport vagy izokinolilcsoport.

5. A 4. igénypont szerinti, olyan (I) általános képletű vegyületek, ahol

R^4 jelentése adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal, fenilcsoporttal, egy vagy két rövidszénláncú alkilcsoportot viselő fenilcsoporttal, egy vagy két halogénatomot viselő fenilcsoporttal, rövidszénláncú alkoxicssoportot viselő fenilcsoporttal, rövidszénláncú alkil-tio-csoportot viselő fenilcsoporttal, rövidszénláncú alkanoilcsoportot viselő fenilcsoporttal, N,N-di(rövidszénláncú alkil)-amino-csoportot viselő fenilcsoporttal, ciano-fenil-csoporttal, három halogénatomot tartalmazó rövidszénláncú alkilcsoportot viselő fenilcsoporttal, három halogénatomot tartalmazó rövidszénláncú alkoxicssoportot viselő fenilcsoporttal, karboxi-fenil-csoporttal, rövidszénláncú alkoxi-karbonil-csoportot viselő fenilcsoporttal, nitro-fenil-csoporttal, amino-fenil-csoporttal, rövidszénláncú alkanoil-amino-csoportot viselő fenilcsoporttal, piridilcsoporttal, rövidszénláncú alkilcsoportot viselő pirazolilcsoporttal, pirrolilcsoporttal, tiazolilcsoporttal, tiadiazolilcsoporttal, 1,3-benzodioxolil-csoporttal, fenilcsoportot viselő rövidszénláncú alkilcsoporttal,

rövidszénláncú cikloalkilcsoporttal és/vagy indán-2-il-csoporttal helyettesített karbamoilcsoport; adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal és/vagy fenilcsoporttal helyettesített tiokarbamoilcsoport; rövidszénláncú alkoxi-karbonil-csoport; adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal és/vagy fenilcsoporttal helyettesített amino-szulfonil-csoport; benzoilcsoport; fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú cikloalkil-karbonil-csoport; fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfonil-csoport; indolinil-karbonil-csoport; dihidro-benzoxazinil-karbonil-csoport; dihidro-benzotiazinil-karbonil-csoport; karboxilcsoport; fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-szulfonil-csoport; fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú alkil-tio-csoport; cianocsoport; imidazolinilcsoport; fenil-imidazolinil-csoport; tetrazolilcsoport; fenil-tetrazolil-csoport; oxadiazolilcsoport; fenil-oxadiazolil-csoport; benzimidazolilcsoport; rövidszénláncú alkil-benzimidazolil-csoport; kinolilcsoport; vagy izokinolilcsoport.

6. Az 5. igénypont szerinti, olyan (I) általános képletű vegyületek, ahol

- R¹ jelentése rövidszénláncú alkilcsoport, fenilcsoport vagy halogén-fenil-csoport,
- R² jelentése hidroxilcsoport,
- R³ jelentése rövidszénláncú alkilcsoport, és
- R⁸ jelentése hidrogénatom, vagy pedig
- R³ és R⁸ együttes jelentése rövidszénláncú alkilén-csoport,
- R⁴ jelentése adott esetben egy vagy két alkalmas csoporttal, például rövidszénláncú alkilcsoporttal, fenilcsoporttal, egy vagy két halogénatomot viselő fenilcsoporttal, rövidszénláncú alkoxicssoportot viselő fenilcsoporttal, rövidszénláncú alkilcsoportot viselő fenilcsoporttal, ciano-fenil-csoporttal, pirrolilcsoporttal, három halogénatomot tartalmazó rövidszénláncú alkoxicssoportot viselő fenilcsoporttal, három halogénatomot tartalmazó rövidszénláncú alkilcsoportot viselő fenilcsoporttal, nitro-fenil-csoporttal, amino-fenil-csoporttal, 1,3-benzodioxolil-csoporttal és/vagy rövidszénláncú alkanoil-amino-csoportot viselő fenilcsoporttal helyettesített karbamoilcsoport, vagy fenilcsoporttal helyettesített rövidszénláncú cikloalkil-karbonil-csoport,
- Z jelentése oxigénatom vagy kénatom, és
- n jelentése 0 vagy 1.

7. A 6. igénypont szerinti valamely vegyület, mégpedig

- 1) 1-metil-2-oxo-3-/N-(4-fluor-fenil)-N-metil-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,

- 2) 1-metil-2-oxo-3-/N-(4-metoksi-fenil)-N-metil-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 3) 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil)-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-szulfinil-1,2-dihidro-kinolin,
- 4) 1-metil-2-oxo-3-/N-metil-N-fenilamino-(tio-karbonil)/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 5) 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-etil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 6) 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-fenil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 7) 1-metil-2-oxo-3-/N-(2-metil-fenil)-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 8) 1-metil-2-oxo-3-(N-etil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 9) 4-oxo-5-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-6-hidroxi-8-metil-tio-1,2-dihidro-4H-pirrolo/3,2,1-ij/-kinolin,
- 10) 1-metil-2-tioxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 11) 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-fenil-szulfinil-1,2-dihidro-kinolin,
- 12) 1-metil-2-oxo-3-(N-metil-N-fenil-karbamoil)-4-hidroxi-6-(4-fluor-fenil-tio)-1,2-dihidro-kinolin,
- 13) 1-metil-2-oxo-3-(1-fenil-1-ciklopropil-karbonil)-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 14) 1-metil-2-oxo-3-/N-metil-N-(1-pirrolil)-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 15) 1-metil-2-oxo-3-/N-(4-ciano-fenil)-N-metil-karbamoil/-

- 4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 16) 1-metil-2-oxo-3-/N-metil-N-/4-(trifluor-metoxi)-fenil/-
-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 17) 1-metil-2-oxo-3-/N-metil-N-/3-(trifluor-metil)-fenil/-
-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 18) 1-metil-2-oxo-3-/N-metil-N-(4-nitro-fenil)-karbamoil/-4-
-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 19) 1-metil-2-oxo-3-/N-(4-amino-fenil)-4-metil-karbamoil/-4-
-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 20) 1-metil-2-oxo-3-/N-/4-(formil-amino)-fenil/-N-metil-
karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 21) 1-metil-2-oxo-3-/N-(1,3-benzodioxol-5-il)-N-metil-
-karbamoil/-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin,
- 22) 1-metil-2-oxo-3-/N-(2,4-difluor-fenil)-N-metil-karbamoil/-
-4-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin, vagy
- 23) 1-metil-2-oxo-3-/N-metil-N-(4-metil-fenil)-karbamoil/-4-
-hidroxi-6-metil-tio-1,2-dihidro-kinolin.

8. Eljárás az (I) általános képletű, ahol

- R^1 jelentése rövidszénláncú alkilcsoport vagy adott eset-
ben egy vagy több alkalmas csoporttal helyettesített
arilcsoport,
- R^2 jelentése hidroxilcsoport, védett hidroxilcsoport,
rövidszénláncú alkoxicssoport, halogénatom, aminocso-
port, helyettesített aminocsoport, merkaptocsoport vagy
védett merkaptocsoport,
- R^3 jelentése hidrogénatom, rövidszénláncú alkilcsoport,

rövidszénláncú alkoxicsoporthal helyettesített
 rövidszénláncú alkilcsoport vagy arilcsoporttal helyet-
 tesített rövidszénláncú alkilcsoport, és

R^8 jelentése hidrogénatom, vagy pedig
 R^3 és R^8 együttes jelentése rövidszénláncú alkilénecsoporthal,
 R^4 jelentése valamely szerves csoport,
 Z jelentése oxigénatom vagy kénatom, és
 n jelentése 0, 1 vagy 2,

vegyületek és ezek sói előállítására, azzal j e l l e m e z v e,
 hogy

- a) valamely (II) általános képletű, ahol
 R^1 , R^3 , R^8 és n jelentése a fenti,
 vegyületet vagy ennek sóját egy (III) általános képletű, ahol
 R^4 és Z jelentése a fenti, és
 R^5 jelentése lehasadó csoport,
 vegyülettel vagy ennek sójával reagáltatjuk, és így olyan (Ia)
 általános képletű vegyületet vagy ennek sóját állítjuk elő, ahol
 R^1 , R^3 , R^4 , R^8 , Z és n jelentése a fenti, vagy
- b) valamely (Ib) általános képletű, ahol
 R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^8 és Z jelentése a fenti,
 vegyületet vagy ennek sóját oxidáljuk, és így olyan (Ic)
 általános képletű vegyületet vagy ennek sóját állítjuk elő, ahol
 R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^8 és Z jelentése a fenti, és
 m jelentése 1 vagy 2, vagy
- c) valamely (Id) általános képletű, ahol
 R^1 , R^2 , R^3 , R^8 , Z és n jelentése a fenti,
 vegyületet, ennek a karboxilcsoporton aktivált származékát vagy

sóját amidáljuk, és így olyan (Ie) általános képletű vegyületet vagy ennek sóját állítjuk elő, ahol

R^1 , R^2 , R^3 , R^8 , Z és n jelentése a fenti, és

a $-CO-R^6$ általános képletű csoport jelentése amidált karboxilcsoport,

vagy

d) valamely (If) általános képletű, ahol

R^1 , R^2 , R^3 , R^8 , Z és n jelentése a fenti, és

R^4_a jelentése védett karboxilcsoport,

vegyületről vagy sójáról lehasítjuk az R^4_a csoportban szereplő karboxi-védőcsoportot,

és így olyan (Id) általános képletű vegyületet vagy ennek sóját állítjuk elő, ahol

R^1 , R^2 , R^3 , R^8 , Z és n jelentése a fenti,

vagy

e) valamely (Ig) általános képletű, ahol

R^1 , R^2 , R^3 , R^8 , Z és n jelentése a fenti, és

R^4_b jelentése védett karboxilcsoportot tartalmazó acilcsoport,

vegyületről vagy sójáról lehasítjuk a karboxi-védőcsoportot, és így olyan (Ih) általános képletű vegyületet vagy ennek sóját állítjuk elő, ahol

R^1 , R^2 , R^3 , R^8 , Z és n jelentése a fenti, és

R^4_c jelentése karboxilcsoportot tartalmazó acilcsoport,

vagy

f) valamely (IV) általános képletű vegyülete, ahol

- R^1 és n jelentése a fenti,
 vegyületet vagy ennek sóját egy (V) általános képletű, ahol
 R^4 jelentése a fenti, és
 X^1 jelentése lehasadó csoport,
 vegyülettel vagy ennek sójával reagáltatjuk, és így olyan (Ii)
 általános képletű vegyületet vagy ennek sóját állítjuk elő, ahol
 R^1 , R^4 és n jelentése a fenti,
 vagy
- g) valamely (VI) általános képletű, ahol
 R^1 , R^3 , R^4 , R^8 , Z és n jelentése a fenti, és
 X^2 jelentése lehasadó csoport,
 vegyületet vagy ennek sóját gyűrűbe zárjuk, és így olyan (Ia)
 általános képletű vegyületet vagy ennek sóját állítjuk elő, ahol
 R^1 , R^3 , R^4 , R^8 , Z és n jelentése a fenti,
 vagy
- h) valamely (Ia) általános képletű, ahol
 R^1 , R^3 , R^4 , R^8 , Z és n jelentése a fenti,
 vegyületet vagy ennek sóját halogénezzük, és így olyan (Ij)
 általános képletű vegyületet vagy ennek sóját állítjuk elő, ahol
 R^1 , R^3 , R^4 , R^8 , Z és n jelentése a fenti, és
 R^2_a jelentése halogénatom,
 vagy
- i) valamely (Ik) általános képletű, ahol
 R^1 , R^3 , R^4 , R^8 , Z és n jelentése a fenti, és
 X^3 jelentése lehasadó csoport,
 vegyületet vagy ennek sóját egy (VII) általános képletű, ahol

R^2_b jelentése aminocsoport vagy védett aminocsoport, vegyülettel vagy ennek sójával reagáltatjuk, és így olyan (II) általános képletű vegyületet vagy ennek sóját állítjuk elő, ahol R^1 , R^2_b , R^3 , R^4 , R^8 , Z és n jelentése a fenti,

vagy

j) valamely (Ik) általános képletű, ahol

R^1 , R^3 , R^4 , R^8 , Z, n és X^3 jelentése a fenti,

vegyületet vagy ennek sóját egy (VIII) általános képletű, ahol

R^2_c jelentése védett merkaptocsoport, és

M^1 jelentése alkálifém-atom,

vegyülettel vagy ennek sójával reagáltatjuk, és így olyan (Im)

általános képletű vegyületet vagy ennek sóját állítjuk elő, ahol

R^1 , R^2_c , R^3 , R^4 , R^8 , Z és n jelentése a fenti,

vagy

k) valamely (Im) általános képletű, ahol

R^1 , R^2_c , R^3 , R^4 , R^8 , Z és n jelentése a fenti,

vegyületről vagy ennek sójáról lehasítjuk a merkaptó-védőcso-

portot, és így olyan (In) általános képletű vegyületet vagy ennek

sóját állítjuk elő, ahol

R^1 , R^3 , R^4 , R^8 , Z és n jelentése a fenti,

vagy

l) valamely (Ik) általános képletű, ahol

R^1 , R^3 , R^4 , R^8 , Z, n és X^3 jelentése a fenti,

vegyületet vagy ennek sóját egy (IX) általános képletű, ahol

R^2_d jelentése rövidszénláncú alkoxicssoport, és

M^2 jelentése alkálifém-atom,

vegyülettel vagy ennek sójával reagáltatjuk, és így olyan (Io)

általános képletű vegyületet vagy ennek sóját állítjuk elő, ahol R^1 , R^2_d , R^3 , R^4 , R^8 , Z és n jelentése a fenti,

vagy

m) valamely (Ip) általános képletű, ahol

R^1 , R^2 , R^3 , R^8 , Z és n jelentése a fenti, és

R^4_d jelentése nitrocsoportot tartalmazó acilcsoport,

vegyületet vagy ennek sóját redukáljuk, és így olyan (Iq)

általános képletű vegyületet vagy ennek sóját állítjuk elő, ahol

R^1 , R^2 , R^3 , R^8 , Z és n jelentése a fenti, és

R^4_e jelentése aminocsoportot tartalmazó acilcsoport,

vagy

n) valamely (Iq) általános képletű, ahol

R^1 , R^2 , R^3 , R^4_e , R^8 , Z és n jelentése a fenti,

vegyületet vagy ennek sóját acilezzük, és így olyan (Ir)

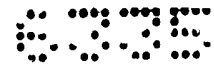
általános képletű vegyületet vagy ennek sóját állítjuk elő, ahol

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^8 , Z és n jelentése a fenti, és

R^4_f jelentése acil-amino-csoportot tartalmazó acilcsoport.

9. Gyógyászati készítmény, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként valamely, az 1. igénypontban meghatározott vegyületet vagy ennek gyógyászatilag elfogadható sóját tartalmazza, gyógyászatilag elfogadható vivőanyagok kíséretében.

10. Eljárás az 1. igénypont szerinti vegyületeknek vagy ezek gyógyászatilag elfogadható sóinak mint immunmoduláló szereknek, gyulladáscsökkentő szereknek vagy rákellenes szereknek az alkalmazására.



11. Eljárás gyulladássos állapotok, a fájdalom különféle formái, kollagén betegségek, autoimmun betegségek, különféle immunológiai betegségek vagy rák megelőző vagy gyógyászati kezelésére, azzal jellemezve, hogy egy embernek vagy állatnak valamely, az 1. igénypontban meghatározott vegyületet vagy ennek gyógyászati tilag elfogadható sóját adagoljuk.

12. Eljárás gyógyászati készítmények előállítására, azzal jellemezve, hogy valamely, az 1. igénypontban meghatározott vegyületet vagy ennek gyógyászati tilag elfogadható sóját a gyógyászati tilag elfogadható vivőanyagokkal és segédanyagokkal összekeverve alkalmas gyógyszerformává alakítunk.

s 17. lap rajt

17

A meghatalmazott

Dr. Szentpéteri Katalin
szabadalmi ügyvéd
az S.A.G. & K. Bírósági Ügyvédek
Szabadság útján
H-1061 Budapest, Pf. 10. 10.
Telefon: 153-5713 Fax: 153-3654

2882/93

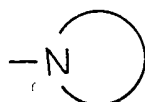
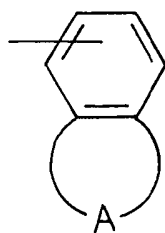
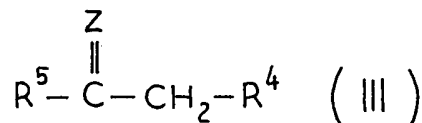
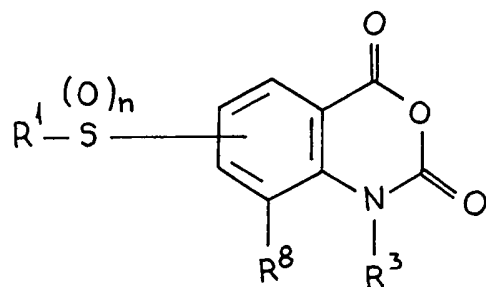
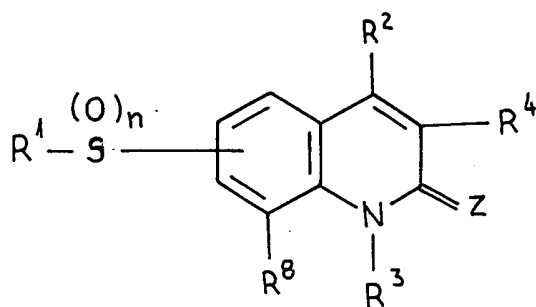
67349

57997/8vE

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

67349

17/1



(c)

ifj. Szentpéteri Ádám
szabadalmi ügyvivő
az S.M. & K. Budapesti Nemzetközi
Szabványügyi Bizottság tagja
H-1001 Budapest, Dalszínház u. 10.
Telefon: 153-3733, Fax: 153-3664

2983/97



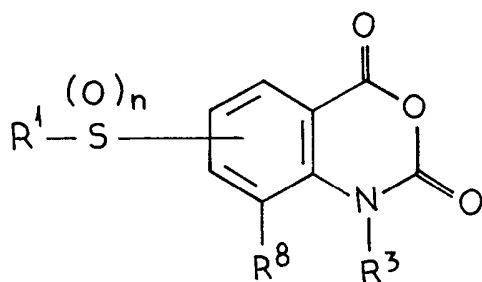
37937/SE

**KÖZZÉTÉTELI
PÉLDÁNY**

17/2

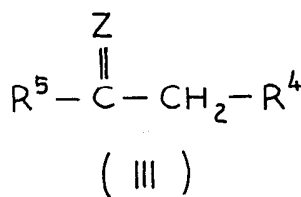
1. reakcióvázlat

(1) eljárás

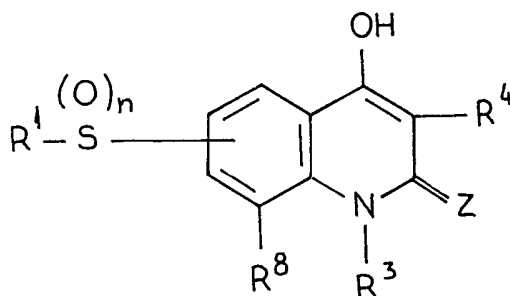


(II)

vagy sói



vagy sói

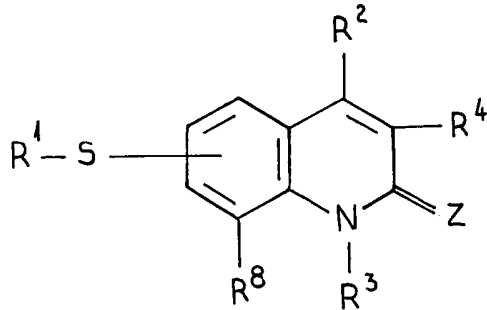


(Ia)

vagy sói

ifj. Szentpéteri Ádám
Azabírói ügyívő
az S.E.H. & K. Budapesti Nemzetközi
Szabványi Iroda tagja
H-1061 Budapest, Dalszínház u. 10.
Telefon: 153-3733, Fax: 153-3664

(2) eljárás

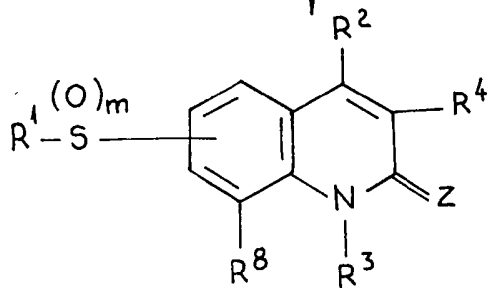


(1b)

vagy sói



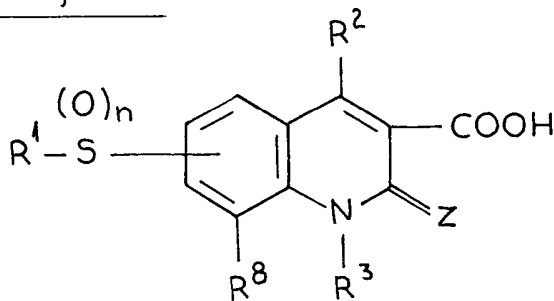
oxidáció



(1c)

vagy sói

(3) eljárás



(1d)

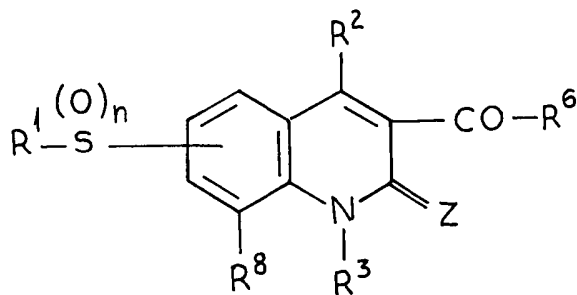
vagy a karboxilcsoporton képezett reakcióképes származéka, vagy sói



17/4

(3) eljárás (folytatás)

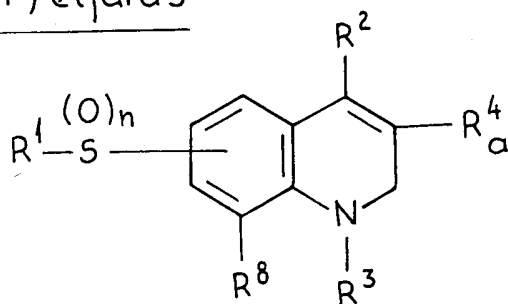
↓ Amidálási reakció



(1e)

vagy sói

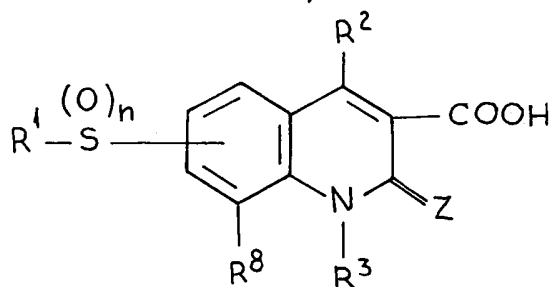
(4) eljárás



(1f)

vagy sói

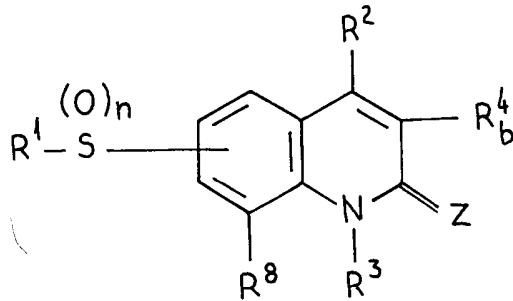
↓ R_a helyzetű karboxil-csoportot eltávolító reakció



(1d)

vagy sói

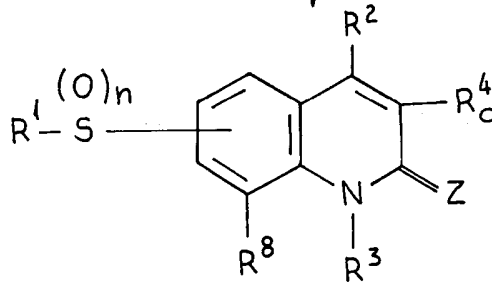
(5) eljárás



(1g)

vagy sói

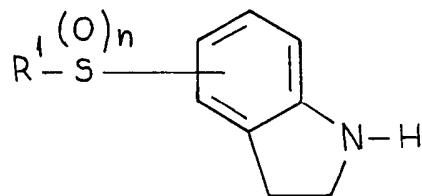
↓ karboxil-védőcsoport eltávolítási reakció



(1h)

vagy sói

(6) eljárás



(IV)

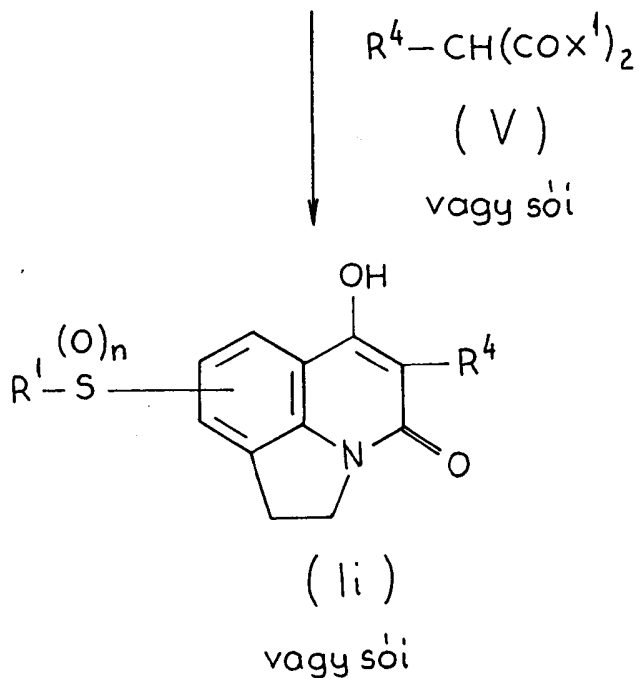
vagy sói

↓

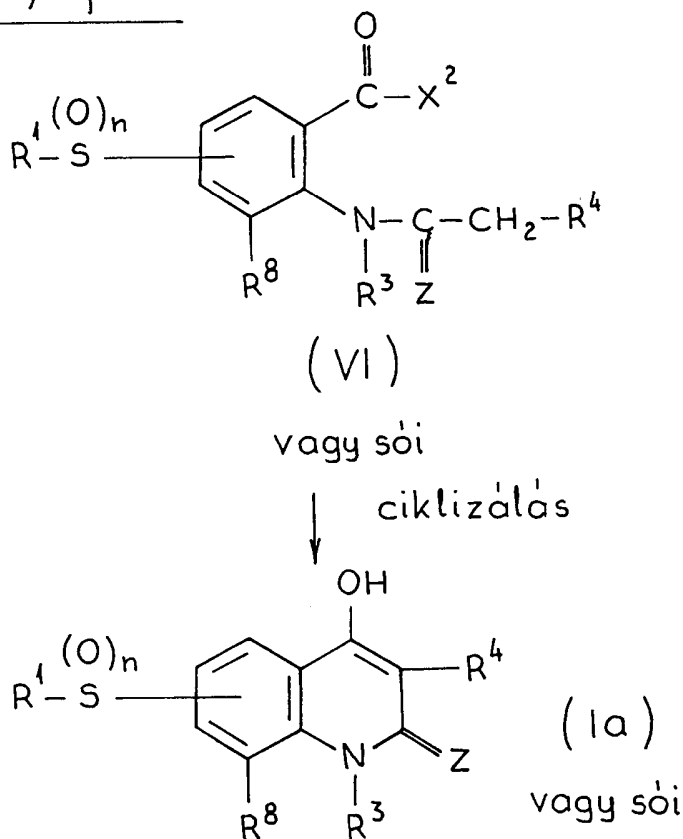
ifj. Szentpéteri Ádám
szabadalmi ügyvivő
az S.B.C. & K. Budapesti Nemzetközi
Szabadalmi Iroda keretében
H-106 Budapest, Dalszínház u. 10.
Telefon: 153-3733, Fax: 153-3664

17/6

(6) eljárás (folytatás)

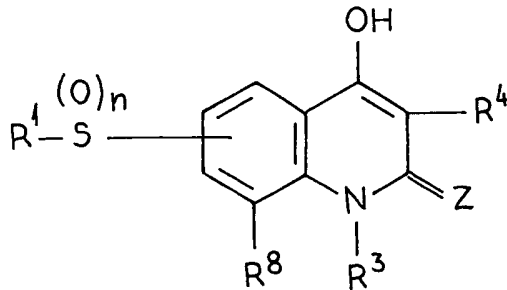


(7) eljárás



17/7

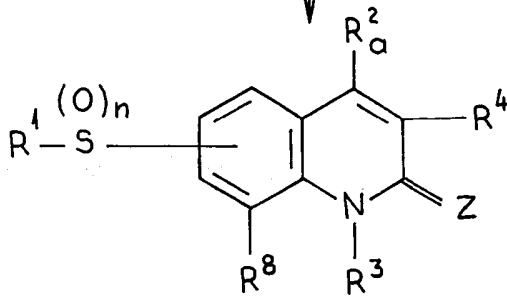
(8) eljárás



(1a)

vagy sói

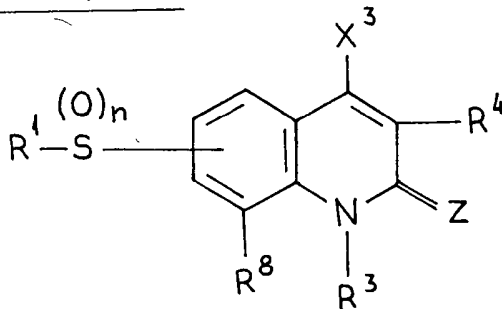
halogénezés



(1j)

vagy sói

(9) eljárás



(1k)

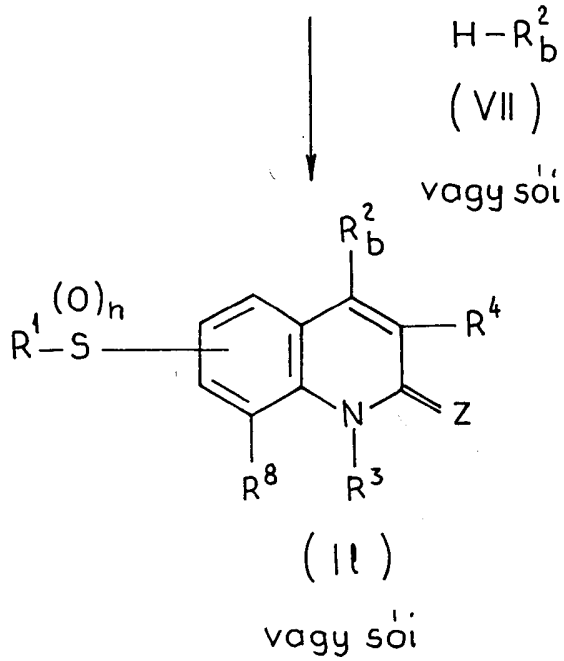
vagy sói



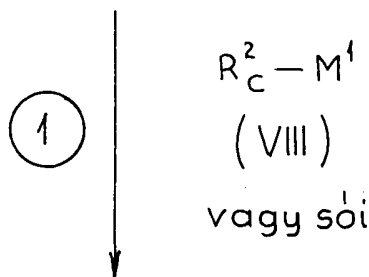
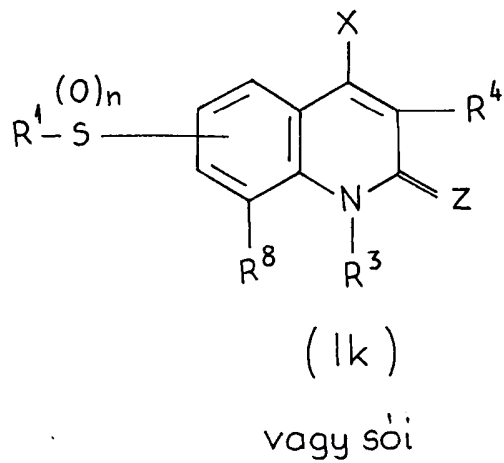
ifj. Szentpéteri Ádám
szabadalmi ügyvivő
az S.B.G. & K. Buitoni és Nemzetközi
Szabadalmi Iroda
H-1081 Budapest, Delszínház u. 10.
Telefon: 153-3733, Fax: 153-3664

17/8

(9) eljárás (folytatás)

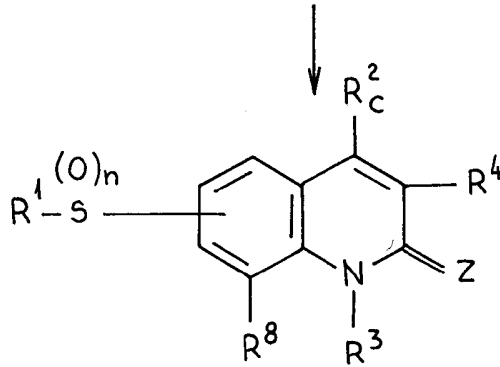


(10) eljárás



17/9

(10) eljárás (folytatás)

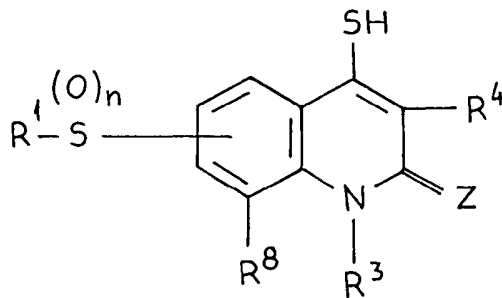


(Im)

vagy sói

2

A merkapto-védőcsoport
eliminálási reakciója

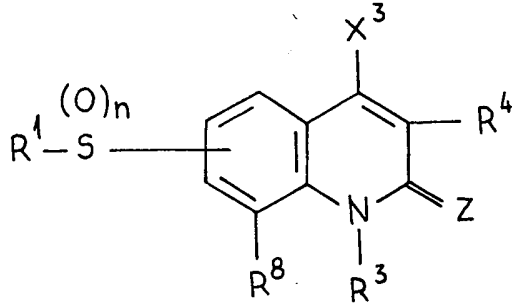


(In)

vagy sói

(11) eljárás

17/10



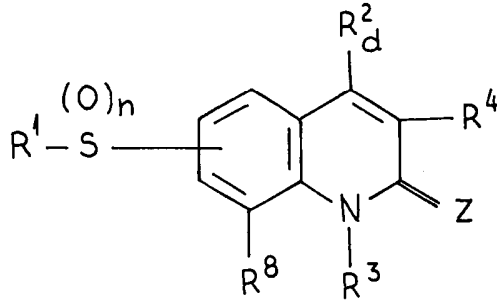
(Ik)

vagy sói



$R^2_d - M^2$
(IX)

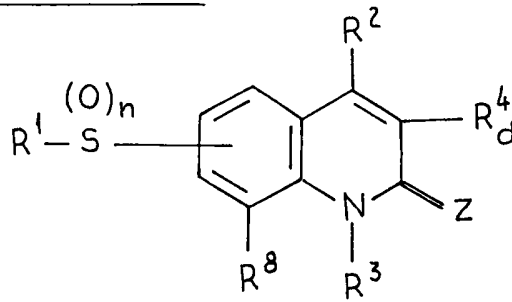
vagy sói



(I0)

vagy sói

(12) eljárás



(Ip)

vagy sói

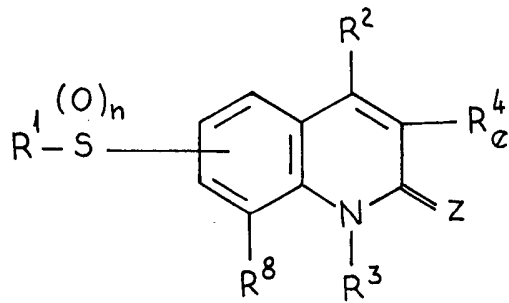


ifj. Szentpéteri Ádám
szabadalmi ügyvivő
az S.B.É. & K. Budapesti Nemzetközi
Patent- és Irodák Rt.-nél
H-1061 Budapest, Deáktervező u. 10.
Telefon: 153-3733, Fax: 153-3664

17/11

(12) eljárás (folytatás)

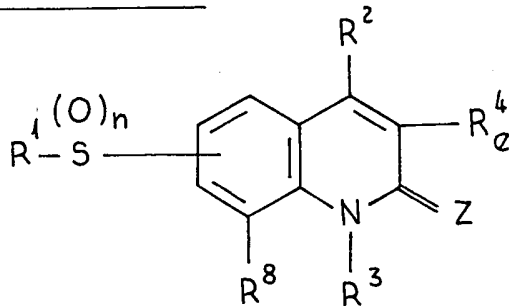
↓ Redukció



(1q)

vagy sói

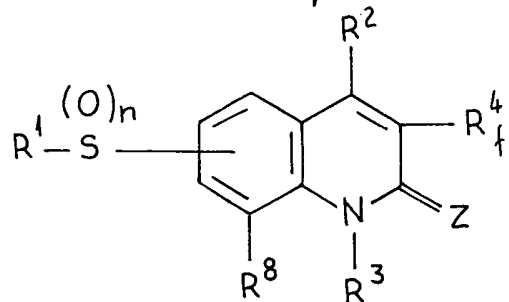
(13) eljárás



(1q)

vagy sói

↓ acilezés



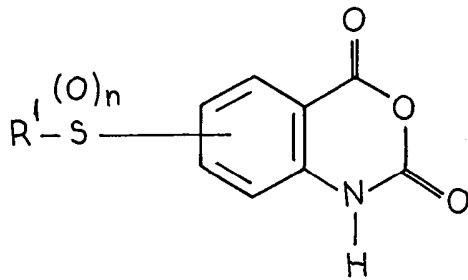
(1r)

vagy sói

17/12

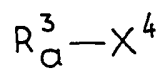
2. reakcióvázlat

(A) eljárás



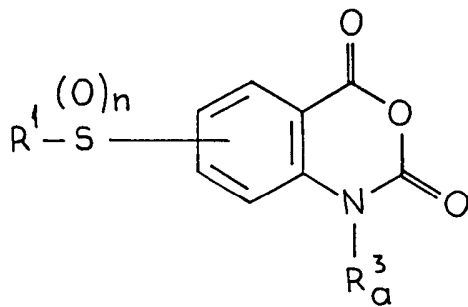
(IIa)

vagy sói



(X)

vagy sói

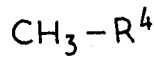


(IIb)

vagy sói

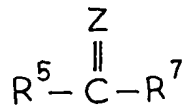
(B) eljárás

17/13,



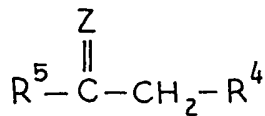
(XI)

vagy sói



(XII)

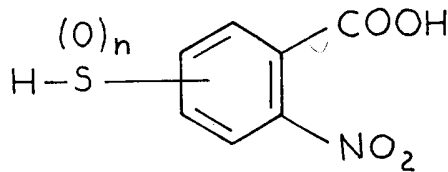
vagy sói



(III)

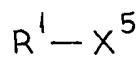
vagy sói

(C) eljárás



(XIII)

vagy sói



(XIV)

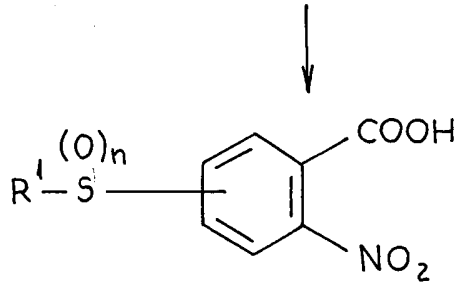
vagy sói

∴

ifj. Szentpéteri Ádám
szabadalmi ügyvivő
az S.H.G. & K. Budapesti Nemzetközi
Szabadalmi Iroda tagja
H-1061 Budapest, Daiszínház u. 10.
Telefon: 153-3733, Fax: 153-3664

17/14

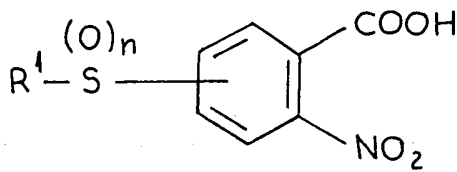
(C) eljárás (folytatás)



(XV)

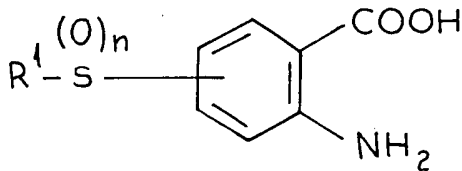
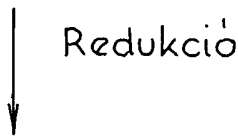
vagy sói

(D) eljárás



(XV)

vagy sói

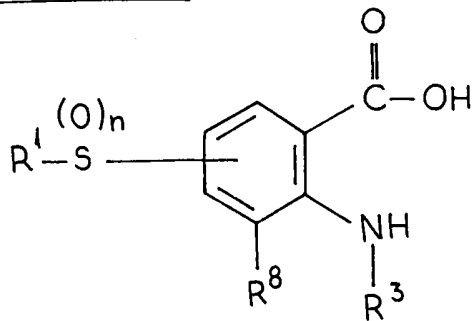


(XVIb)

vagy sói

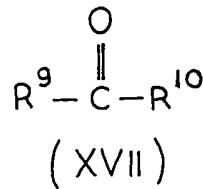
17/15

(E) eljárás



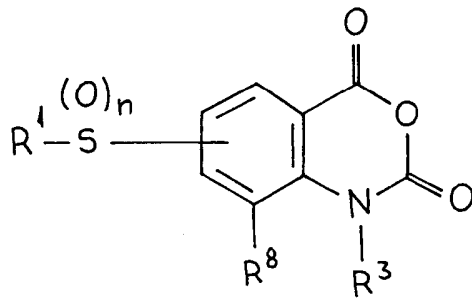
(XVIa)

vagy sói



(XVII)

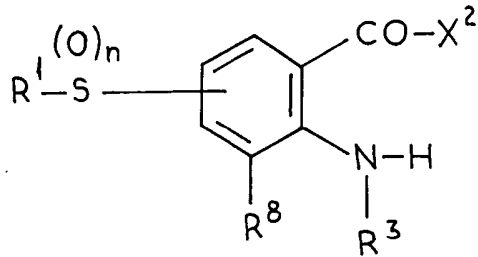
vagy sói



(II)

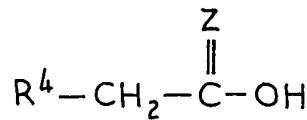
vagy sói

(F) eljárás



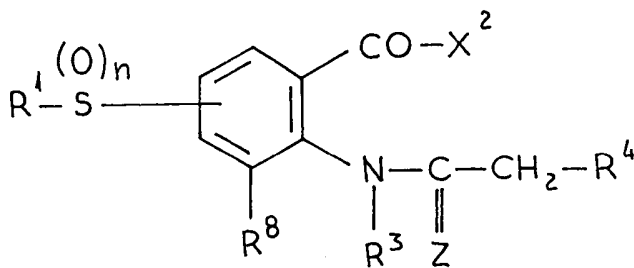
(XVIc)

vagy reakcióképes
származéka, vagy sói



(XVIII)

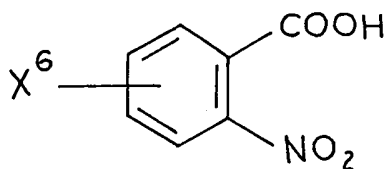
vagy reakcióképes
származéka, vagy sói



(VI)

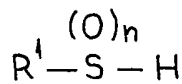
vagy sói

(G) eljárás



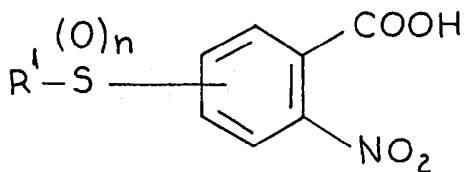
(XIX)

vagy sói



(XX)

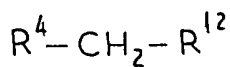
vagy sói



(XV)

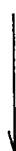
vagy sói

(H) eljárás

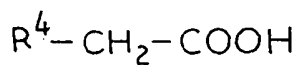


(XXII)

vagy sói



karboxil-védőcsoportot eltávolító reakció



(XVIIIa)

vagy sói