

(19) Országkód

HU



**MAGYAR
KÖZTÁRSASÁG
ORSZÁGOS
TALÁLMÁNYI
HIVATAL**

SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám

199803 B

(22) Bejelentés napja: 1987. 05. 01. (21) (2931/87)

(86) PCT/JP87/00276

(87) WO 87/06580

Bejelentés elsőbbsége: (33) 1986. 05. 02.
1987. 04. 15.

(32) JP JP

(31) 61/102847

62/92788

(51)

NSZO₅

CO7D 215/42

CO7D 401/12

CO7D 409/12

CO7F 9/09

A61K 31/47

(41) (42) Közzététel napja: 1989. 04. 28.

(45) Megadás meghirdetésének dátuma
a Szabadalmi Közlönyben: 1990. 03. 28.

(72) Feltaláló(k):
MOCHIDA, Ei Tokió
UEMURA, Akio
KATO, Kazuo Shizuoka
TOKUNAGA, Hiroki Tokió
HAGA, Akinori Kanagawa JP

(71) Szabadalmaz:
MOCHIDA PHARMACEUTICAL CO. LTD.;
Hodogaya Chemical Co. Ltd.
Tokió, JP

(74) Képviselő:
Danubia Szabadalmi Iroda Budapest

(54) **ELJÁRÁS 1-ACIL-2,3-DIHIDRO-4(1H)-KINOLIN-4-OXIM-SZÁRMAZÉKOK ÉS EZEKET TARTALMAZÓ GYÓGYSZERKÉSZÍTMÉNYEK ELŐÁLLÍTÁSÁRA**

(57) KIVONAT

A találmány szerinti eljárással előállított vegyületeket az (I) általános képlet szemlélteti - ahol

R¹ jelentése adott esetben helyettesített alkilcsoport, cikloalkilcsoport, benzil-, sztilil-, naftil-, piridil-, tienil-, pirazinil- vagy adott esetben helyettesített fenilcsoport,

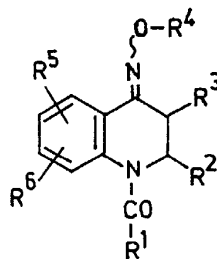
R² és R³ jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,

R⁴ jelentése karboxi-metil-, szulfo-, metánszulfonil- vagy metoxi-foszfo- csoport,

R⁵ és R⁶ jelentése hidrogén- vagy halogénatom, hidroxil-, metil-tio-, metil-szulfonil-, metánszulfonil-, dimetil-amino-, nitro-, acetyl-, metil-, trifluor-metil-, metoxi-karbonil- vagy metoxicssoport,

a hullámvonal szín- vagy anti-konfigurációt képvisel.

A találmány kiterjed a vegyületek sóinak, szolvátjainak és a sók szolvátjainak az előállítására. A vegyületek hipotenzív, antiödémás, diuretikus hatással rendelkeznek, és alkalmasak hasúri folyadék eltávolítására, így ilyen hatású gyógyszerkészítmények hatóanyagaként alkalmazhatók.



(I)

A leírás terjedelme: 32 oldal, 3 ábra

HU 199803 B

A találmány tárgya eljárás az (I) általános képletű 1-acil-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-4-oxim-származékok, és az ezeket tartalmazó gyógyszerkészítmények előállítására. A találmány tárgya továbbá eljárás az új (II) általános képletű 1-acil-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-származékok előállítására. A képletekben

R¹ jelentése 1 - 8 szénatomos, egyenes vagy elágazó szénláncú alkilcsoport, 1 - 4 szénatomos, halogénezett, egyenes vagy elágazó szénláncú alkilcsoport, 3 - 6 szénatomos cikloalkilcsoport, 1 - 4 szénatomos alkoxics csoport, metoxi-metil-csoport, metoxi-karbonil-etil-csoport, benzilcsoport, sztirilcsoport, naftilcsoport, piridilcsoport, tienilcsoport, pirazinilcsoport, adott esetben egy-háromszorosan helyettesített fenilcsoport, a helyettesítők lehetnek azonosak vagy eltérők, és pedig 1 - 4 szénatomos, egyenes vagy elágazó szénláncú alkilcsoport, hidroxilcsoport, nitrocs csoport, 1 - 4 szénatomos alkoxics csoport, trifluor-metil-csoport, halogénatom,

R² és R³ jelentése azonos vagy eltérő, és pedig metilcsoport vagy hidrogénatom,

R⁴ jelentése karboxi-metil-csoport, szulfocsoport, metánszulfonilcsoport vagy metoxi-foszfo-csoport,

R⁵ és R⁶ jelentése azonos vagy eltérő, és pedig hidrogénatom, halogénatom, hidroxilcsoport, metiltio-csoport, metil-szulfonil-csoport, metánszulfonilcsoport, N,N-dimetil-amino-csoport, nitrocs csoport, metilcsoport, trifluor-metil-csoport, metoxi-karbonil-csoport vagy metoxics csoport,

a hullámvonallal jelölt kötés anti- vagy szín-konfigurációt jelöl.

A találmány szerinti eljárással előállított vegyületek diuretikus hatással rendelkeznek, így alkalmasak magas vérnyomás, ödéma és/vagy hasvízkór kezelésére és/vagy megelőzésére.

A magas vérnyomás kezelésére a benzotiazid-származékokat vagy úgynevezett hurok diuretikumokat alkalmazzák széles körben. Ezek a szerek főleg a vesecsővecskék disztális részére vagy a Henle-hurokra hatnak, és fokozzák az elektrolitok és a víz kiválasztását a vesében.

Ezen diuretikumoknak azonban számos mellékhatása van, így például hipokalémia, hiperurikémia, a cukortűrőképesség csökkenése és a lipid metabolizmus zavara.

Diuretikumokat használnak a szív- vagy veseelégtelenség vagy metabolikus zavarok következtében fellépő víz és elektrolit visszatartás következtében keletkező ödéma kezelésére, ezek a szokásosan alkalmazott diuretikumok azonban csak csekély hatást gyakorolnak a hasúri folyadék visszatartására, amely a hasi daganatok vagy a májsugorodás kapcsán figyelhető meg.

Ismeretes, hogy a benzotiazid diuretikumok és hurokdiuretikumok hasonló kémiai szerkezettel rendelkeznek.

Célul tűztük ki olyan új diuretikumok kifejlesztését, amelyek alkalmasak a magas vérnyomás és az ödéma kezelésére, továbbá a hasúri folyadék eltávolítására, és amelyek nem mutatják az említett káros mellékhatásokat, és amelyeknek kémiai szerkezete új, és az ismert diuretikumokétól eltérő.

A találmány tárgya a fentiek alapján eljárás új, (I) általános képletű 1-acil-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-4-oxim-származékok és ezek sói előállítására.

A találmány tárgya továbbá eljárás olyan magas vérnyomás, ödéma és hasvízkór kezelésére szolgáló készítmények előállítására, amelyek hatóanyagként az új (I) általános képletű vegyületeket tartalmaznak. A (II) általános képletű új 1-acil-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-származékok az (I) általános képletű vegyületek előállításához alkalmazhatók.

A találmány szerinti eljárás különösen az (I) általános képletű vegyületek O-szulfátjai, O-mezilátjai, O-metil-foszfátjai és O-karboxi-metil-éterei, különösen O-szulfátjai előállítására vonatkozik.

Ezek a vegyületek különösen előnyös hipotenzív, antiödémás és diuretikus hatással rendelkeznek, továbbá a hasúri folyadékok eltávolítására alkalmasak, így különösen alkalmasak gyógyszerkészítmények hatóanyagaként.

A találmány szerinti eljárással előállított (I) általános képletű vegyületek újak, és általában előállíthatók az alább ismertetett eljárásokkal.

Az 1 514 280 számú francia szabadalmi leírás például a 2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon és származékai, például az 5-klór- és a 7-klór-származékok előállítását ismerteti, a Journal of American Chemical Society, 71, 1901-1904 (1949) és a 2 558 211 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírás a 6-klór-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon, az 1 514 280 számú francia szabadalmi leírás pedig a 8-klór-2,3-dihidro-4(1H)-kinolin előállítását ismerteti.

Az új mono- vagy diszubsztituált 2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-származékok általában előállíthatók úgy, hogy mono- vagy diszubsztituált anilint γ -butirolaktonnal vagy akrilsavval reagáltatunk, a kapott mono- vagy diszubsztituált N-karboxi-etilézett anilint Friedel-Crafts-reakcióban ciklokondenzáljuk (lásd például 8. példa 1. lépése), az így kapott 6-klór-7-fluor-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon, 7-klór-6-fluor-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon és 6,7-difluor-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon reaktív karbonsav-származékokkal, például savhalogenidekkel reagáltatva acilezzük, szerves oldószerben, és kívánt esetben savmegkötő szer jelenlétében, így a (II) általános képletű vegyületeket kapjuk.

Szerves oldószerként alkalmazhatunk kloroformot, diklór-metánt, étert, tetrahidrofuránt, dioxánt, benzolt vagy etil-acetátot. Savmegkötő szerként alkalmazhatunk szerves bázisokat, például piridint, trietil-amint vagy N,N-dimetil-anilint, vagy szerves bázisokat, például kálium-karbonátot, nátrium-karbonátot vagy nátrium-hidrogén-karbonátot. Savhalogenidként olyan vegyületeket alkalmazunk, amelyek az (I) általános képletben jelenlevő R¹ szubsztituensnek felelnek meg, így például 2-metil-benzoil-kloridot, 2,4-diklór-benzoil-kloridot, 2-bróm-benzoil-kloridot, 4-klór-benzoil-kloridot, 2,2-dimetil-propionil-kloridot vagy propionil-bromidot.

Az így kapott (II) általános képletű vegyületeket szerves oldószerben, például metanolban, etanolban, tetrahidrofuránban vagy dimetil-formamidban hidroxil-aminnal reagáltatjuk, így a megfelelő (I) általános képletű oximokat kapjuk, amelyeket szulfonálószerrel, például kén-trioxid és piridin komplexével vagy kéntrioxid és dimetil-formamid komplexével vagy halogénezett foszforsavészterrel, mint például metil-diklór-foszfáttal reagáltatunk bázis, például n-butil-lítium, nátrium-hidrid vagy fenil-lítium jelenlétében, vagy

halogénezett ecetsavval vagy annak észterével, például bróm-ecetsavval vagy metil-bróm-acetáttal reagáltatunk bázis, például kálium-hidroxid vagy nátrium-hidroxid jelenlétében, vagy metán-szulfonil-halogeniddel, például metán-szulfonil-kloriddal reagáltatunk bázis, például trietil-amin vagy dietil-anilin jelenlétében, így a megfelelő termékeket, és pedig 1-acil-2,3-dihidro-4(1H)-kinolin-4-oxim-O-szulfonsav-származékokat, 1-acil-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-4-oxim-O-foszfát-monometil-észtereit, 1-acil-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-4-oxim-O-ecetsav-származékokat és 1-acil-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-4-oxim-O-metánszulfonil-származékokat kapjuk.

Eljárhatunk úgy is, hogy a (II) általános képletű vegyületeket hidroxil-amin-O-szulfonsavval reagáltatjuk oldószerben, például metanolban, etanolban, tetrahydrofuranban vagy dimetil-formamidban piridin, N,N-dimetil-anilin, kálium-acetát, nátrium-karbonát vagy kálium-karbonát jelenlétében, így az 1-acil-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-4-oxim-O-szulfonsav-származékokat kapjuk.

A találmány szerinti eljárással előállított vegyületeket, azok diuretikus, antihipertenzív és antiödémikus hatását, valamint hasúri folyadék eltávolító aktivitását a következő táblázatokban foglaljuk össze:

1. Táblázat

Vegyület száma	1	2	3	4	5
R ¹	t-butil	etil	etil	t-butil	t-butil
R ²	H	H	H	H	H
R ³	H	H	H	H	H
R ⁴	SO ₃ K	SO ₃ K	SO ₃ K	SO ₃ K	SO ₃ K
R ⁵	5-Cl	6-Cl	H	H	H
R ⁶	H	H	7-Cl	7-Cl	8-Cl

Vegyület száma	6	7	8	9	10
R ¹	2- -metil- -fenil	2,4- -diklór- -fenil	2,4- -diklór- -fenil	4- -klór- -fenil	4- -klór- -fenil
R ²	H	H	H	H	H
R ³	H	H	CH ₃	H	H
R ⁴	SO ₃ K	SO ₃ K	SO ₃ K	SO ₃ K	SO ₃ K
R ⁵	H	H	6-Cl	6-Cl	H
R ⁶	7-Cl	7-F	H	H	7-Cl

Vegyület száma	11	12	13	14	15
R ¹	2,4-di- klór- -fenil	2-klór- -4-nitro- -fenil	2- -bróm- -fenil	etil	etil
R ²	H	H	H	H	H
R ³	H	H	H	H	H
R ⁴	SO ₃ K	SO ₃ K	SO ₃ K	CH ₂ COOH	PO(OH)OCH ₃
R ⁵	H	H	H	6-Cl	6-Cl
R ⁶	7-Cl	7-Cl	7-Cl	H	H

Vegyület száma	16	17	18	19	20
R ¹	2,4- t-butil	2- -diklór- -fenil	2- -metil- -fenil	fenil	-metil- -fenil
R ²	CH ₃	H	H	H	H
R ³	H	H	H	H	H
R ⁴	SO ₃ K	SO ₃ K	SO ₃ K	SO ₃ K	SO ₃ K
R ⁵	6-Cl	6-Cl	6-F	6-F	6-CH ₃
R ⁶	H	7-Cl	7-Cl	7-Cl	7-Cl

Vegyület száma	21	22	23	24
R ¹	2-metil- -4-klór- -fenil	2,6-di- fluor- -fenil	2,3-di- metoxi- -fenil	2- -etil- -fenil
R ²	H	H	H	H
R ³	H	H	H	H
R ⁴	SO ₃ K	SO ₃ K	SO ₃ K	SO ₃ K
R ⁵	H	H	H	H
R ⁶	7-Cl	7-Cl	7-Cl	7-Cl

Az R⁴ szubsztituens vonatkozásában karboxi-metil-csoport esetén a szabad sav formát, míg szulfo-csoport esetén a só formát adtuk meg, de ezek a vegyületek a savnak megfelelő só, illetve a sónak megfelelő szabad sav formájában is előállíthatók.

1. Kísérleti példa

Diuretikus hatás kutyákon

7 - 15 kg testtömegű Mongrel kutyákat egy éjszakán át éhezettünk. Az állatokat pentobarbitállal (30 mg/kg testtömeg, i.v.) anesztetizálva háton fekvő helyzetben rögzítettük, és a combi vénába egy katéteren át fiziológiás sóoldatot infúziót adtunk 0,15 ml/kg/perc sebességgel. Az állatok hasát ezután felmetszettük, és a bal uréterbe egy kanült vezetünk a vizelet 10 percnkénti összegyűjtésére. A vizsgálandó vegyületeket intravénásan adagoltuk, és a vizelet ürítés változását figyeltük. A vizelet ürítés fokozódásának %-át a következő képletekkel számoltuk:

Vizelet ürítés fokozódása = (vizelet ürítés az első 90 percben a vegyület adagolása után) - [(a vizelet ürítés az adagolás előtti 30 percben) x 3]

A vizelet ürítés fokozódásának %-a

$$= \frac{\text{a vizelet ürítés fokozódása}}{\text{a vizsgált vegyület esetén}} = \frac{\text{a vizelet ürítés fokozódása}}{\text{furoszemid esetén}} \times 100$$

Az eredményeket a 2. táblázatban foglaltuk össze.

2. Táblázat

Vegyület száma	Dózis µg/kg	Vizeletürítés fokozódásának százaléka
Furoszemid	100	100
2	100	31
3	100	45
4	100	84
6	100	355
7	100	326
9	100	58
10	100	249
11	100	518
13	100	400
18	100	331
19	100	414

Vegyület száma	Dózis µg/kg	Vizeletürítés fokozódásának százaléka
21	100	389
23	100	374
24	100	210

A vizsgált vegyületek szignifikáns diuretikus aktivitást mutattak.

2. Kísérleti példa

Karrageninnel indukált mancs-ödéma elleni elnyomó aktivitás vizsgálata patkányokon

A vizsgált vegyületeket, és a fenil-butazon orálisan adagoltuk Wistar patkányoknak (testtömeg körülbelül 120 g), a vizsgálati csoportok 3 - 5 állatból álltak. Az adagolás után 1 órával 0,1 ml, 1 % karragenint tartalmazó fiziológiás sóoldatot injektáltunk szubkután úton a bal hátsó mancsba. A mancsok térfogatát megmértük a karragenin adagolása előtt és az adagolás után 3 órával. Az ödéma indexet úgy számítottuk, hogy a térfogat változást osztottuk az injektálás előtti térfogattal. Minden vegyület esetén számítottuk az ED₃₀ értéket, azaz azt a dózist, amely az ödémát 30 %-kal elnyomta.

Az eredményeket a 3. táblázatban foglaltuk össze.

3. táblázat

Vegyület	ED ₃₀ (mg/kg)
Fenil-butazon	68
2.	105
3.	110
4.	67
7.	11
10.	16

A vizsgált vegyületek mindegyike szignifikáns anti-ödémás hatást mutatott.

3. Kísérleti példa

Vérnyomáscsökkentő hatás spontán magas vérnyomású patkányoknál

A vizsgált vegyületeket orálisan adagoltuk hím spontán magas vérnyomásos patkányoknak (SHRs; testtömeg: 250 - 300 g), a vizsgálati csoportok 3 - 5 állatból álltak. Az adagolást naponta egyszer, 7 egymás utáni napon végeztük. Az állatok átlagos

vérnyomása 170 - 190 Hgmm volt. A vérnyomást az adagolás előtt és után pletizmográfiaval mértük.

Az eredményeket a 4. táblázatban foglaltuk össze.

4. táblázat

Vegyület	Dózis (mg/kg)	Vérnyomás	
		adagolás előtt	adagolás után
Kontroll	-	184	182
2.	100	180	168
4.	100	183	164
9.	100	183	161
10.	30	178	156
12.	100	181	158

Minden vizsgált vegyület szignifikáns vérnyomás-csökkenő aktivitást mutatott.

4. Kísérleti példa

Hasúri folyadék eltávolítása daganatos egerekből

6 - 7 hetes BDF₁ egerekbe 10⁶ sejt/állat P388 rágsáló leukémia sejtet ültettünk be. A beültetés után 2 nappal intravénásan adagoltuk a vizsgálandó vegyületeket. A vizsgálati csoportok 6 állatból álltak. Az adagolás után 5 órával mértük a hasúri folyadék térfogatát. Az eltávolítás mértékét minden vegyület esetén a hasúri folyadék relatív térfogata alapján számoltuk. Az eredményeket az 5. táblázatban foglaltuk össze.

5. Táblázat

Vegyület	Dózis (mg/kg)	hasúri folyadék eltávolításának mértéke (%)
Kontroll	-	0
Furoszemid	100	19
2.	100	24
3.	10	32
10.	10	35
11.	0,1	23
11.	1	37

Minden vizsgált vegyület szignifikáns aktivitást mutatott, jobbat, mint a furoszemid, a daganatot hordozó egerek hasúri folyadékának eltávolításában.

5. Kísérleti példa

Akut toxicitás

A vizsgált vegyületeket intraperitoneálisan adagoltuk 20 g testtömegű ICR egereknek. A vizsgálati csoportok 5 állatból álltak. Az adagolás után 7 nappal meghatároztuk a mortalitást. Az eredményeket a 6. táblázatban foglaltuk össze.

6. Táblázat

Vegyület	Dózis (mg/kg)	Mortalitás
1.	500	0/5

Vegyület	Dózis (mg/kg)	Mortalitás
2.	500	0/5
3.	500	0/5
4.	500	0/5
5.	500	0/5
6.	200	0/5
7.	200	0/5
8.	500	0/5
9.	500	0/5
10.	200	0/5
11.	200	0/5
12.	500	0/5
13.	200	0/5

A vizsgálatban alkalmazott dózis jelentősen magasabb, mint a farmakológiai aktivitáshoz szükséges dózis. A vegyületek tehát biztonság szempontjából igen jónak nevezhetők.

A fenti kísérleti példából látható, a találmány szerinti eljárással előállított vegyületek diuretikus aktivitással rendelkeznek, ennek következtében alkalmasak a magas vérnyomás és ödéma kezelésére és/vagy megelőzésére, valamint a hasúri folyadék eltávolítására. A farmakológiai aktivitást kifejtő dózis határok között biztonságosak. Ezért ezek a vegyületek alkalmasak a szív, vese vagy máj elégtelen működése következtében fellépő ödéma, magas vérnyomás és a rákos hasúri folyadék felszaporodásának kezelésére.

A találmány szerinti eljárással előállított (I) általános képletű vegyületek szerves vagy szervetlen bázisokkal farmakológiailag elfogadható sók formájában állíthatók elő. Ilyen sók például az alkálifémsók, például nátrium- és káliumsók, alkáliföldfémsók, például kalciumsók, az ammóniumsók, szerves bázisokkal alkotott sók, például benzil-amin- és dietil-amin-sók, aminosavakkal alkotott sók, például argininsók, lizinsók, stb.

A találmány szerinti eljárással előállított (I) általános képletű vegyületek gyógyszerkészítmények hatóanyagaként alkalmazhatók. Az ilyen gyógyszerkészítmények lehetnek szilárdak, például tabletták, granulátumok, porok és kapszulák, vagy folyékonyak, például vizes injekciós oldatok vagy szuszpendálószerrel, például Tween 80 vagy gumiarábikum segítségével készített injekciós szuszpenziók. A készítmények adagolhatók orálisan vagy intravénásan, továbbá szubkután, intradermálisan vagy intramuszkulárisan. A készítmények elkészíthetők továbbá inhalációs adagolás céljára, például Aerosol formájában, topikális alkalmazás céljára, kenőcs formájában vagy kúp formájában. Az alkalmazási dózis függ a kezelendő személy korától és állapotától, a betegség fajtájától és állapotától, stb. Felnőtt számára a napi dózis általában 1 - 5000 mg, előnyösen 10 - 1000 mg. A találmány szerinti eljárást a következő példákkal szemléltetjük a korlátozás szándéka nélkül.

1. Példa

7-Klór-2,3-dihidro-1-(2-metil-benzoil)-4(1H)-kinolin előállítás

20,0 g 7-klór-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon, 26 g

piridin és 200 ml diklór-metán elegyéhez szobahőmérsékleten, keverés közben cseppenként hozzáadunk 26 g 2-metil-benzoil-kloridot. Az elegyet 4 óra hosszat visszafolyatódó hűtő alatt forralva keverjük. A reakcióelegyet ezután 500 ml vízbe öntjük, és 1000 ml diklór-metánnal kirázzuk. A szerves fázist egyszer 100 ml 1 n sósavval és 2 x 200 ml vízzel, majd telített vizes nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes nátrium-szulfáton megszáritjuk. Az oldószert vákuumban lepároljuk, és a maradékot átkristályosítjuk, így 28 g cím szerinti terméket kapunk fehér kristályok formájában.

Op.: 106,5 - 108,1 °C

IR (KBr, cm⁻¹): 1695, 1655, 1405, 1380

NMR (CDCl₃, ppm): 2,34 (3H, s), 2,80 (2H, t), 15 4,16 (2H, t), 7,00 - 8,00 (7H, m, aromás)

2. Példa

6-Klór-1-(2,4-diklór-benzoil)-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon előállítás

20 g 6-klór-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon, 26 g piridin és 200 ml dioxán elegyéhez 0 - 5 °C hőmérsékleten, keverés közben cseppenként hozzáadunk 30 g 2,4-diklór-benzoil-kloridot. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 3 óra hosszat reagáltatjuk, majd 500 ml vízbe öntjük, és 1000 ml diklór-metánnal kirázzuk. A szerves fázist 1 x 100 ml 1 n sósavval, 2 x 200 ml vízzel, majd 1 x 200 ml vizes telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes nátrium-szulfáton megszáritjuk. A diklór-metánt vákuumban lepároljuk, és a maradékot diklór-metán és n-hexán elegyből átkristályosítjuk, így 35 g cím szerinti terméket kapunk fehér kristályok formájában.

Op: 176,8 - 177,8 °C

IR (kBr, cm⁻¹): 1700, 1670, 1480, 1390

NMR (CDCl₃, ppm): 2,87 (2H, t), 4,22 (2H, t), 7,07 - 8,04 (6H, m, aromás)

3. Példa

8-Klór-1-(2,4-diklór-benzoil)-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon előállítás

30 g 8-klór-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon, 52 g piridin és 400 ml dioxán elegyéhez szobahőmérsékleten, keverés közben cseppenként hozzáadunk 100 g 2,4-diklór-benzoil-kloridot. A reakcióelegyet 5 óra hosszat visszafolyatódó hűtő alatt forraljuk. Lehűtés után a 2. példa szerinti módon feldolgozzuk, így 61 g 8-klór-1-(2,4-diklór-benzoil)-4-[(2,4-diklór-benzoil)-oxi]-1,2-dihidro-kinolint kapunk. A terméket 400 ml etanolban feloldjuk, és keverés közben, 30 perc alatt hozzáadunk 4,5 g nátrium-hidroxidot, mialatt a hőmérsékletet 0 - 5 °C-on tartjuk. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten további 1 óra hosszat keverjük, majd 1000 ml vízbe öntjük, és 2000 ml diklór-metánnal kirázzuk. A szerves fázist 2 x 300 ml vízzel, majd 1 x 300 ml telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, és vízmentes nátrium-szulfáton megszáritjuk. A diklór-metánt vákuumban lepároljuk, a maradékot diklór-metán és n-hexán elegyből átkristályosítjuk, így 32 g cím szerinti terméket kapunk fehér kristályok formájában.

Op.: 157,0 - 159,4 °C.

IR (KBr, cm⁻¹): 1700, 1680, 1440, 1280

NMR (CDCl₃, ppm): 2,73 (2H, t), 3,97 (2H, t), 6,73 - 7,84 (6H, m).

4. Példa

6-Klór-1-(2,4-diklór-benzoil)-2,3-dihidro-3-metil-4(1H)-kinolinon előállítás

4,7 g diizopropil-amin 100 ml vízmentes tetrahidrofuránnal készült oldatához -20 és -15 °C közötti hőmérsékleten, nitrogén atmoszférában, keverés közben 30 perc alatt cseppenként hozzáadunk 29 ml 1,6 n n-hexános butil-lítiumot, és a keverést további 30 percig folytatjuk 0 °C hőmérsékleten. Ezután az oldatot acetone és szárazjég keverékével -75 °C-ra hűtjük, és 1 óra alatt cseppenként hozzáadunk 15 g 6-klór-1-(2,4-diklór-benzoil)-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinont 150 ml vízmentes tetrahidrofuránban oldva. A reakcióelegyet -75 °C hőmérsékleten további 1 óra hosszat keverjük, majd keverés közben, 30 perc alatt cseppenként hozzáadunk 18 g metil-jodidot. A reakcióelegyet ezután 2 óra alatt lassan 0 °C-ra melegítjük, pH-ját 2 n sósavval hűtés közben enyhén savasra állítjuk. Ezután a reakcióelegyet 300 ml vízbe öntjük, és 500 ml etil-acetáttal kirázzuk. A szerves fázist 1 x 200 ml telített vizes nátrium-klorid-oldattal mossuk, majd vízmentes nátrium-szulfáton megszáritjuk. Az etil-acetátot vákuumban lepároljuk, és a maradékot szilikagélén kromatografáljuk, eluálószerként hexán és etil-acetát 4:1 térfogatarányú elegyét használjuk. Így 7,8 g cím szerinti terméket kapunk fehér kristályok formájában.

Op.: 156,7 - 159,4 °C.

IR (KBr, cm⁻¹): 1690, 1650, 1470, 1385

NMR (CDCl₃, ppm): 1,35 (3H, d), 3,61 (1H, m), 4,38 (2H, d), 6,89 - 7,95 (6H, m)

5. Példa

7-klór-1-(2,4-diklór-benzoil)-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon előállítás

25 g 7-klór-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon, 32 g piridin és 200 ml dioxán elegyéhez hűtés közben, 0 - 5 °C hőmérsékleten, keverés közben cseppenként hozzáadunk 37 g 2,4-diklór-benzoil-kloridot. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 3 óra hosszat reagáltatjuk, majd a 2. példa szerinti módon feldolgozzuk. Így 43 g cím szerinti terméket kapunk fehér kristályok formájában.

Op.: 159,0 - 162,9 °C

IR (KBr, cm⁻¹): 1695, 1660, 1395, 1195

NMR (CDCl₃, ppm): 2,78 (2H, t), 4,08 (2H, t), 7,03 - 7,95 (6H, m, aromás)

6. Példa

7-klór-2,3-dihidro-1-(2-metil-benzoil)-4(1H)-kinolinon-4-oxim-O-szulfonsav-káliumsó előállítás (6. vegyület)

10,0 g 1. példa szerinti termék, 150 ml metanol és 100 ml diklór-metán elegyéhez keverés közben, szobahőmérsékleten hozzáadunk 11 g hidroxil-amin-O-szulfonsavat. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 30 percig keverjük, majd egyszerre hozzáadunk 14 g, 20 ml vízben oldott kálium-karbonát-oldatot. A reakcióelegyet további 2 óra hosszat szobahőmérsékleten keverjük, majd az oldószert vákuumban lepároljuk. A maradékot szilikagélén kromatografáljuk, eluálószerként diklór-metán és metanol 5:1 térfogatarányú elegyét használjuk. A terméket metanol és szén-tetraklorid elegyből átkristályosítjuk, így 12,0 g cím szerinti terméket kapunk fehér kristályok formájában.

Op.: 189,0 °C (bomlik)
 IR (KBr, cm⁻¹): 1660, 1380, 1240
 NMR (DMSO-d₆, ppm): 2,22 (3H, s), 2,81 (2H, t), 3,73 (2H, t), 6,90 - 7,95 (7H, m, aromás)

7. Példa

7-klór-2,3-dihidro-1-(2-metil-benzoil)-4(1H)-kinolinon-4-oxim-O-szulfonsav- káliumsó előállítása (6. vegyület)

1. lépés

14,9 g 1. példa szerinti termék és 250 ml etanol elegyéhez hozzáadunk 7 g hidroxil-amin-hidrokloridot és 8,5 g piridint, és a reakcióelegyet 1,5 óra hosszat visszafolyató hűtő alatt forraljuk. Lehűtés után a reakcióelegyet 1000 ml vízbe öntjük, a kivált kristályos csapadékot leszűrjük, mossuk, szárítjuk, és etanolból átkristályosítjuk, így 13,6 g 7-klór-2,3-dihidro-1-(2-metil-benzoil)-4(1H)-kinolinon-4-oximot kapunk fehér kristályok formájában.

Op.: 166,0 - 168,4 °C
 IR (KBr, cm⁻¹): 3330, 1635, 1400
 NMR (DMSO-d₆, ppm): 2,20 (3H, s), 2,81 (2H, t), 3,77 (2H, t), 7,05 - 7,98 (7H, m, aromás)

2. lépés

Az 1. lépés 13,6 g termékét feloldjuk 250 ml diklór-metánban, és hozzáadunk 7 g kén-trioxid és piridin komplexet. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 24 óra hosszat keverjük, majd körülbelül 150 ml oldószert vákuumban lepárolunk. A maradékhoz 200 ml metanol, majd egyszerre 6 g (10 ml vízben oldott) kálium-karbonátot adunk, és a reakcióelegyet a 6. példa szerinti módon feldolgozzuk. Így 13 g cím szerinti terméket kapunk fehér kristályok formájában, amelyek IR- és NMR- spektruma, valamint olvadáspontja megegyezik a 6. példa szerinti termékével.

8. Példa

7-klór-6-fluor-2,3-dihidro-1-(2-metil-benzoil)-4(1H)-kinolinon-4-oxim-O-szulfonsav-káliumsó (18. vegyület)

1. lépés

7-Klór-6-fluor-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon előállítása

600 g polifoszforsav és 38 g 3-(3-klór-4-fluor-fenil-amino)-propionsav, amelyet 3-klór-4-fluor-anilinnél és akrilsavból vagy metil-akriláttól a W. S. Johnson és munkatársai (The Journal of American Chemical Society, volume 71, page 1901, (1949)) szerinti módon szintetizáltunk, elegyét 110 °C hőmérsékleten 70 percig keverjük. A reakcióelegyet ezután 1500 ml vízbe öntjük, és 1500 ml diklór-metánnal kirázzuk. A szerves fázist 2 x 200 ml telített nátrium-klorid- oldattal mossuk, majd vízmentes nátrium-szulfáton megszáritjuk. A diklór-metánt vákuumban lepároljuk, és a maradékot szilikagél oszlopon kromatografáljuk, eluálószerként n-hexán és éter 4:1 térfogatarányú elegyét használjuk. Így 20 g cím szerinti terméket kapunk halványárga kristályok formájában.

Op.: 192,0 - 194,0 °C
 IR (KBr, cm⁻¹): 3350, 1645, 1250, 1160
 NMR (DMSO-d₆+CDCl₃, ppm): 2,61 (2H, t), 3,52 (2H, t), 6,83 (1H, d), 7,43 (1H, d)

2. lépés

7-klór-6-fluor-1-(2-metil-benzoil)-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon

15 g 1. lépés szerinti termék, 17 g 2-metil-benzoil-klorid, 12 g piridin és 200 ml diklór-metán elegyét az 1. példa szerinti módon reagáltatjuk, és dolgozzuk fel, így 21 g cím szerinti terméket kapunk.

Op.: 84,9 - 88,7 °C
 IR (KBr, cm⁻¹): 1700, 1665, 1480, 1370
 NMR (CDCl₃, ppm): 2,38 (3H, s), 2,81 (2H, t), 4,16 (2H, t), 7,16 - 7,78 (6H, m)

3. lépés

1-(2-Metil-benzoil)-7-klór-6-fluor-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-4-oxim-O-szulfonsav káliumsója
 10 g 2. lépés szerinti termék, 3,6 g hidroxil-amin-O-szulfonsav, 4,4 g kálium-karbonát és 100 ml metanol elegyét a 6. példa szerinti módon reagáltatjuk és dolgozzuk fel, így 4 g cím szerinti terméket kapunk fehér kristályok formájában.

Op.: 204,1 °C (bomlik)
 IR (KBr, cm⁻¹): 1650, 1375, 1210
 NMR (DMSO-d₆, ppm): 2,23 (3H, s), 2,82 (2H, t), 3,75 (2H, t), 7,16 - 7,79 (6H, m, aromás)

9. Példa

7-klór-1-(2,4-diklór-benzoil)-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-4-oxim-O-szulfonsav- káliumsó (11. Vegyület)

14,5 g 5. példa szerinti termék, 200 ml metanol és 200 ml diklór-metán elegyéhez szobahőmérsékleten, keverés közben hozzáadunk 4,6 g hidroxil-amin-O-szulfonsavat. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 30 percig keverjük, majd egyszerre hozzáadunk 5,6 g, 10 ml vízben oldott kálium-karbonátot, és a keverést további 2 óra hosszat folytatjuk. A kivált kristályokat leszűrjük, és az oldószert vákuumban bepároljuk. A maradékot szilikagél oszlopon kromatografáljuk, eluálószerként diklór-metán és metanol 10 : 1 térfogatarányú elegyét használjuk; a terméket metanol és széntetraklorid elegyből átkristályosítjuk, így 10,0 g cím szerinti terméket kapunk fehér kristályok formájában.

Op.: 217,5 °C.
 IR (KBr, cm⁻¹): 1660, 1395, 1240.
 NMR (DMSO-d₆, ppm): 2,80 (2H, t), 3,59 (2H, t), 7,12 - 7,93 (6H, m, aromás)

10. Példa

7-Klór-1-(2,4-diklór-benzoil)-2,3-dihidro-4(1H)-kinolin-4-oxim-O-szulfonsav- nátriumsó (11. vegyület)

14,5 g 5. példa szerinti termék, 200 ml metanol és 200 ml diklór-metán elegyéhez keverés közben, szobahőmérsékleten hozzáadunk 4,6 g hidroxil-amin-O-szulfonsavat. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 30 percig keverjük, majd egyszerre hozzáadunk 4,3 g, 10 ml vízben oldott nátrium-karbonátot, és a keverést további 2 óra hosszat folytatjuk. A kivált kristályokat leszűrjük, és az oldószert vákuumban bepároljuk. A maradékot szilikagél oszlopon kromatografáljuk, eluálószerként diklór-metán és metanol 10:1 térfogatarányú elegyét használjuk. Így 8,0 g cím szerinti terméket kapunk fehér kristály formájában.

Op.: 167,5 °C

IR (KBr, cm^{-1}): 1670, 1395, 1235.
NMR (DMSO- d_6 , ppm): 3,05, (2H, t), 3,90 (2H, t), 7,25 - 8,15 (6H, m, aromás)

11. Példa

7-Klór-1-(2,4-diklór-benzoil)-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-4-oxim-O-szulfonsav- káliumsó
(11. vegyület)

1. lépés

17,5 g 5. példa szerinti termék és 250 ml etanol elegyéhez hozzáadunk 7 g hidroxil-amin-hidrokloridot, és 8,5 g piridint, és az elegyet 1,5 óra hosszat visszafolyatósító hűtő alatt forraljuk. Lehűtés után a reakcióelegyet 1000 ml vízbe öntjük, a kivált csapadékot leszűrjük, mossuk, megszáritjuk és etanolból átkristályosítjuk, így 16 g 7-klór-1-(2,4-diklór-benzoil)-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-4-oximot kapunk fehér kristályok formájában.

Op.: 230,7 - 232,3 °C

IR (KBr, cm^{-1}): 3250, 1635, 1420, 945

NMR (DMSO- d_6 , ppm): 2,72 (2H, t), 3,57 (2H, t), 7,05 - 7,94 (6H, m, aromás)

2. lépés

Az 1. lépésben kapott 16 g terméket feloldjuk 250 ml diklór-metánban, és hozzáadunk 7 g kén-trioxid-piridin-komplexet. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 24 óra hosszat keverjük, majd az oldószert vákuumban lepároljuk. A maradékhoz 200 ml metanolt adunk, majd egyszerre hozzáadunk 6 g, 10 ml vízben oldott kálium-karbonátot, és a reakcióelegyet a 9. példa szerinti módon feldolgozzuk. Így 13 g cím szerinti terméket kapunk fehér kristályok formájában, amelynek IR- és NMR- spektruma, valamint olvadáspontja megegyezik a 9. példa termékével.

12. Példa

6-Klór-2,3-dihidro-1-(1-oxo-propil)-4(1H)-kinolinon-4-oxim-O-ecetsav
(14. vegyület)

7,7 g bróm-ecetsav, 6,5 g kálium-hidroxid és 60 ml víz elegyéhez jégfürdőn történő hűtés közben lassan hozzáadunk 12,7 g 6-klór-2,3-dihidro-1-(1-oxo-propil)-4(1H)-kinolinon-4-oximot. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 24 óra hosszat keverjük, majd jégfürdőn 2 n sósavval 3,0 pH-ig megsavanyítjuk. A savas elegyet 150 ml vízbe öntjük, és 500 ml etil-acetáttal kirázzuk. A szerves fázist 1 x 500 ml telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, és vízmentes nátrium-szulfáton megszáritjuk. Az oldószert vákuumban lepároljuk, és a maradékot szilikagél oszlopon kromatografáljuk, eluálószerként diklór-metán és metanol 9:1 térfogatarányú elegyét használjuk, így 10,5 g cím szerinti terméket kapunk fehér kristályok formájában.

Op.: 142,8 - 144,0 °C

IR (KBr, cm^{-1}): 3300 - 2800, 1740, 1650, 1480, 1390.

NMR (DMSO- d_6 , ppm): 1,03 (3H, t), 2,52 (2H, q), 2,84 (2H, t), 3,79 (2H, t), 4,69 (2H, s), 7,26 - 7,75 (3H, m, aromás)

13. Példa

6-klór-2,3-dihidro-1-(1-oxo-propil)-4(1H)-kinolinon-4-oxim-O-foszforsav- monometil-észter

(15. Vegyület)

7,5 g 6-klór-2,3-dihidro-1-(1-oxo-propil)-4(1H)-kinolinon-4-oxim 150 ml vízmentes tetrahidrofuránnal készült oldatához -75 °C hőmérsékleten, nitrogén atmoszférában, 30 perc alatt cseppenként hozzáadunk 21 ml 1,6 n hexános butil- lítiumot, és a keverést -75 °C hőmérsékleten 30 percig folytatjuk. A reakcióelegyhez ezután -75 °C hőmérsékleten, 30 perc alatt cseppenként hozzáadunk 4,9 g metil-diklór-foszfátot, és a keverést további 2 óra hosszat -70 és -60 °C közötti hőmérsékleten fenntartjuk. Ezután a reakcióelegyet lassan 0 °C-ra melegítjük, pH-ját 1 n sósavval 2,0-ra állítjuk. A savas elegyet szobahőmérsékleten további 5 óra hosszat keverjük, majd 200 ml vízbe öntjük, és 500 ml etil-acetáttal kirázzuk. A szerves fázist 1 x 200 ml telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, és vízmentes nátrium-szulfáton megszáritjuk. Az etil-acetátot vákuumban lepároljuk, és a maradékot szilikagél oszlopon kromatografáljuk, eluálószerként diklór-metán és metanol 19:1 térfogatarányú elegyét használjuk. Így 7,2 g cím szerinti terméket kapunk fehér kristályok formájában.

Op.: 71,0 - 75,0 °C

IR (KBr, cm^{-1}): 3420, 2950, 1680, 1395, 1195

NMR (DMSO- d_6 , ppm): 1,01 (3H, t), 2,50 (2H, q), 2,88 (2H, t), 3,62 (3H, d), 3,78 (2H, t), 7,22 - 7,85 (3H, m, aromás)

14. Példa

6-Klór-1-(2,4-diklór-benzoil)-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-4-oxim-mezilát előállítás

10,0 g 6-klór-1-(2,4-diklór-benzoil)-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-4-oxim, 4,1 g trietil-amin és 150 ml diklór-metán elegyéhez -20 °C hőmérsékleten, keverés közben cseppenként hozzáadunk 3,5 g metánszulfonil-kloridot. A reakcióelegyet -20 °C hőmérsékleten további 30 percig keverjük, és hozzáadunk 300 ml diklór-metánt. Ezután a reakcióelegyet sorban 1 n sósavval, telített vizes nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal, majd telített vizes nátrium-klorid-oldattal mossuk, és vízmentes nátrium-szulfáton megszáritjuk. Az oldószert vákuumban lepároljuk, és a maradékot éter és n-hexán elegyből átkristályosítjuk, így 11 g cím szerinti terméket kapunk fehér kristályok formájában.

Op.: 197,4 - 198,1 °C

IR (KBr, cm^{-1}): 1660, 1365, 1180

NMR (DMSO- d_6 , ppm): 3,03 (2H, t), 3,38 (3H, s), 3,72 (2H, t), 7,12 - 7,92 (6H, m, aromás)

A 15 - 266. példák vegyületeit a 8-18. táblázatban foglaltuk össze, a megfelelő IR- és NMR- spektrum adatokkal, valamint olvadás és bomlásponatokkal. Az NMR spektrumokat általában 90 MHz-nél mértük, néhányat, amelyeket *-gal jelöltünk, 60 MHz-nél.

A vegyületek előállítására szolgáló módszereket a 7. táblázatban foglaltuk össze.

7. táblázat

Csoport	Szintézismódszer (jellemző példaszám)	Példaszám a 8-18. táblázatokban
A	1	27 - 59, 64 - 144
B	3	60 - 63




Csoport	Szintézismódszer (jellemző példaszám)	Példaszám a 8-18. táblázatokban
C	6	145 - 208, 210 - 215, 218, 220 - 266
D	7	209, 216, 217, 219
E	8 (1. lépés)	15 - 26

8. Táblázat
(IV) általános képletű vegyületek

Pl. sz.	R ⁵	R ⁶	IR(KBr, cm ⁻¹)	NMR (CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
15	H	-SCH ₃	3350,1640, 1240,1180	2,42(3H,s),2,62 (2H,t),3,51(2H, dt),4,53(1H,m), 6,35-6,58(2H,m), 7,60-7,73(1H,m)	133,9~137,3
16	H	-NO ₂	3350,1670, 1355,1190	[DMSO-d ₆ +CDCl ₃] 2,61(2H,t),3,53, (2H,dt), 7,00(1H, m),7,07-7,79 (3H,m)	229,0~ 232,7
17	H	Br	3370,1660, 1240,1180	2,64(2H,t),3,53 (2H,dt),4,42 (1H, m),6,67-6,82(2H, m),7,51-7,65(1H,m)	139,6~ 141,1
18	H	F	3300,1620 1255,1195	2,62(2H,t),3,53 (2H,dt),4,51(1H, m),6,19-6,50(2H, m),7,73-7,97(1H,m)	101,6~ 102,5
19	H	I	3360,1650, 1240,1180	2,63(2H,t),3,52 (2H,dt),4,32(1H, m),6,90-7,04(2H, m),7,36-7,47(1H,m)	142,4~ 148,0
20	H	-CF ₃	3370,1660, 1240,1160	2,71(2H,t),3,60 (2H,dt),4,58(1H, m),6,75-6,95(2H, m),7,78-7,96(1H,m)	163,8~ 165,0
21	H	-COCH ₃	3370,1700, 1230,1180	2,58(3H,s),2,74 (2H,t),3,63(2H, dt),4,64(1H,m), 7,21-7,30(2H,m), 7,82-7,98(1H,m)	162,2~ 167,2
22	H	-COOCH ₃	3350,1725, 1240,1170	2,82(2H,t),3,63 (2H,dt),3,91(3H, s),4,56(1H,m), 7,23-7,98(3H,m)	142,1~ 146,8
23	F	F	3360,1640, 1260,1160	2,75(2H,t),3,53 (2H,dt),4,29(1H, m),6,20-6,41(1H, m),7,36-7,53(1H,m)	155,4~ 156,6
24	Cl	F	3350,1660, 1240,1160	2,77(2H,t),3,71 (2H,dt),4,71(1H, m),6,50-6,67(1H, d),7,96-8,11(1H,d)	171,3~ 176,3
25	Br	Cl	3350,1660, 1230,1155	[DMSO-d ₆] 2,53(2H,t),3,47	175,7~ 180,9

Pl. sz.	R ⁵	R ⁶	IR(KBr, cm ⁻¹)	NMR (CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
26	-OCH ₃	-OCH ₃	3350,1660 1265,1170	(2H,t),7,04(1H,s), 7,82(1H,s), 2,64(2H,t)3,55 (2H,dt),3,82(3H,s), 3,86(3H,s), 4,30(1H,m),6,12 (1H,s),7,29(1H,s)	105,1~ 108,9

9. Táblázat
(V) általános képletű vegyületek

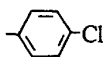

Pl. sz.	R ¹	IR(KBr,cm ⁻¹)	NMR (CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
27	-OCH ₃	1730,1695, 1490,1225	2,77(2H,t),3,88(3H,s), 4,20(2H,t), 7,39-8,00(3H,m)	106,7~ 107,1
28	-CH ₃	1700,1670, 1480,1200	2,33(3H,s),2,79(2H,t), 4,20(2H,t) 7,47-7,98(3H,m)	149,2~ 150,2
29	-CH ₂ CH ₃	1700,1670, 1480,1185	1,23(3H,t),2,58(2H,q), 2,76(2H,t),4,18(2H,t), 7,45-7,98(3H,m)	105,5~ 106,4
30	-(CH ₂) ₃ CH ₃	1680,1470, 1380,1180	0,91(3H,t),1,13-1,86 (4H,m),2,54(2H,t),2,75 (2H,t),4,14(2H,t), 7,38-7,91(3H,m)	71,3~ 74,2
31	-(CH ₂) ₇ CH ₃	1690,1670, 1460,1170	0,87(3H,t),1,07-2,24 (12H,m),2,57(2H,t), 2,78(2H,t),4,20(2H,t), 7,48-8,00(3H,m)	(Olaj)
32	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	1700,1655, 1485,1185	0,98(6H,d),2,18(1H,m), 2,46(2H,d),2,78(2H,t), 4,21(2H,t),7,44-8,02 (3H,m)	65,3~ 74,5
33	-C(CH ₃) ₃	1695,1650, 1470,1160	1,41(9H,s),2,73(2H,t), 4,15(2H,t), 7,16-7,88(3H,m)	163,1~ 164,3
34	-CH ₂ CH ₂ Cl	1700,1670, 1390,1190	2,80(2H,t),3,04(2H,t), 3,88(2H,t),4,23(2H,t), 7,42-7,99(3H,m)	107,0~ 117,1
35	-C(CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	1700,1660, 1475,1150	1,49(6H,s),2,78(2H,t), 3,71(2H,s),4,15(2H,t), 7,37-7,92(3H,m)	148,0~ 150,9
36	-CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	1740,1655, 1480,1170	2,72(2H,t),2,75(2H,t), 2,79(2H,t),3,66(3H,s), 4,19(2H,t),7,18-7,93 (3H,m)	107,8~ 108,4
37	-CH ₂ OCH ₃	1690,1475, 1305,1200	2,81(2H,t),3,47(3H,s), 4,18(2H,t),4,27(2H,s), 7,41-8,02(3H,m)	96,5~ 97,5
38		1700,1660, 1490,1180	0,78-1,33(4H,m),1,80- 2,11(1H,m),2,77(2H,t), 4,24(2H,t),7,17-7,95 (3H,m)	146,7~ 148,9
39		1700,1680 1470,1190	1,00-1,96(11H,m),2,73 (2H,t),4,15(2H,t), 7,38-7,96(3H,m)	92,7~ 94,0
40	-CH ₂ - 	1700,1680, 1480,1195	2,53(2H,t),3,90(2H,s), 4,08(2H,t),	102,7~ 104,9

Pl. sz.	R ¹	IR(KBr,cm ⁻¹)	NMR (CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
41		1690,1655, 1470,1180	7,10-7,83(8H,m) 2,79(2H,t),4,30(2H,t), 6,73(1H,d),7,11-7,88 (8H,m),7,71(1H,d)	163,1~ 164,4
42		1695,1665 1375,1190	2,82(2H,t),4,25(2H,t), 6,81-7,95(8H,m)	135,9~ 137,2
43		1700,1655, 1485,1370	2,88(2H,t),4,29(2H,t), 6,78-7,37(3H,m)7,67- 8,66(4H,m)	161,8~ 162,6
44		1695,1665, 1365,1240	2,82(2H,t),4,29(2H,t), 6,82-7,91(6H,m)	147,7~ 148,7
45		1680,1660, 1460,1255	[DMSO-d ₆] 2,78(2H,t), 3,49(3H,s),4,11(2H,t), 6,85-7,78(7H,m)	138,1~ 139,1
46		1700,1680, 1365,1260	2,81(2H,t),3,80(3H,s), 4,23(2H,t), 6,71-7,97(7H,m)	152,5~ 156,4
47		1695,1660, 1475,1380	2,82(2H,t), 4,16(2H,t), 7,02-7,93(7H,m)	122,2~ 123,4
48		1690,1665, 1360,1190	2,82(2H,t), 4,23(2H,t), 6,72-7,89(7H,m)	170,8~ 171,9
49		1695,1650, 1480,1385	2,32(3H,s),2,81(2H,t), 4,19(2H,t), 7,01-8,00(7H,m)	89,1~ 92,6

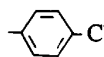

10. Táblázat
(VI) általános képletű vegyületek

Pl. sz.	R ¹	R ⁵	IR (KBr, cm ⁻¹)	NMR (CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
50	-CH ₂ CH ₃	-Br	1695,1645, 1480,1180	1,21(3H,t),2,57(2H,q), 2,73(2H,t),4,15(2H,t), 7,17-8,10(3H,m)	103,6~ 107,8
51		-F	1690,1645, 1490,1390	2,82(2H,t), 4,12(2H,t), 6,81-7,69(6H,m)	159,0~ 159,5
52	-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃	1695,1650, 1500,1180	1,21(3H,t),2,55(2H,q), 2,74(2H,t),3,82(3H,s), 4,18(2H,t),6,98-7,47 (3H,m)	105,2~ 107,3
53	-CH ₂ CH ₃	H	1700,1655, 1490,1210	1,26(3H,t),2,57(2H,q), 2,74(2H,t),4,20(2H,t), 7,09-8,04(4H,m)	50,0~ 55,0
54		H	1690,1640, 1480,1385	2,84(2H,t), 4,20(2H,t), 7,04-8,02(7H,m)	135,2~ 137,7
55		H	1680,1635, 1480,1375	2,33(3H,s),2,83(2H,t), 4,23(2H,t), 6,99-8,10(8H,m)	149,0~ 150,7



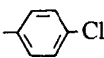
11. Táblázat
(VII) általános képletű vegyületek



















Pl. sz.	R ¹	IR (KBr, cm ⁻¹)	NMR (CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
56	-CH ₂ CH ₃	1700,1660, 1460,1190	1,18(3H,t),2,49(2H,q), 2,78(2H,t),4,10(2H,t), 7,13-7,31(3H,m)	95,8~ 98,0
57	-C(CH ₃) ₃	1690,1655, 1450,1360	1,36(9H,s),2,81(2H,t), 4,15(2H,t), 7,18-7,38(3H,m)	101,7~ 103,6
58		1700,1665, 1460,1375	2,91(2H,t), 4,24(2H,t), 6,57-7,53(7H,m)	143,6~ 145,2
59		1680,1640, 1445,1360	2,31(3H,s),2,87(2H,t), 4,16(2H,t), 6,91-7,48(7H,m)	171,7~ 173,4


12. Táblázat
(VIII) általános képletű vegyületek

Pl. sz.	R ¹	IR(KBr, cm ⁻¹)	NMR(CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
60	-CH ₂ CH ₃	1700,1670, 1445,1180 7,12-7	1,13(3H,t),2,55(2H,q), 2,76(2H,t),3,64(2H,t), 9,1(3H,m)	73,4~ 74,8
61	-C(CH ₃) ₃	1700,1660, 1440,1275	1,43(9H,s),2,76(2H,t), 4,18(2H,t), 7,08-7,96(3H,m)	131,3~ 132,0
62		1700,1675 1450,1365	2,82(2H,t), 4,20(2H,t), 7,22-8,03(7H,m)	131,1~ 134,1
63		1700,1660, 1440,1360	2,51(3H,s),2,74(2H,t), 4,01(2H,t), 7,08-8,02(7H,m)	117,4~ 120,6

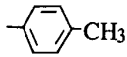













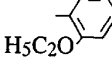
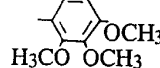
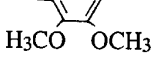


13. Táblázat
(IX) általános képletű vegyületek

Pl. sz.	R ¹	IR(KBr, cm ⁻¹)	NMR(CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
64	-CH ₂ CH ₃	1700,1670, 1395,1205	1,23(3H,t),2,59(2H,q), 2,72(2H,t),4,13(2H,t), 7,03-7,88(3H,m)	104,3~ 109,8
65	-C(CH ₃) ₃	1710,1660, 1360,1160	1,41(9H,s),2,76(2H,t), 4,16(2H,t), 7,01-7,88(3H,m)	124,3~ 128,1
66	-C(CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	1700,1665, 1360,1200	1,49(6H,s),2,76(2H,t), 3,72(2H,s),4,14(2H,t), 7,07-7,91(3H,m)	108,8~ 110,8
67		1715,1680, 1390,1230	2,83(2H,t), 4,08(2H,t), 7,03-7,92(7H,m)	86,0~ 91,0
68		1695,1660, 1380,1220	2,82(2H,t), 4,22(2H,t), 7,03-7,96(7H,m)	103,7~ 108,4
69		1700,1645, 1480,1360	2,82(2H,t), 4,23(2H,t), 6,96-7,96(7H,m)	138,2~ 142,0

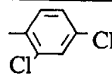
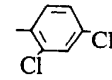
Pl. sz.	R ¹	IR(KBr,cm ⁻¹)	NMR(CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
70		1695,1640, 1460,1360	2,78(2H,t),3,49(3H,s), 4,31(2H,t), 6,63-7,91(7H,m)	102,3~ 107,3
71		1690,1640, 1480,1370	2,80(2H,t), 4,20(2H,t), 6,83-7,94(7H,m)	121,8~ 122,5
72		1700,1665, 1380,1190	2,87(2H,t), 4,14(2H,t), 7,04-7,96(7H,m)	114,1~ 120,3
73		1700,1660, 1570,1385	[DMSO-d ₆] 2,88(2H,t),3,99(2H,t), 7,17-8,22(7H,m)	176,2~ 176,5
74		1690,1655, 1395,1345	2,80(2H,t), 4,07(2H,t), 7,07-8,33(6H,m)	179,6~ 181,3
75		1695,1645, 1455,1345	1,31(9H,s),2,81(2H,t), 4,21(2H,t),6,99-7,95 (7H,m)	124,5~ 127,6
76		1690,1650, 1370,900	2,31(2H,s),2,78(2H,t), 4,09(2H,t),7,02-7,93 (6H,m)	156,1~ 160,2
77		1690,1635, 1475,1370	2,84(2H,t), 4,25(2H,t), 7,04-7,96(8H,m)	141,7~ 143,6
78		1690,1660, 1465,1370	2,36(3H,s),2,81(2H,t), 4,09(2H,t), 7,02-7,89(6H,m)	157,8~ 158,3
79		1695,1660, 1460,1360	2,71(2H,t), 4,00(2H,t), 7,01-7,91(10H,m)	43,2~ 47,5
80		1680,1640, 1460,1360	2,85(2H,t), 4,28(2H,t), 7,00-8,01(10H,m)	134,0~ 136,5
81		1690,1650, 1460,1370	2,70(2H,t), 3,96(2H,t), 6,95-7,91(7H,m)	129,4~ 131,8
82		1690,1640, 1460,1355	2,82(2H,t),3,81(3H,s), 4,27(2H,t), 6,95-8,02(7H,m)	138,6~ 140,0
83		1690,1635, 1470,1360	[DMSO-d ₆ +CDCl ₃] 2,90(2H,t),4,21(2H,t), 7,26-7,58(3H,m),7,90-8,09 (2H,m),8,70-8,86(2H,m)	175,8~ 177,8
84		1680,1650, 1465,1380	[DMSO-d ₆] 2,86(2H,t),4,20(2H,t), 7,23-7,62(3H,m),7,72-8,12 (3H,m),8,55-8,60(1H,m)	148,0~ 149,8
85		1685,1640, 1490,1400	[DMSO-d ₆] 2,93(2H,t),4,10(2H,t), 7,35-8,01(2H,m),8,07- 8,25(2H,m),8,60-8,82 (1H,m),8,94-9,02(2H,m)	171,7~ 179,2
86		1690,1640, 1480,1375	2,92(2H,t),4,35(2H,t), 7,15-7,36(2H,m),8,01 (1H,d),8,47-8,54(1H,m), 8,77(1H,d), 9,08-9,12(1H,m)	149,8~ 151,0
87		1690,1635, 1415,1365	2,87(2H,t), 4,36(2H,t), 6,98-8,03(6H,m)	94,1~ 96,1

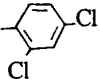
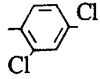
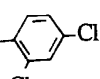
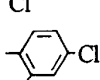
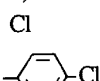
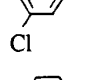
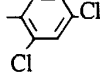

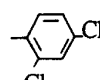
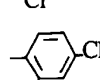
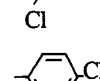






Pl. sz.	R ¹	IR(KBr,cm ⁻¹)	NMR(CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
88		1660,1640, 1475,1345	2,86(2H,t), 4,32(2H,t), 7,11-8,02(6H,m)	165,1~ 166,9



13. Táblázat (folyt.)

Pl. sz.	R ¹	IR (nujol. cm ⁻¹)	Op. (°C)
89	 	1690, 1650	104 ~ 109
90	 	1680, 1660	144 ~ 149
91	 	1700, 1665	107 ~ 109,5
92	 	1685, 1650	118 ~ 120,3
93		1690, 1650	176,5 ~ 178,3
94		1690, 1665	93 ~ 96
95	 	1695, 1660	188 ~ 193
96		1700, 1640	111 ~ 113,8
97		1690, 1655	(Oil)
98		1690, 1655	131 ~ 133
99		1685, 1655	136,5 ~ 140
100		1690, 1660	136 ~ 138,2
101		1690, 1665	143 ~ 146,5
102		1690, 1640	135 ~ 136,3

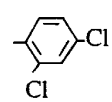
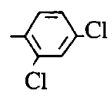




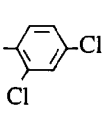


14. Táblázat
(X) általános képletű vegyületek

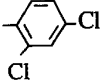

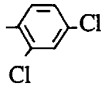


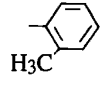
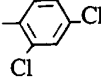
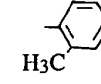
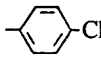
Pl. sz.	R ¹	R ⁶	IR(KBr,cm ⁻¹)	NMR(CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
103		Br	1690,1650, 1480,1380	2,80(2H,t), 4,16(2H,t), 7,18-7,89(6H,m)	181,7~ 184,5
104		F	1695,1660, 1390,1230	2,80(2H,t), 4,15(2H,t), 6,75-8,09(6H,m)	120,1~ 122,9
105	-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃	1690,1665, 1385,1245	1,21(3H,t),2,59(2H,q), 2,67(2H,t),3,84(3H,s), 4,13(2H,t), 6,61-7,95(3H,m)	(Olaj)

Pl. sz.	R ¹	R ⁶	IR(KBr,cm ⁻¹)	NMR(CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
106		-CH ₃	1680,1650, 1465,1380	2,22(3H,s),2,82(2H,t), 4,18(2H,s), 6,91-7,89(6H,m)	141,4~ 145,0
107		I	1690,1645, 1475,1380	2,82(2H,t), 4,12(2H,t), 7,20-7,70(6H,m)	186,3~ 187,9
108		-CF ₃	1790,1640, 1335,1175	2,90(2H,t), 4,20(2H,t), 7,18-8,11(6H,m)	136,2~ 140,2
109		-COCH ₃	1695,1640, 1420,1370	2,45(3H,s), 2,90(2H,t), 4,25(2H,t), 7,19-8,11(6H,m)	135,9~ 139,9
110		-OCH ₃	1680,1650, 1460,1380	2,83(2H,t), 3,65(3H,s), 4,21(2H,t), 6,61-7,98(6H,m)	99,6~ 101,3
111		-N(CH ₃) ₂	1670,1640, 1460,1365	2,80(2H,t), 2,87(6H,s), 4,24(2H,t), 6,38-7,92(6H,m)	177,7~ 179,7
112		-COOCH ₃	1720,1615, 1480,1390	2,80(2H,t), 3,75(3H,s), 4,22(2H,t), 7,16-7,98(6H,m)	174,9~ 177,0
113		F	1695,1645, 1480,1360	2,82(2H,t), 4,25(2H,t), 6,67-8,09(8H,m)	106,8~ 109,0
114		-SCH ₃	1680,1640, 1470,1385	2,23(3H,s), 2,82(2H,t), 4,14(2H,t), 6,91-7,91(6H,m)	113,2 117,2
115		-SO ₂ CH ₃	1660,1380, 1220,1155	[DMSO-d ₆ +CDCl ₃] 2,96(2H,t),3,02(3H,s), 4,19(2H,t), 7,36-8,16(6H,m)	191,6~ 195,6
116		-SOCH ₃	1660,1385, 1240,1055	2,55(3H,s), 2,91(2H,t), 4,01(2H,t), 7,33-8,16(6H,m)	183,3~ 186,8
117		F	1660,1595, 1480,1360	2,34(3H,s), 2,77(2H,t), 4,12 (2H,t), 6,73-8,04(7H,m)	93,5~ 96,3
118		-NO ₂	1700,1660, 1475,1340	2,77(2H,t), 4,02(2H,t), 7,04-7,79(6H,m)	180,9~ 183,1
119		-OCH ₃	1680,1635, 1485,1370	2,27(3H,s),2,76(2H,t), 3,54(3H,s),4,25(2H,t), 6,60-8,01(7H,m)	112,2~ 116,0
120		-OCH ₃	1680,1640, 1440,1365	2,81(2H,t), 3,50(3H,s),4,32(2H,t) 6,33-8,02(8H,m)	167,2~ 168,4
121		Br	1690,1640, 1470,1370	2,84(2H,t), 4,28(2H,t), 7,21-7,89(8H,m)	153,0~ 156,7
122		Br	1695,1640, 1445,1370	2,33(3H,s), 2,78(2H,t), 4,13(2H,t), 6,98-7,92(7H,m)	111,7~ 116,2

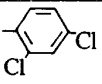
Pl. sz.	R ¹	R ⁶	IR(KBr, cm ⁻¹)	NMR(CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
123		I	1695, 1645, 1405, 1375	2,32(3H,s), 2,79(2H,t), 4,17(2H,t), 7,19-7,78(7H,m)	145,4~ 147,8
124		I	1685, 1640, 1460, 1360	2,83(2H,t), 4,26(2H,t), 7,18-7,75(8H,m)	161,8~ 163,0









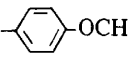
15. Táblázat
(XI) általános képletű vegyületek



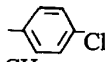


Pl. sz.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	IR(KBr, cm ⁻¹)	NMR(CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
125	-C(CH ₃) ₃	H	H	Cl	Cl	1705, 1655, 1460, 1160	1,42(9H,s), 2,77(2H,t), 4,17(2H,t), 7,82(1H,s), 7,98(1H,s)	141,9 ~ 146,1
126		H	H	Cl	Cl	1700, 1660, 1450, 1390	2,78(2H,t), 4,16(2H,t), 7,20-8,02(5H,m)	153,7 ~ 160,6
127		H	H	F	Cl	1700, 1650, 1480, 1385	2,91(2H,t), 4,10(2H,t), 7,21-7,79 (5H,m)	162,8 ~ 165,5
128		H	H	F	Cl	1695, 1640, 1470, 1360	2,84(2H,t), 4,25(2H,t), 7,29-7,81 (7H,m)	152,7 ~ 154,8
129		H	H	Cl	Cl	1695, 1660, 1450, 1380	[DMSO-d ₆] 2,33(3H,s), 2,82 (2H,t), 3,97(2H,t), 7,22-7,86 (6H,m)	135,3 ~ 139,1
130		H	H	Cl	Cl	1660, 1630, 1440, 1330	2,73(2H,t), 4,07(2H,t), 7,21-7,75 (7H,m)	162,7 ~ 163,9
131		H	H	F	F	1700, 1660, 1440, 1380	2,70(2H,t), 4,02(2H,t), 6,71-7,78 (7H,m)	130,5 ~ 131,7
132		H	H	F	F	1700, 1660, 1500, 1395	2,69(2H,t), 3,82(2H,t), 6,79-7,40 (5H,m)	141,8 ~ 145,0
133		H	H	F	F	1700, 1650, 1495, 1385	2,20(3H,s), 2,67(2H,t), 3,83(2H,t), 6,87-7,69 (6H,m)	100,4 ~ 102,1
134		H	H	Br	Cl	1695, 1660, 1450, 1370	2,33(3H,s), 2,78(2H,t), 4,12(2H,t), 7,16-8,26 (6H,m)	161,7 ~ 165,4

Pl. sz.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	IR(KBr, cm ⁻¹)	NMR(CDCl ₃ , ppm)	Op. (°C)
135		H	H	Br	Cl	1700, 1660, 1450, 1390	2,85(2H,t), 4,11(2H,t), 7,19-8,22 (5H,m)	191,8 ~ 194,7
136		H	H	-CH ₃	Cl	1690, 1655, 1470, 1365	2,32(3H,s), 2,35(3H,s), 2,78(2H,t), 4,13(2H,t), 7,18-7,88 (6H,m)	114,0 ~ 119,7
137		H	H	-CH ₃	Cl	1695, 1660, 1470, 1390	2,35(3H,s), 2,82(2H,t), 4,13(2H,t), 7,20-7,86 (5H,m)	123,5 ~ 127,5
138		H	H	Br	Cl	1700, 1660, 1455, 1370	2,82(2H,t), 4,24(2H,t), 7,24-8,21 (7H,m)	178,1 ~ 180,2
139		H	H	-CH ₃	Cl	1695, 1650, 1480, 1365	2,32(3H,s), 2,80(2H,t), 4,24(2H,t), 7,05-7,82 (7H,m)	153,8 ~ 158,3
140		H	H	Cl	F	1695, 1660, 1480, 1360	2,36(3H,s), 2,78(2H,t), 4,12(2H,t), 7,00-8,10 (6H,m)	83,8 ~ 87,9
141		H	H	Cl	F	1695, 1660, 1480, 1380	2,82(2H,t), 4,08(2H,t), 7,10-8,12 (5H,m)	116,9 ~ 118,9
142		H	H	-OCH ₃ -OCH ₃		1675, 1640, 1405, 1335	2,25(3H,s), 2,78(2H,t), 3,52(3H,s), 3,87(3H,s), 4,24(2H,t), 7,02-7,40 (6H,m)	179,5 ~ 181,3
143	-C(CH ₃) ₃	-CH ₃	H	Cl	H	1700, 1660, 1480, 1180	1,27(3H,d), 1,40(9H,s), 2,86(2H,d), 4,91 (1H,m), 7,36-7,89(3H,m)	103,1 ~ 105,7
144		-CH ₃	H	Cl	H	1700, 1650, 1480, 1340	1,31(3H,d), 3,00(2H,d), 5,37(1H,m), 6,60-7,91(7H,m)	131,3 ~ 132,7


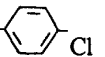
16. Táblázat
(XII) általános képletű vegyületek




















Pl. sz.	Vegy. sz.	R ¹	R ⁵	IR(KBr, cm ⁻¹)	NMR(DMSO-d ₆ , ppm)	Boml. (°C)
145	-		6-Cl	1650,1240, 900	2,83(2H,t),3,75(2H,t), 7,13-7,91(6H,m)	154,0




















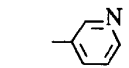
Pl. sz.	Vegy. sz.	R ¹	R ⁵	IR(KBr,cm ⁻¹)	NMR(DMSO-d ₆ , ppm)	Boml. (°C)
146	-	-OCH ₃	6-Cl	1710,1400, 1250	2,78(2H,t),3,70(3H,s), 3,78(2H,t),7,31-7,85 (3H,m)	185,0
147	-	-CH ₃	6-Cl	1660,1400, 1240	2,21(3H,s),2,79(2H,t), 3,80(2H,t),7,40-7,85 (3H,m)	152,8
148	2	-CH ₂ CH ₃	6-Cl	1660, 1395, 1285	0,97(3H,t),2,49(2H,q), 2,70(2H,t),3,74(2H,t), 7,25-7,81(3H,m)	204,7
149	-	-(CH ₂) ₃ CH ₃	6-Cl	1660,1270, 1245	0,86(3H,t),1,27(2H,m), 1,42(2H,m),2,49(2H,t), 2,76(2H,t),3,79(2H,t), 7,31-7,86(3H,m)	137,8
150	-	-(CH ₂) ₇ CH ₃	6-Cl	1670,1395, 1260	0,87(3H,t),1,00-1,82 (12H,m),2,56(2H,t), 2,73(2H,t),3,77(2H,t), 7,26-7,85(3H,m)	123,0
151	-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	6-Cl	1655,1390, 1250	0,88(6H,d),2,39(2H,d), 2,72(2H,t),3,23(1H,m), 3,77(2H,t),7,26-7,79 (3H, m)	139,3
152	-	-C(CH ₃) ₃	6-Cl	1640,1405, 1240	1,29(9H,s),2,73(2H,t), 3,83(2H,t),7,25-7,75 (3H,m)	170,5
153	-	-CH ₂ CH ₂ Cl	6-Cl	1655,1400, 1245	2,76(2H,t),3,04(2H,t), 3,06(2H,t),3,80(2H,t), 7,32-7,86(3H,m)	192,9
154	-	-C(CH ₃) ₂ - -CH ₂ Cl	6-Cl	1650,1400, 1260	1,37(6H,s),2,76(2H,t), 3,78(2H,s),3,84(2H,t), 7,26-7,75(3H,m)	187,8
155	-	-CH ₂ CH ₂ - -CO ₂ CH ₃	6-Cl	1740,1680, 1285	2,76(2H,t),3,29(4H,s), 3,53(3H,s),3,89(2H,t), 7,32-7,90(3H,m)	140,7
156	-	-CH ₂ OCH ₃	6-Cl	1660,1410, 1230	2,80(2H,t),3,29(3H,s), 3,73(2H,t),4,26(2H,s), 7,34-7,89(3H,m)	210,7
157	-		6-Cl	1660,1420, 1260	0,89(4H,m),1,98(1H,m), 2,72(2H,t),3,86(2H,t), 7,42-7,82(3H,m)	221,7
158	-		6-Cl	1650,1400, 1260	1,09-1,87(11H,m),2,70 (2H,t),3,79(2H,t), 7,41-7,83(3H,m)	167,9
159	-	-CH ₂ - 	6-Cl	1660,1390, 1240	2,66(2H,t),3,79(2H,t), 3,88(2H,s),7,05-7,79 (8H,m)	155,7
160	-	-CH=CH- 	6-Cl	1650,1380, 1215	2,78(2H,t),3,90(2H,t), 6,98(1H,d),7,60(1H,d), 7,30-7,87(8H,m)	169,5
161	-		6-Cl	1645,1380, 1250	2,81(2H,t),3,82(2H,t), 6,817,81(8H,m)	185,7
162	-		6-Cl	1660,1385, 1280	2,86(2H,t),3,83(2H,t), 6,89-8,52(7H,m)	231,8
163	-		6-Cl	1640,1420, 1280	2,83(2H,t),3,93(2H,t), 6,90-7,30(4H,m),7,66- 7,85(2H,m)	199,4
164	-		6-Cl	1640,1480, 1280	2,82(2H,t),3,46(3H,s), 3,63(2H,t),6,80-7,85 (7H,m)	107,2
165	-		6-Cl	1640,1380, 1250	2,81(2H,t),3,70(3H,s), 3,83(2H,t),6,70-7,76 (7H,m)	130,1



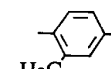

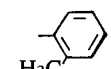



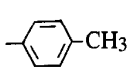

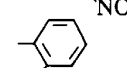
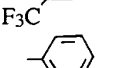
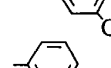
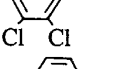
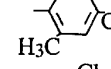
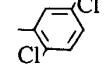


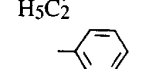
Pl. sz.	Vegy. sz.	R ¹	R ⁵	IR(KBr,cm ⁻¹)	NMR(DMSO-d ₆ , ppm)	Boml. (°C)
166	-		6-Cl	1655,1480, 1240	2,82(2H,t),3,62(2H,t), 7,15-7,90(7H,m)	151,8
167	9		6-Cl	1655,1380, 1280	2,83(2H,t),3,82(2H,t), 6,78-7,80(7H,m)	207,3
168	-	-CH ₂ CH ₃	6-Br	1660,1400, 1260	1,02(3H,t),2,47(2H,q), 2,73(2H,t),3,76(2H,t), 7,45-7,92(3H,m)	206,8
169	-		6-F	1655,1495, 1280	2,81(2H,t),3,53(2H,t), 7,29-7,67(6H,m)	159,0
170	-	-CH ₂ CH ₃	6-OCH ₃	1640,1400, 1245	1,01(3H,t),2,47(2H,q), 2,71(2H,t),3,72(2H,t), 3,76(3H,s),6,83-7,45 (3H,m)	159,6
171	-	-CH ₂ CH ₃	6-H	1660,1400, 1250	0,99(3H,t),2,43(2H,q), 2,72(2H,t),3,73(2H,t), 7,12-7,89(4H,m)	90,5
172	-		5-Cl	1650,1450, 1250	2,93(2H,t),3,80(2H,t), 6,60-7,45(7H,m)	229,0
173	-	-CH ₂ CH ₃	5-Cl	1655,1395, 1250	1,00(3H,t),2,44(2H,q), 2,83(2H,t),3,69(2H,t), 7,32(3H,m)	126,2
174	1	-C(CH ₃) ₃	5-Cl	1650,1400, 1270	1,23(9H,s),2,83(2H,t), 3,77(2H,t),7,25(3H,m)	178,0
175	-		5-Cl	1650,1380, 1240	2,24(3H,s),2,97(2H,t), 3,80(2H,t), 6,86-7,44(7H,m)	146,2
176	-		6-Cl	1640,1370 1235	2,23(3H,s),2,84(2H,t), 3,82(2H,t), 6,97-7,96(7H,m)	174,7

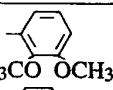
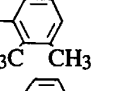
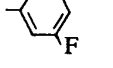
17. Táblázat
(XIII) általános képletű vegyületek

Pl. sz.	Vegy. sz.	R ¹	R ⁵	IR(KBr,cm ⁻¹)	NMR(DMSO-d ₆ , ppm)	Boml. (°C)
177	-		8-Cl	1665,1395, 1250	2,82(2H,t),3,55(2H,t), 7,05-7,95(6H,m)	207,0
178	-	-CH ₂ CH ₃	8-Cl	1660,1380, 1240	0,99(3H,t),2,47(2H,q), 2,74(2H,t),3,48(2H,t), 7,10-7,85(3H,m)	150,0
179	5	-C(CH ₃) ₃	8-Cl	1660,1280, 1250	1,32(9H,s),2,77(2H,t), 3,80(2H,t),7,05-7,82 (3H, m)	187,6
180	-		8-Cl	1650,1450, 1280	2,80(2H,t),3,27(2H,t), 7,12-7,90(7H,m)	170,6
181	3	-CH ₂ CH ₃	7-Cl	1660,1395, 1245	1,02(3H,t),2,48(2H,q), 2,77(2H,t),3,76(2H,t), 7,15-7,96(3H,m)	152,1
182	4	-C(CH ₃) ₃	7-Cl	1650,1395, 1240	1,30(9H,s),2,76(2H,t), 3,87(2H,t),7,10-7,90 (3H,m)	247,3
183	-	-C(CH ₃) ₂ - -CH ₂ Cl	7-Cl	1660,1415, 1255	1,38(6H,s),2,77(2H,t), 3,83(2H,s),3,88(2H,t), 7,10-7,88(3H,m)	170,6

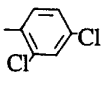
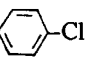
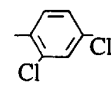
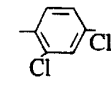
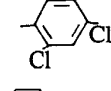

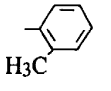


Pl. sz.	Vegy. sz.	R ¹	R ⁵	IR(KBr,cm ⁻¹)	NMR(DMSO-d ₆ , ppm)	Boml. (°C)
184	-		7-Cl	1660,1385, 1240	3,84(2H,t),3,68(2H,t), 7,12-8,00(7H,m)	154,9
185	-		7-Cl	1660,1380, 1280	2,87(2H,t),3,79(2H,t), 7,05-7,95(7H,m)	171,2
186	10		7-Cl	1660,1495, 1280	2,83(2H,t),3,81(2H,t), 6,95-7,91(7H,m)	111,3
187	-		7-Cl	1650,1390, 1250	2,80(2H,t),3,46(3H,s), 4,09(2H,t),6,79-7,89 (7H,m)	173,0
188	-		7-Cl	1655,1385, 1245	2,80(2H,t),3,80(2H,t), 6,90-7,92(7H,m)	163,5
189	13		7-Cl	1670,1395, 1245	2,84(2H,t),3,57(2H,t), 6,95-7,95(7H,m)	205,5
190	-		7-Cl	1670,1520, 1235	2,81(2H,t),3,70(2H,t), 7,10-8,30(7H,m)	248,1
191	12		7-Cl	1660,1530, 1240	2,79(2H,t),3,47(2H,t), 7,09-8,40(6H,m)	190,5
192	-		7-Br Cl	1670,1400, 1250	2,86(2H,t),3,64(2H,t), 7,24-7,86(6H,m)	206,2
193	7		7-F Cl	1660,1395, 1240	2,80(2H,t),3,59(2H,t), 6,80-8,00(6H,m)	159,5
194	-		7-OCH ₃	1660,1390, 1240	1,02(3H,t),2,52(2H,q), 2,71(2H,t),3,72(2H,t), 3,77(3H,s),6,69-7,85 (3H,m)	149,5
195	-		7-Cl	1645,1370 1245	1,29(9H,s),2,81(2H,t), 3,82 (2H,t), 6,96-7,92(7H,m)	193,5
196	21		7-Cl	1670,1390 1225	2,21(3H,s),2,80(2H,t), 3,69(2H,t), 7,09-7,91(6H,m)	184,7
197	-		7-Cl	1670,1375 1255	2,85(2H,t), 3,87(2H,t), 6,99-7,98(8H,m)	166,7
198	-		7-Cl	1660,1390 1240	2,30(3H,s), 2,80(2H,t),3,70(2H,t), 7,11-7,90(6H,m)	195,2
199	-		7-Cl	1650,1370 1240	2,78(2H,t), 3,66(2H,t), 7,02-7,87(10H,m)	169,7
200	-		7-Cl	1650,1380 1255	2,87(2H,t), 3,86(2H,t), 7,01-7,96(10H,m)	188,2
201	-		7-Cl	1660,1385, 1240	2,89(2H,t), 3,60(2H,t),7,06-7,98 (7H,m)	170
202	-		7-CH ₃	1655, 1395, 1240	2,15(3H,s),2,82(2H,t), 3,70(2H,t), 6,85-7,83(6H,m)	158,6













Pl. sz.	Vegy. sz.	R ¹	R ⁵	IR(KBr,cm ⁻¹)	NMR(DMSO-d ₆ , ppm)	Boml. (°C)
203	-		7-I	1650,1400, 1240	2,87(2H,t),3,79(2H,t), 7,30-7,88(6H,m)	190,4
204	-		7-CF ₃	1640,1380, 1210	2,89(2H,t),3,70(2H,t), 7,29-8,17(6H,m)	179,7
205	-		7-COCH ₃	1655,1395, 1220	1,99(3H,s),2,88(2H,t), 4,07(2H,t), 7,30-7,91(6H,m)	160,4
206	-		7-OCH ₃	1650,1400, 1250	2,84(2H,t),3,50(3H,s), 3,75(2H,t), 6,60-7,81(6H,m)	149,8
207	-		7-N(CH ₃) ₂	1640,1395, 1215	2,72(6H,s),2,80(2H,t), 3,89(2H,t), 6,47-7,79(6H,m)	188,6
208	-		7-CO ₂ -CH ₃	1725,1655, 1395,1260	2,83(2H,t),3,72(2H,t), 3,78(3H,s), 7,38-8,06(6H,m)	182,2
209	-		7-OH	1640,1405, 1240	2,76(2H,t), 3,72(2H,t), 6,45-7,69(6H,m)	209,6
210	-		7-F	1660,1385, 1250	2,80(2H,t),3,78(2H,t), 6,57-7,89(8H,m)	148,9
211	-		7-SCH ₃	1650,1390, 1240	2,21(3H,s),2,90(2H,t), 3,70(2H,t), 7,00-7,90(6H,m)	177,7
212	-		7-SO ₂ -CH ₃	1655,1405, 1235	2,97(2H,t),3,06(3H,s), 3,73(2H,t), 7,45-8,17(6H,m)	191,5
213	-		7-SO-CH ₃	1650,1390, 1240	2,61(3H,s),3,11(2H,t), 3,92(2H,t), 7,45-8,16(6H,m)	172,3
214	-		7-F	1660,1380, 1250	2,22(3H,s),2,83(2H,t), 3,79(2H,t), 6,95-8,07(7H,m)	179,3
215	-		7-NO ₂	1640,1405, 1260	2,95(2H,t), 2,78(2H,t),7,50-8,32 (6H,m)	226,6
216	-		7-OH	1610,1390, 1240	2,23(3H,s),2,79(2H,t), 3,76(2H,t), 6,56-7,82(7H,m)	196,7
217	-		7-OH	1610,1395, 1245	2,82(2H,t),3,85(2H,t), 6,29-7,80(8H,m), 9,68(1H,s)	182,7
218	-		7-Cl	1645,1480, 1260	2,87(2H,t),3,77(3H,s), 3,87(2H,t), 6,94-8,02(7H,m)	189,4
219	-		7-Cl	1635,1390, 1240	2,88(2H,t), 3,88(2H,t), 6,81-7,98(7H,m)	205,2
220	-		7-Br	1645,1380, 1245	2,88(2H,t), 3,88 (2H,t), 7,22-7,95 (8H,m)	168,4
221	-		7-Br	1655,1380, 1225	2,22(3H,s),2,83(2H,t), 3,78(2H,t), 7,24-7,92(7H,m)	197,9
222	-		7-Cl	1655,1395, 1215	2,93(2H,t),3,90(2H,t), 7,20-7,62(3H,m),7,95-8,06(2H,m),8,70-8,77 (2H,m)	208,9

Pl. sz.	Vegy. sz.	R ¹	R ⁵	IR(KBr,cm ⁻¹)	NMR(DMSO-d ₆ , ppm)	Boml. (°C)
223	-		7-Cl	1650,1385, 1250	2,89(2H,t), 3,90(2H,t), 7,11-7,58(3H,m),7,74-8,08(3H,m),8,53-8,62 (1H,m)	190,2
224	-		7-Cl	1640,1405, 1225	2,91(2H,t),3,80(2H,t), 7,24-7,53(2H,m),7,90-8,09(3H,m),8,88-8,98 (2H,m)	242,0
225	-		7-I	1650,1375, 1240	2,22(3H,s),2,82(2H,t), 3,76 (2H,t), 7,17-7,79(7H,m)	174,2
226	-		7-I	1640,1360, 1240	2,87(2H,t), 194,1 3,87(2H,t), 7,19-7,77(8H,m)	
227	-		8-Cl	1650, 1370, 1245	2,42(3H,s),3,84(2H,t), 3,55 (2H,t), 7,12-7,98(7H,m)	179,2
228	-		7-Cl	1660,1380, 1250	2,90(2H,t),3,93(2H,t), 7,22-7,33(2H,m),7,95(1H,d),8,59-8,63(1H,m), 8,75(1H,d),8,97-9,04(1H,m)	174,6
229	-		7-Cl	1640,1405, 1240	2,89(2H,t),4 00(2H,t), 7,05-8,03(6H,m),	160,7
230	-		7-Cl	1640,1405, 1240	2,87(2H,t), 3,93(2H,t), 7,09-8,02(6H,m)	155,8
231	-		7-Cl	1665,1400, 1365,1255	2,85(2H,t),2,34(3H,s), 3,86(2H,t), 7,08-8,02(7H,m) *	192,0
232	-		7-Cl	1660,1350, 1250	2,90(2H,t), 3,87(2H,t), 7,19-8,36(7H,m) *	168,0
233	-		7-Cl	1655,1410, 1220	2,89(2H,t),3,69(2H,t), 7,23-8,28(7H,m), *	232,0
234	-		7-Cl	1670,1365, 1255	2,85(2H,t),2,32(3H,s), 3,86 (2H,t), 7,14-8,26(7H,m) *	134,0
235	-		7-Cl	1670,1415, 1390,1255	2,85(2H,t), 3,68(2H,t), 7,22-8,27(6H,m) *	203,0
236	-		7-Cl	1660,1375, 1245	2,20(3H,s),2,30(3H,s), 2,82(2H,t),3,76(2H,t), 7,09-8,03(6H,m) *	138,0
237	-		7-Cl	1660,1405, 1230	2,84(2H,t), 3,56(2H,t), 7,17-8,13(6H,m) *	177,8
238	22		7-Cl	1660,1380, 1270	2,83(2H,t), 3,56(2H,t), 7,03-8,02 (6H,m) *	185,0
239	24		7-Cl	1660,1375, 1240	1,14(3H,t),2,59(2H,q), 2,80(2H,t),3,73(2H,t), 6,91-8,02(7H,m) *	175,9
240	-		7-Cl	1650,1385, 1245	1,25(3H,t),2,90(2H,t), 3,76(2H,q), 3,76(2H,t), 6,87-7,99(7H,m) *	138,0
241	-		7-Cl	1650,1415, 1380,1280	2,83(2H,t),3,65(6H,s), 3,83(3H,s), 6,77-7,99(5H,m) *	129,0

Pl. sz.	Vegy. sz.	R ¹	R ⁵	IR(KBr,cm ⁻¹)	NMR(DMSO-d ₆ , ppm)	Boml. (°C)
242	23		7-Cl	1660,1385, 1270	2,81(2H,t),3,64(3H,s), 3,80(3H,s), 6,84-8,01(6H,m) *	127,0
243	-		7-Cl	1660,1380, 1250	2,14(3H,s),2,25(3H,s), 2,80(2H,t),3,71(2H,t), 7,16-8,03(6H,m) *	151,0
244	-		7-Cl	1655,1380, 1255	2,87(2H,t), 3,85(2H,t), 7,16-8,04(7H,m) *	116,0

18. Táblázat
(XIV) általános képletű vegyületek

Pl. sz.	Vegy. sz.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	IR(KBr, cm ⁻¹)	NMR(DMSO-d ₆ , ppm)	Boml. (°C)
245	17		H	H	Cl	Cl	1660, 1395, 1245	2,79(2H,t), 3,53(2H,t), 7,29-7,93, (5H,m)	137,5
246	-		-CH ₃	H	Cl	H	1620, 1480, 1260	0,99(3H,d), 2,81(2H,d), 4,82(1H,m), 7,05-7,82 (7H,m)	168,7
247	16	-C(CH ₃) ₃	-CH ₃	H	Cl	H	1650, 1410, 1280	1,01(3H,d), 1,30(9H,s), 2,74(2H,d), 4,82(1H,m), 7,28-7,80 (3H,m)	159,6
248	8		H	-CH ₃	Cl	H	1650, 1395, 1280	1,10(3H,d), 3,48(2H,d), 3,60(1H,m), 7,15-7,85 (6H,m)	196,7
249	-		H	H	F	Cl	1665, 1395, 1240	2,83(2H,t), 3,55(2H,t), 7,34-7,73 (5H,m)	221,7
250	-		H	H	H	H	1650, 1400, 1240	2,88(2H,t), 3,79(2H,t), 7,01-7,98 (7H,m)	191,8
251	19		H	H	F	Cl	1665, 1400, 1235	2,85(2H,t), 3,84(2H,t), 7,22-7,76 (7H,m)	212,3
252	-		H	H	Cl	Cl	1660, 1380, 1225	2,29(3H,s), 2,81(2H,t), 3,78(2H,t), 7,05-8,98 (6H,m)	200,6
253	-		H	H	Cl	Cl	1660, 1380, 1225	2,77(2H,t), 3,72(2H,t), 7,19-7,80 (7H,m)	217,8
254	-		H	H	F	F	1660, 1400,	2,85(2H,t), 3,85(2H,t),	181,1

Pl. sz.	Vegy. sz.	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	IR(KBr, cm ⁻¹)	NMR(DMSO-d ₆ , ppm)	Boml. (°C)
	-						1240	7,02-7,90 (7H,m)	
255	-		H	H	F	F	1660, 1405, 1255	2,85(2H,t), 3,55(2H,t), 7,49-7,91 (5H,m)	160,4
256	-		H	H	F	F	1660, 1390, 1250	2,26(3H,s), 2,82(2H,t), 3,73(2H,t), 7,06-7,96 (6H,m)	162,1
257	-		H	H	Br	Cl	1655, 1380, 1240	2,28(3H,s), 2,90(2H,t), 3,81(2H,t), 7,26-8,27 (6H,m)	162,5
258	-		H	H	Br	Cl	1660, 1385, 1230	2,86(2H,t), 3,69(2H,t), 7,47-8,15 (5H,m)	164,5
259	20		H	H	-CH ₃	Cl	1645, 1380, 1240	2,20(3H,s), 2,30(3H,s), 2,81(2H,t), 3,76 (2H,t), 7,04-7,86 (6H,m)	183,5
260	-		H	H	-CH ₃	Cl	1670, 1395, 1240	2,33(3H,s), 2,86(2H,t), 3,61(2H,t), 7,38-7,87 (5H,m)	218,5
261	-		H	H	Br	Cl	1660, 1380, 1245	2,87(2H,t), 3,87(2H,t), 7,30-8,20 (7H,m)	211,5
262	-		H	H	-CH ₃	Cl	1655, 1370, 1255	2,32(3H,s), 2,86(2H,t), 3,86(2H,t), 7,05-7,89 (7H,m)	202,8
263	-		H	H	Cl	F	1665, 1380, 1240	2,24(3H,s), 2,83(2H,t), 3,78(2H,t), 7,05-8,06 (6H,m)	179,3
264	-		H	H	Cl	F	1655, 1390, 1240	2,84(2H,t), 3,69(2H,t), 7,42-8,09 (5H,m)	185,5
265	-		H	H	-O- CH ₃	-O- CH ₃	1620, 1400, 1260	2,15(3H,s), 2,84(2H,t), 3,25(3H,s), 3,76(3H,s), 3,91(2H,t), 7,12-7,34 (6H,m)	164,6
266	-		H	H	H	H	1625, 1375, 1040	2,21(3H,s), 2,85(2H,t), 3,82(2H,t), 6,99-7,99 (8H,m)	136,9

A továbbiakban néhány készítmény előállításí példát adunk, nem korlátozó jelleggel.

A készítmény (kapszula)

40 g 6. vegyületet, 645 laktózt és 15 g magnézium-sztearátot homogéneen elkeverünk. Az elegyből kemény zselatin-kapszulákba 350 mg-ot töltünk.

B készítmény (tabletta)

Kiméruünk 50 g 6. vegyületet, 800 g laktózt, 120 g burgonyakeményítőt, 15 g poli(vinil-alkohol)-t és 15 g magnézium-sztearátot. A hatóanyagot, laktózt és burgonyakeményítőt homogéneen elkeverjük, majd az elegyhez hozzáadjuk a poli(vinil-alkohol) vizes oldatát, és nedves granulálást végzünk. A granulátumokat megszáritjuk, magnézium-sztearáttal keverjük, és 200 mg-os tablettákká sajtoljuk.

C készítmény (por)

100 g 11. vegyületet, 890 mg laktózt és 10 g magnézium-sztearátot homogéneen elkeverünk, így 10 %-os por készítményt kapunk.

D készítmény (végbélkúp)

100 g 4. vegyületet, 180 g polietilén-glikol 1500-t, 720 g polietilén-glikol 4000-t alaposan elkeverünk egy mozsárban, és kúpokká olvasztjuk.

E készítmény (injekció)

1 g 11. vegyületet feloldunk 200 ml injekciós vízben, az oldatot megszűrjük, és sterilizáljuk. 2 ml-enként 5 ml-es ampullákba töltjük, és lezárjuk.

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Eljárás (I) általános képletű 1-acil-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-4-oxim- származékok és ezek sói előállítására - a képletben

R¹ jelentése 1 - 8 szénatomos, egyenes vagy elágazó szénláncú alkilcsoport, 1 - 4 szénatomos, halogénezett, egyenes vagy elágazó szénláncú alkilcsoport, 3 - 6 szénatomos cikloalkilcsoport, 1 - 4 szénatomos alkoxycsoport, metoxi-metil-csoport, metoxi-karbonil-etil-csoport, benzilcsoport, sztirilcsoport, naftilcsoport, piridilcsoport, tienilcsoport, pirazinilcsoport, adott esetben egy háromszorosan helyettesített fenilcsoport, a helyettesítők lehetnek azonosak vagy eltérők, éspedig 1 - 4 szénatomos, egyenes vagy elágazó szénláncú alkilcsoport, hidroxilcsoport, nitro-csoport, 1 - 4 szénatomos alkoxycsoport, trifluor-metil-csoport, halogénatom,

R² és R³ jelentése azonos vagy eltérő, éspedig metilcsoport vagy hidrogénatom,

R⁴ jelentése karboxi-metil-csoport, szulfocsoport, metánszulfonilcsoport vagy metoxi-foszfo-csoport,

R⁵ és R⁶ jelentése azonos vagy eltérő, éspedig hidrogénatom, halogénatom, hidroxilcsoport, metil-tio-csoport, metil-szulfonil-csoport, metánszulfonil-csoport, N,N-dimetil-amino-csoport, nitro-csoport, acetyl-csoport, metilcsoport, trifluor-metil-csoport, metoxi-karbonil-csoport vagy metoxycsoport,

a hullámvonallal jelölt kötés anti- vagy szin-konfigurációt jelöl -

azzal jellemezve, hogy egy (II) általános képletű 1-acil-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinont, ahol R¹, R², R³, R⁵ és R⁶ jelentése a fenti, hidroxil-aminnal reagál-

tatunk, és a kapott 1-acil-2,3-dihidro-4(1H)-kinolin-4-oxim-származékot kén-trioxiddal, halogénezett foszforsav-észterrel, halogénezett ecetsavval, halogénezett ecetsav-észterrel vagy metánszulfonil-halogeniddel vagy a (II) általános képletű vegyületet szeretlen bázis jelenlétében, előnyösen alkálifém-karbonát jelenlétében hidroxil-amin-O-szulfonsavval reagáltatjuk. (Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)

2. Eljárás gyógyszerkészítmények előállítására, azzal jellemezve, hogy valamely, az 1. igénypont szerinti eljárással előállított (I) általános képletű vegyületet, ahol R¹, R², R³, R⁴, R⁵ és R⁶ jelentése az 1., igénypont szerinti, vagy annak sóját a gyógyszerkészítésben szokásos vívő-, hígító- és/vagy egyéb segédanyagokkal összekeverve gyógyszerkészítménnyé alakítunk. (Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)

3. A 2. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy R⁴ helyén szulfocsoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk. (Elsőbbsége: 1987.04.15.)

4. A 2. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy R⁵ és R⁶ közül legalább az egyik helyén 7-helyzetben lévő halogénatomot tartalmazó vegyületet alkalmazunk. (Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)

5. A 4. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy R¹ helyén fenilcsoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk. (Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)

6. A 4. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy R¹ helyén 2-halogén-fenil-csoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk. (Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)

7. A 4. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy R¹ helyén 2-metil-fenil-csoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk. (Elsőbbsége: 1987. 04.15.)

8. A 4. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy R¹ helyén 2-etil-fenil-csoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk. (Elsőbbsége: 1987.04. 15.)

9. A 4. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy R¹ helyén 2-trifluor-metil-fenil-csoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk. (Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)

10. A 4. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy R¹ helyén 2-metoxi-fenil-csoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk. (Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)

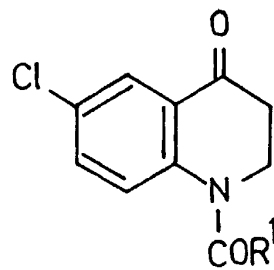
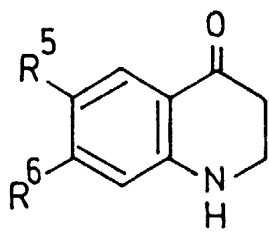
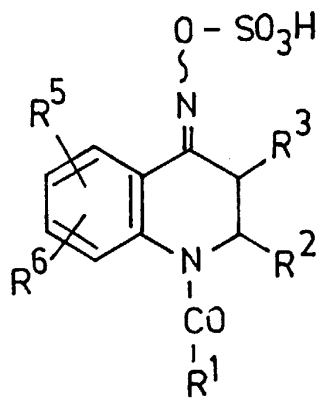
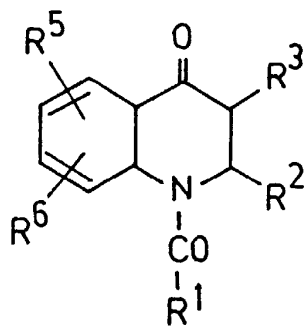
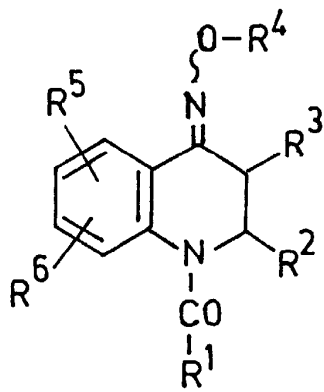
11. A 4. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy R¹ helyén nitrofenil-csoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk. (Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)

12. A 4. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy R¹ helyén 4-klór-fenil-csoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk. (Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)

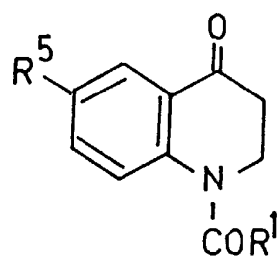
13. A 4. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy R¹ helyén 2,4-diklór-fenil-csoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk. (Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)

14. A 4. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy R¹ helyén 2,4-dimetil-fenil-csoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk.

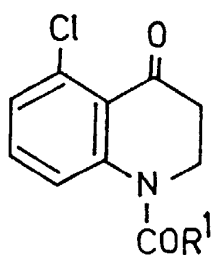
- (Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)
15. A 4. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy R¹ helyén 2,6-difluor-fenil-csoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk.
(Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)
16. A 4. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy R¹ helyén 2,3-dimetoxi-fenil-csoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk.
(Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)
17. A 4. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy R¹ helyén 4-klór-2-metil-fenil-csoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk.
(Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)
18. A 4. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy R¹ helyén 1,1-dimetil-etil-csoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk.
(Elsőbbsége: 1987. 04. 15.)
19. A 4. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy R¹ helyén 2-klór-1,1-dimetil-etil-csoportot tartalmazó vegyületet alkalmazunk.
(Elsőbbsége: 1987.04.15.)
20. Eljárás (I) általános képletű 1-acil-2,3-dihidro-4(1H)-kinolinon-4-oxim- származékok és ezek sói előállítására - a képletben
R¹ jelentése 1-8 szénatommos egyenes vagy elágazó szénláncú alkilcsoport, 1-4 szénatomos, halogénezett, egyenes vagy elágazó szénláncú alkilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, metoxicssoport, metoxi-metil-csoport, metoxi-karbonil-etil-csoport, benzilcsoport, sztirilcsoport, piridilcsoport, tienilcsoport, adott esetben egy-háromszorosan helyettesített fenil-
- csoport, a helyettesítők lehetnek azonosak vagy eltérők, éspedig metilcsoport, nitrocssoport, halogénatom,
R² és R³ jelentése azonos vagy eltérő, éspedig metilcsoport vagy hidrogénatom,
R⁴ jelentése karboxi-metil-csoport, szulfocsoport vagy metoxi- foszfocsoport,
R⁵ és R⁶ jelentése azonos vagy eltérő, éspedig hidrogénatom, halogénatom vagy metoxicssoport,
a hullámvonallal jelölt kötés anti- vagy szin-konfigurációt jelöl -,
azzal jellemezve, hogy egy (II) általános képletű 1-acil-2,3-dihidro-4(1H)- kinolinont, ahol R¹, R², R³ R⁵ és R⁶ jelentése a fenti, hidroxil-aminnal reagáltatunk, és a kapott 1-acil-2,3-dihidro- 4(1H)-kinolin-4-oxim-származékokat kén-trioxiddal, halogénezett foszforsav- észterrel, halogénezett ecetsavval, halogénezett ecetsav-észterrel vagy metánszulfonil-halogeniddel vagy szervesetlen bázis jelenlétében, előnyösen alkálifém-karbonát jelenlétében hidroxil-amin-O-szulfonsavval reagáltatjuk
(Elsőbbsége: 1986.05.02.)
21. Eljárás gyógyszerkészítmények előállítására, *azzal jellemezve*, hogy valamely, a 20. igénypont szerinti eljárással előállított (I) általános képletű vegyületet, ahol R¹, R², R³, R⁴, R⁵ és R⁶ jelentése a 20. igénypont szerinti vagy annak sóját a gyógyszerkészítésben szokásos vivő-, hígító- és/vagy egyéb segédanyagokkal összekeverve gyógyszerkészítménnyé alakítunk.
(Elsőbbsége: 1986.05.02.)



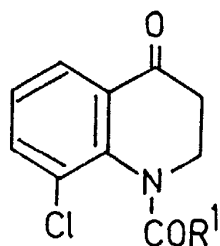
3/2



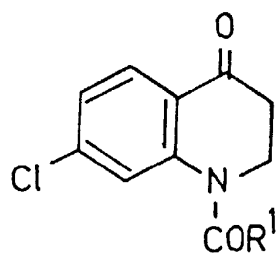
(VI)



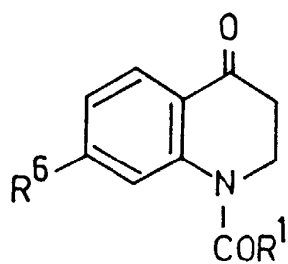
(VII)



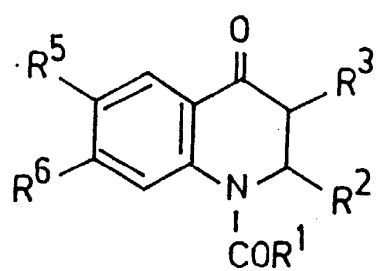
(VIII)



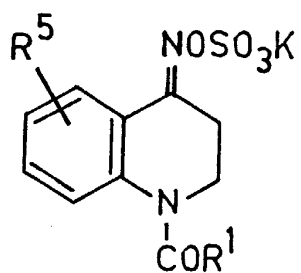
(IX)



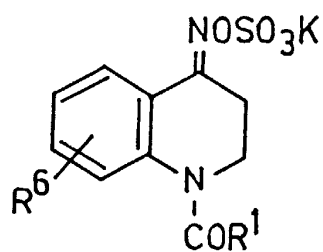
(X)



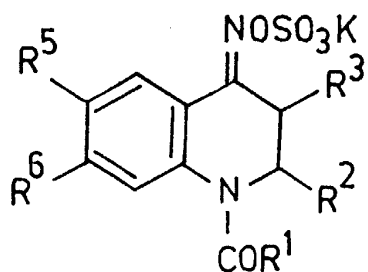
(XI)



(XII)



(XIII)



(XIV)