

12 **EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG**

21 Anmeldenummer: 85115997.0

51 Int. Cl.⁴: **C 07 C 101/30**
C 07 C 125/065, C 07 C 99/00
A 61 K 31/195

22 Anmeldetag: 14.12.85

30 Priorität: 24.12.84 DE 3447295

71 Anmelder: **Asta-Werke Aktiengesellschaft Chemische Fabrik**
Artur-Ladebeck-Strasse 128 - 152
D-4800 Bielefeld 14(DE)

43 Veröffentlichungstag der Anmeldung:
02.07.86 Patentblatt 86/27

72 Erfinder: **Lautenschläger, Hans-Heiner, Dr.**
Neusser Gasse 50
D-5024 Pulheim(DE)

84 Benannte Vertragsstaaten:
AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE

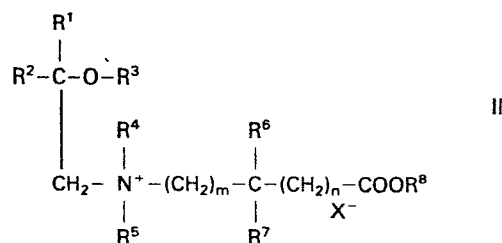
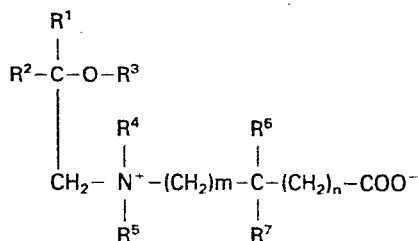
72 Erfinder: **Dereu, Norbert, Dr.**
An der Holzhecke 11
D-5020 Frechen-Bachem(DE)

72 Erfinder: **Niemann, Reinhard, Dr.Dr.**
Kurt-Schumacher Strasse 10
D-5060 Bergisch-Gladbach 1(DE)

72 Erfinder: **Hameister, Walter, Dr.**
Tomburgstrasse 10
D-5024 Pulheim-Brauweiler(DE)

54 **Neue N-(2-Hydroxyalkyl)-aminosäuren und ihre Derivate, Verfahren zu ihrer Herstellung und diese enthaltende pharmazeutische Präparate.**

57 Die vorliegende Erfindung betrifft neue N-(2-Hydroxyalkyl)-aminosäuren und ihre Derivate der allgemeinen Formeln I und II,



Verfahren zu ihrer Herstellung und diese enthaltende pharmazeutische Präparate.

1

5

10 ASTA-Werke Aktiengesellschaft, Chemische Fabrik
Artur-Ladebeck-Straße 128-152, 4800 Bielefeld 14

15 Titel: Neue N-(2-Hydroxyalkyl)-aminosäuren und
ihre Derivate, Verfahren zu ihrer Her-
stellung und diese enthaltende pharma-
zeutische Präparate

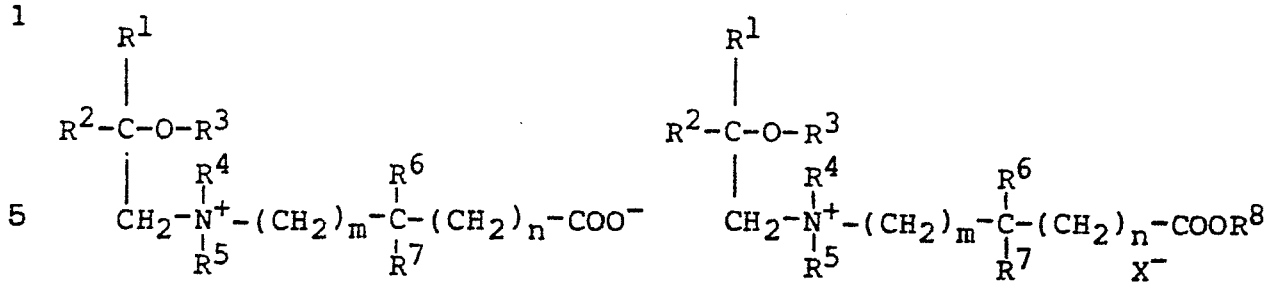
20

Beschreibung

25 Die vorliegende Erfindung betrifft neue N-(2-Hydroxy-
alkyl)-aminosäuren und ihre Derivate, die sich durch wert-
volle pharmakologische Eigenschaften auszeichnen, sowie
Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als
Wirkstoff in Arzneimitteln. Sie können insbesondere zur
30 Behandlung von Pilzkrankheiten und Tumoren eingesetzt wer-
den.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen besitzen außerdem eine
antimykotische und herbizide Wirkung.

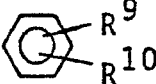
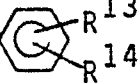
35 Die erfindungsgemäßen Verbindungen entsprechen den all-
gemeinen Formeln I und II.

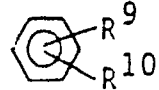


I

II

worin

- 10 R^1 einen Alkylrest mit 10-20 Kohlenstoffatomen,
- R^2 Wasserstoff oder einen Alkylrest mit 1-4 Kohlenstoffatomen und
- 15 R^3 Wasserstoff, einen gesättigten oder ungesättigten, geradkettigen oder verzweigten Alkylrest mit 1-20 Kohlenstoffatomen, einen Aralkylrest der
- Formel $-(CH_2)_p-$  R^9
 R^{10}
- 20 mit p gleich 1-4, $-CO-R^{11}$, $-COOR^{11}$, $-CO-NR^{11}R^{12}$, $-CS-NH-R^{11}$, $-O_2S-R^{11}$ bedeuten, während
- R^4, R^5 gleich oder verschieden sind und für Wasserstoff, einen Alkylrest mit 1-4 Kohlenstoffatomen, Phenyl oder Benzyl,
- 25 R^6, R^7 gleich oder voneinander verschieden sind und für Wasserstoff, einen linearen oder verzweigten Alkylrest mit 1-4 Kohlenstoffatomen, einen Aralkylrest der Formel
- 30 $-(CH_2)_q-$  R^{13}
 R^{14}
- mit q gleich 0-4, eine Methylthioethyl-Gruppe und
- R^8 für Wasserstoff oder einen Alkylrest mit 1-6 Kohlenstoffatomen stehen,
- 35 $R^9, R^{10}, R^{13}, R^{14}$ gleich oder voneinander verschieden sind und Wasserstoff, Halogen, einen Alkyl- oder Alkoxy-Rest mit 1-4 Kohlenstoffatomen, eine Trifluormethylgruppe oder

- 1
 jeweils zusammen ($R^9 + R^{10}$; $R^{13} + R^{14}$)
 eine Methylendioxygruppe,
 R^{11}, R^{12} gleich oder voneinander verschieden sind
 und Wasserstoff, einen gesättigten oder
 5 ungesättigten, linearen oder verzweigten
 Alkylrest mit 1-19 Kohlenstoffatomen,
 einen Aalkylrest der
 Formel $-(CH_2)_r-$ 
 10 mit r gleich 0-4 bedeuten, während
 X^- ein Säureanion einer anorganischen oder
 organischen, ein- oder mehrbasischen Säure
 und die Summe aus
 $m + n$ eine ganze Zahl von 0-10 bedeuten.
 15

Erfindungsgemäße Verbindungen sind beispielsweise:

- N,N -Dimethyl- N -(2-hydroxydodecyl)-ammonioacetat
 N,N -Dimethyl- N -(2-hydroxytridecyl)-ammonioacetat
 N,N -Dimethyl- N -(2-hydroxytetradecyl)-ammonioacetat
 20 N,N -Dimethyl- N -(2-hydroxypentadecyl)-ammonioacetat
 N,N -Dimethyl- N -(2-hydroxyhexadecyl)-ammonioacetat
 N,N -Dimethyl- N -(2-hydroxyheptadecyl)-ammonioacetat
 N,N -Dimethyl- N -(2-hydroxyoctadecyl)-ammonioacetat
 N,N -Dimethyl- N -(2-hydroxynonadecyl)-ammonioacetat
 25 N,N -Dimethyl- N -(2-hydroxyeicosyl)-ammonioacetat
 N,N -Dimethyl- N -(2-hydroxyheneicosyl)-ammonioacetat
 N,N -Dimethyl- N -(2-hydroxydocosyl)-ammonioacetat
 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl- N -(2-hydroxydodecyl)-ammonio $\sqrt{}$ -propionat
 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl- N -(2-hydroxytridecyl)-ammonio $\sqrt{}$ -propionat
 30 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl- N -(2-hydroxytetradecyl)-ammonio $\sqrt{}$ -propionat
 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl- N -(2-hydroxypentadecyl)-ammonio $\sqrt{}$ -propionat
 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl- N -(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{}$ -propionat
 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl- N -(2-hydroxyheptadecyl)-ammonio $\sqrt{}$ -propionat
 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl- N -(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{}$ -propionat
 35 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl- N -(2-hydroxynonadecyl)-ammonio $\sqrt{}$ -propionat
 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl- N -(2-hydroxyeicosyl)-ammonio $\sqrt{}$ -propionat
 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl- N -(2-hydroxyheneicosyl)-ammonio $\sqrt{}$ -propionat
 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl- N -(2-hydroxydocosyl)-ammonio $\sqrt{}$ -propionat

- 1 4- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydodecyl)-ammonio γ -butyrat
4- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytridecyl)-ammonio γ -butyrat
4- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytetradecyl)-ammonio γ -butyrat
5 4- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxypentadecyl)-ammonio γ -butyrat
4- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio γ -butyrat
4- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheptadecyl)-ammonio γ -butyrat
4- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio γ -butyrat
4- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxynonadecyl)-ammonio γ -butyrat
10 4- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyeicosyl)-ammonio γ -butyrat
4- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheneicosyl)-ammonio γ -butyrat
4- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydocosyl)-ammonio γ -butyrat
5- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydodecyl)-ammonio γ -pentanoat
5- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytridecyl)-ammonio γ -pentanoat
15 5- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytetradecyl)-ammonio γ -pentanoat
5- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxypentadecyl)-ammonio γ -pentanoat
5- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio γ -pentanoat
5- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheptadecyl)-ammonio γ -pentanoat
5- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio γ -pentanoat
20 5- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxynonadecyl)-ammonio γ -pentanoat
5- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyeicosyl)-ammonio γ -pentanoat
5- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheneicosyl)-ammonio γ -pentanoat
5- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydocosyl)-ammonio γ -pentanoat
6- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydodecyl)-ammonio γ -hexanoat
25 6- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytridecyl)-ammonio γ -hexanoat
6- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytetradecyl)-ammonio γ -hexanoat
6- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxypentadecyl)-ammonio γ -hexanoat
6- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio γ -hexanoat
6- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheptadecyl)-ammonio γ -hexanoat
30 6- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio γ -hexanoat
6- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxynonadecyl)-ammonio γ -hexanoat
6- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyeicosyl)-ammonio γ -hexanoat
6- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheneicosyl)-ammonio γ -hexanoat
6- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydocosyl)-ammonio γ -hexanoat
35 7- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydodecyl)-ammonio γ -heptanoat
7- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytridecyl)-ammonio γ -heptanoat
7- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytetradecyl)-ammonio γ -heptanoat
7- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxypentadecyl)-ammonio γ -heptanoat

- 1 7- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio Δ -heptanoat
7- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheptadecyl)-ammonio Δ -heptanoat
7- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio Δ -heptanoat
5 7- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxynonadecyl)-ammonio Δ -heptanoat
7- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyeicosyl)-ammonio Δ -heptanoat
7- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheneicosyl)-ammonio Δ -heptanoat
7- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydocosyl)-ammonio Δ -heptanoat
8- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydodecyl)-ammonio Δ -octanoat
10 8- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytridecyl)-ammonio Δ -octanoat
8- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytetradecyl)-ammonio Δ -octanoat
8- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxypentadecyl)-ammonio Δ -octanoat
8- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio Δ -octanoat
8- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheptadecyl)-ammonio Δ -octanoat
15 8- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio Δ -octanoat
8- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxynonadecyl)-ammonio Δ -octanoat
8- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyeicosyl)-ammonio Δ -octanoat
8- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheneicosyl)-ammonio Δ -octanoat
8- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydocosyl)-ammonio Δ -octanoat
20 9- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydodecyl)-ammonio Δ -nonanoat
9- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytridecyl)-ammonio Δ -nonanoat
9- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytetradecyl)-ammonio Δ -nonanoat
9- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxypentadecyl)-ammonio Δ -nonanoat
9- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio Δ -nonanoat
25 9- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheptadecyl)-ammonio Δ -nonanoat
9- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio Δ -nonanoat
9- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxynonadecyl)-ammonio Δ -nonanoat
9- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyeicosyl)-ammonio Δ -nonanoat
9- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheneicosyl)-ammonio Δ -nonanoat
9- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydocosyl)-ammonio Δ -nonanoat
30 10- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydodecyl)-ammonio Δ -decanoat
10- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytridecyl)-ammonio Δ -decanoat
10- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytetradecyl)-ammonio Δ -decanoat
10- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxypentadecyl)-ammonio Δ -decanoat
10- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio Δ -decanoat
35 10- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheptadecyl)-ammonio Δ -decanoat
10- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio Δ -decanoat
10- Δ N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxynonadecyl)-ammonio Δ -decanoat

- 1 10- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyeicosyl)-ammonio γ -decanoat
 10- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheneicosyl)-ammonio γ -decanoat
 10- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydocosyl)-ammonio γ -decanoat
 5 11- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydodecyl)-ammonio γ -undecanoat
 11- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytridecyl)-ammonio γ -undecanoat
 11- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytetradecyl)-ammonio γ -undecanoat
 11- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxypentadecyl)-ammonio γ -undecanoat
 10 11- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio γ -undecanoat
 11- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheptadecyl)-ammonio γ -undecanoat
 15 11- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio γ -undecanoat
 11- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxynonadecyl)-ammonio γ -undecanoat
 11- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyeicosyl)-ammonio γ -undecanoat
 20 11- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheneicosyl)-ammonio γ -undecanoat
 11- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydocosyl)-ammonio γ -undecanoat
 12- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydodecyl)-ammonio γ -dodecanoat
 12- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytridecyl)-ammonio γ -dodecanoat
 25 12- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxytetradecyl)-ammonio γ -dodecanoat
 12- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxypentadecyl)-ammonio γ -dodecanoat
 12- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio γ -dodecanoat
 30 12- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheptadecyl)-ammonio γ -dodecanoat
 12- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio γ -dodecanoat
 12- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxynonadecyl)-ammonio γ -dodecanoat
 35 12- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyeicosyl)-ammonio γ -dodecanoat
 12- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheneicosyl)-ammonio γ -dodecanoat

- 1 12- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxyheneicosyl)-ammonio γ -
dodecanoat
12- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxydocosyl)-ammonio γ -dodecanoat
- 5 Zu den erfindungsgemäßen Verbindungen gehören analog den
vorangenannten Verbindungen auch solche, in denen R² statt
Wasserstoff eine Methyl-, Ethyl-, Propyl- oder Butylgruppe
darstellt, z.B.:
- 10 N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyldodecyl)-ammonioacetat
N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyltridecyl)-ammonioacetat
N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyltetradecyl)-ammonio-
acetat
- 15 N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylpentadecyl)-ammonio-
acetat
N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylhexadecyl)-ammonioacetat
N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylheptadecyl)-ammonio-
acetat
- 20 N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyloctadecyl)-ammonioacetat
N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylnonadecyl)-ammonioacetat
N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyleicosyl)-ammonioacetat
N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylheneicosyl)-ammonio-
acetat
- 25 N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyldocosyl)-ammonioacetat
3- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyldodecyl)-ammonio γ -
propionat
3- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyltridecyl)-ammonio γ -
propionat
- 30 3- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyltetradecyl)-ammonio γ -
propionat
3- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylpentadecyl)-ammonio γ -
propionat
3- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylhexadecyl)-ammonio γ -
propionat
- 35 3- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylheptadecyl)-ammonio γ -
propionat
3- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyloctadecyl)-ammonio γ -
propionat

- 1 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylnonadecyl)-ammonio γ -
propionat
3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyleicosyl)-ammonio γ -
propionat
- 5 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylheneicosyl)-ammonio γ -
propionat
3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyldocosyl)-ammonio γ -
propionat
4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyldodecyl)-ammonio γ -
butyrat
- 10 4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyltridecyl)-ammonio γ -
butyrat
4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyltetradecyl)-ammonio γ -
butyrat
4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylpentadecyl)-ammonio γ -
butyrat
- 15 4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylhexadecyl)-ammonio γ -
butyrat
4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylheptadecyl)-ammonio γ -
butyrat
- 20 4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyloctadecyl)-ammonio γ -
butyrat
4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylnonadecyl)-ammonio γ -
butyrat
4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyleicosyl)-ammonio γ -
butyrat
- 25 4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylheneicosyl)-ammonio γ -
butyrat
4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyldocosyl)-ammonio γ -
butyrat
5- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylhexadecyl)-ammonio γ -
pentanoat
- 30 5- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyloctadecyl)-ammonio γ -
pentanoat
5- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyleicosyl)-ammonio γ -
pentanoat
- 35 6- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylhexadecyl)-ammonio γ -
hexanoat
6- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyloctadecyl)-ammonio γ -
hexanoat

- 1 6- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyleicosyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
hexanoat
- 7- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
heptanoat
- 5 7- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyloctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
heptanoat
- 7- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyleicosyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
heptanoat
- 10 8- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
octanoat
- 8- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyloctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
octanoat
- 8- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyleicosyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
octanoat
- 15 9- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
nonanoat
- 9- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyloctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
nonanoat
- 20 9- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyleicosyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
nonanoat
- 10- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
decanoat
- 10- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyloctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
decanoat
- 25 10- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyleicosyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
decanoat
- 11- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
undecanoat
- 30 11- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyloctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
undecanoat
- 11- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyleicosyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
undecanoat
- 12- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methylhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -
dodecanoat
- 35

- 1 12- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyloctadecyl)-ammonio γ -
dodecanoat
- 12- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-methyleicosyl)-ammonio γ -
dodecanoat
- 5 N,N-Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyhexadecyl)-ammonioacetat
N,N-Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyoctadecyl)-ammonioacetat
N,N-Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyeicosyl)-ammonioacetat
3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyhexadecyl)-ammonio γ -
propionat
- 10 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyoctadecyl)-ammonio γ -
propionat
3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyeicosyl)-ammonio γ -
propionat
- 15 4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyhexadecyl)-ammonio γ -
butyrat
4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyoctadecyl)-ammonio γ -
butyrat
4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyeicosyl)-ammonio γ -
butyrat
- 20 5- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyhexadecyl)-ammonio γ -
pentanoat
5- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyoctadecyl)-ammonio γ -
pentanoat
5- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyeicosyl)-ammonio γ -
- 25 pentanoat
6- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyhexadecyl)-ammonio γ -
hexanoat
6- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyoctadecyl)-ammonio γ -
hexanoat
- 30 6- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethyl-2-hydroxyeicosyl)-ammonio γ -
hexanoat
N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-propylhexadecyl)-ammonioacetat
N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-propyloctadecyl)-ammonioacetat
N,N-Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-propyleicosyl)-ammonioacetat
- 35

- 1 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-propylhexadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -propionat
 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-propyloctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -propionat
- 5 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-propyleicosyl)-ammonio $\overline{7}$ -propionat
 4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-propylhexadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat
 4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-propyloctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat
- 10 4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxy-2-propyleicosyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat
 N,N-Dimethyl-N-(2-butyl-2-hydroxyoctadecyl)-ammonioacetat
 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-butyl-2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -propionat
- 15 4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-butyl-2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat
- Zu den erfindungsgemäßen Verbindungen gehören analog den vorangenannten Verbindungen auch solche, in denen die Reste R⁴ und R⁵ statt einer Methylgruppe Wasserstoff, eine Ethyl-, Propyl-, Butyl-, Phenyl- oder Benzylgruppe darstellen, wie z.B.
- 20 N-Ethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-N-methyl-ammonioacetat
 N-Benzyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-N-methyl-ammonioacetat
 N-(2-Hydroxyoctadecyl)-N-methyl-N-propyl-ammonioacetat
- 25 N-Butyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-N-methyl-ammonioacetat
 N-(2-Hydroxyoctadecyl)-N-methyl-ammonioacetat
 N-(2-Hydroxyoctadecyl)-N-phenyl-ammonioacetat
 N-(2-Hydroxyoctadecyl)-ammonioacetat
- 30 4- \sqrt{N} -Ethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-N-methyl-ammonio $\overline{7}$ -butyrat
 4- \sqrt{N} -Benzyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-N-methyl-ammonio $\overline{7}$ -butyrat
 4- \sqrt{N} -(2-Hydroxyoctadecyl)-N-methyl-N-propyl-ammonio $\overline{7}$ -butyrat
- 35 4- \sqrt{N} -Butyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-N-methyl-ammonio $\overline{7}$ -butyrat
 4- \sqrt{N} -(2-Hydroxyoctadecyl)-N-methyl-ammonio $\overline{7}$ -butyrat
 4- \sqrt{N} -(2-Hydroxyoctadecyl)-N-phenyl-ammonio $\overline{7}$ -butyrat
 4- \sqrt{N} -(2-Hydroxyoctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

- 1 Zu den erfindungsgemäßen Verbindungen gehören analog den vorangenannten Verbindungen auch solche, in denen die Reste R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander statt Wasserstoff
- 5 Methyl-, Ethyl-, Isopropyl-, Isobutyl-, sec-Butyl-, n-Butyl-, Benzyl-, substituierte Benzyl-, 2-Phenylethyl-, substituierte 2-Phenylethyl-, 3-Phenylpropyl-, substituierte 3-Phenylpropyl-, 4-Phenylbutyl-, substituierte 4-Phenylbutyl-, Phenyl-, substituierte Phenyl- oder
- 10 Methylthioethyl-Gruppen darstellen, wie z.B.
- 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -propionat
- 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -butyrat
- 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -3-methyl-
- butyrat
- 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -pentanoat
- 15 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -3-methyl-
- pentanoat
- 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -4-methyl-
- pentanoat
- 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -hexanoat
- 20 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -4-methyl-
- thio-butyrat
- 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -3-phenyl-
- propionat
- 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -3-(4-
- 25 hydroxyphenyl)-propionat
- 4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -2,2-dime-
- thyl-butyrat
- 6- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -2,2-dime-
- thyl-hexanoat
- 30 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -propionat
- 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -butyrat
- 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -3-methyl-
- butyrat
- 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -pentanoat
- 35 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -3-methyl-
- pentanoat

- 1 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -4-methyl-
pentanoat
2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -hexanoat
5 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -4-methyl-
thio-butyrat
2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -3-phenyl-
propionat
2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -3-(4-hy-
droxyphenyl)-propionat
10 4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -2,2-dime-
thyl-butyrat
6- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -2,2-dime-
thyl-hexanoat
15 2- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -2-phenyl-
propionat

Zu den erfindungsgemäßen Verbindungen gehören analog den
vorangenannten Verbindungen auch solche, in denen R^3 statt
20 Wasserstoff z.B. eine Alkyl-, Alkenyl-, Aalkyl-, Acyl-,
Alkoxy-carbonyl-, Alkenoxy-carbonyl-, Aryloxy-carbonyl-,
Arylalkoxy-carbonyl-, Alkylcarbamoyl-, Alkenylcarbamoyl-,
Arylcarbamoyl-, Arylalkylcarbamoyl-, Alkylthiocarbamoyl-,
Alkenylthiocarbamoyl-, Arylthiocarbamoyl-, Arylalkylthio-
25 carbamoyl-, Alkylsulfonyl-, Alkenylsulfonyl-, Arylsulfo-
nyl- oder Arylalkylsulfonyl-Gruppe darstellt, wie z.B.

- N,N -Dimethyl-N-(2-methoxyhexadecyl)-ammonioacetat
4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-methoxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -butyrat
30 N,N -Dimethyl-N-(2-methoxyoctadecyl)-ammonioacetat
4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-methoxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -butyrat
 N,N -Dimethyl-N-(2-methoxyeicosyl)-ammonioacetat
4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-methoxyeicosyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -butyrat
 N,N -Dimethyl-N-(2-ethoxyhexadecyl)-ammonioacetat
4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethoxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{7}$ -butyrat
35 N,N -Dimethyl-N-(2-ethoxyoctadecyl)-ammonioacetat

- 1 4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethoxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{}$ -butyrat
 N,N-Dimethyl-N-(2-ethoxyeicosyl)-ammonioacetat
 4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethoxyeicosyl)-ammonio $\sqrt{}$ -butyrat
 N-(2-Allyloxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammonioacetat
- 5 4- \sqrt{N} -(2-Allyloxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -butyrat
 N-(2-Hexadecyloxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammonioacetat
 4- \sqrt{N} -(2-Hexadecyloxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -
 butyrat
 N-(2-Benzyloxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammonioacetat
- 10 4- \sqrt{N} -(2-Benzyloxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -butyrat
 N-(2-Acetoxyhexadecyl)-N,N-dimethyl-ammonioacetat
 3- \sqrt{N} -(2-Acetoxyhexadecyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -propionat
 4- \sqrt{N} -(2-Acetoxyhexadecyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -butyrat
 5- \sqrt{N} -(2-Acetoxyhexadecyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -pentanoat
- 15 6- \sqrt{N} -(2-Acetoxyhexadecyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -hexanoat
 N-(2-Acetoxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammonioacetat
 3- \sqrt{N} -(2-Acetoxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -propionat
 4- \sqrt{N} -(2-Acetoxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -butyrat
 5- \sqrt{N} -(2-Acetoxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -pentanoat
- 20 6- \sqrt{N} -(2-Acetoxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -hexanoat
 N-(2-Acetoxyeicosyl)-N,N-dimethyl-ammonioacetat
 3- \sqrt{N} -(2-Acetoxyeicosyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -propionat
 4- \sqrt{N} -(2-Acetoxyeicosyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -butyrat
 5- \sqrt{N} -(2-Acetoxyeicosyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -pentanoat
- 25 6- \sqrt{N} -(2-Acetoxyeicosyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\sqrt{}$ -hexanoat
 N,N-Dimethyl-N-(2-propionyloxyhexadecyl)-ammonioacetat
 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-propionyloxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{}$ -pro-
 pionat
 4- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-propionyloxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{}$ -
- 30 butyrat
 5- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-propionyloxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{}$ -pen-
 tanoat
 6- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-propionyloxyhexadecyl)-ammonio $\sqrt{}$ -hexa-
 noat
- 35 N,N-Dimethyl-N-(2-propionyloxyoctadecyl)-ammonioacetat
 3- $\sqrt{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-propionyloxyoctadecyl)-ammonio $\sqrt{}$ -
 propionat

- 1 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-propionyloxyoctadecyl)-ammonio γ -butyrat
 5- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-propionyloxyoctadecyl)-ammonio γ -pentanoat
- 5 6- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-propionyloxyoctadecyl)-ammonio γ -hexanoat
 N,N-Dimethyl-N-(2-propionyloxyeicosyl)-ammonioacetat
 3- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-propionyloxyeicosyl)-ammonio γ -propionat
- 10 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-propionyloxyeicosyl)-ammonio γ -butyrat
 5- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-propionyloxyeicosyl)-ammonio γ -pentanoat
 6- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-propionyloxyeicosyl)-ammonio γ -hexanoat
- 15 N,N-Dimethyl-N-(2-palmitoyloxyhexadecyl)-ammonioacetat
 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-palmitoyloxyhexadecyl)-ammonio γ -butyrat
 N,N-Dimethyl-N-(2-palmitoyloxyoctadecyl)-ammonioacetat
 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-palmitoyloxyoctadecyl)-ammonio γ -butyrat
- 20 N,N-Dimethyl-N-(2-palmitoyloxyeicosyl)-ammonioacetat
 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-palmitoyloxyeicosyl)-ammonio γ -butyrat
 N,N-Dimethyl-N-(2-stearoyloxyhexadecyl)-ammonioacetat
 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-stearoyloxyhexadecyl)-ammonio γ -butyrat
- 25 N,N-Dimethyl-N-(2-stearoyloxyoctadecyl)-ammonioacetat
 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-stearoyloxyoctadecyl)-ammonio γ -butyrat
 N,N-Dimethyl-N-(2-stearoyloxyeicosyl)-ammonioacetat
 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-stearoyloxyeicosyl)-ammonio γ -butyrat
- 30 N,N-Dimethyl-N-(2-oleoyloxyhexadecyl)-ammonioacetat
 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-oleoyloxyhexadecyl)-ammonio γ -butyrat
 N,N-Dimethyl-N-(2-oleoyloxyoctadecyl)-ammonioacetat
 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-oleoyloxyoctadecyl)-ammonio γ -butyrat
- 35 N,N-Dimethyl-N-(2-oleoyloxyeicosyl)-ammonioacetat
 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-oleoyloxyeicosyl)-ammonio γ -butyrat
 N,N-Dimethyl-N-(2-linolyloxyhexadecyl)-ammonioacetat

- 1 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-linoloyloxyhexadecyl)-ammonio γ -
butyrat
N,N-Dimethyl-N-(2-linoloyloxyoctadecyl)-ammonioacetat
- 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-linoloyloxyoctadecyl)-ammonio γ -
5 butyrat
N,N-Dimethyl-N-(2-linoloyloxyeicosyl)-ammonioacetat
4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-linoloyloxyeicosyl)-ammonio γ -butyrat
4- γ -N-(2-Benzoyloxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammonio γ -butyrat
4- γ -N-(2-Benzoyloxycarbonyloxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammo-
10 nio γ -butyrat
4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-methoxycarbonyloxyoctadecyl)-ammo-
nio γ -butyrat
4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-ethoxycarbonyloxyoctadecyl)-ammonio γ -
butyrat
- 15 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-oleoyloxycarbonyloxyoctadecyl)-ammo-
nio γ -butyrat
N,N-Dimethyl-N-(2-methylcarbamoyloxyhexadecyl)-ammonio-
acetat
4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-methylcarbamoyloxyhexadecyl)-ammo-
20 nio γ -butyrat
N,N-Dimethyl-N-(2-methylcarbamoyloxyoctadecyl)-ammonio-
acetat
4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-methylcarbamoyloxyoctadecyl)-ammo-
nio γ -butyrat
- 25 N,N-Dimethyl-N-(2-methylcarbamoyloxyeicosyl)-ammonioacetat
4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-methylcarbamoyloxyeicosyl)-ammonio γ -
butyrat
N,N-Dimethyl-N-(2-ethylcarbamoyloxyhexadecyl)-ammonio-
acetat
- 30 4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-ethylcarbamoyloxyhexadecyl)-ammonio γ -
butyrat
N,N-Dimethyl-N-(2-ethylcarbamoyloxyoctadecyl)-ammonio-
acetat
4- γ -N,N-Dimethyl-N-(2-ethylcarbamoyloxyoctadecyl)-ammonio γ -
35 butyrat
N,N-Dimethyl-N-(2-ethylcarbamoyloxyeicosyl)-ammonioacetat

1

4- $\overline{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethylcarbamoyloxyeicosyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

5

4- \overline{N} -(2-Allylcarbamoyloxyoctadecyl-N,N-dimethyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

4- $\overline{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-dimethylcarbamoyloxyoctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

4- \overline{N} -(2-Benzylcarbamoyloxyoctadecyl-N,N-dimethyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

10

4- $\overline{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hexadecylcarbamoyloxyoctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

4- $\overline{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-phenylcarbamoyloxyoctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

15

4- $\overline{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-methylthiocarbamoyloxyoctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

4- $\overline{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-ethylthiocarbamoyloxyoctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

4- $\overline{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-phenylthiocarbamoyloxyoctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

20

4- \overline{N} -(2-Benzylthiocarbamoyloxyoctadecyl-N,N-dimethyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

4- $\overline{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-methylsulfonyloxyoctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

25

4- $\overline{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-p-tolylsulfonyloxyoctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

4- \overline{N} -(2-Benzylsulfonyloxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

4- \overline{N} -(2-Allylsulfonyloxyoctadecyl)-N,N-dimethyl-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

30

35

1

Zu den erfindungsgemäßen Verbindungen gehören analog den vorangenannten Verbindungen der Formel I auch solche der Formel II, in der R⁸ ein Wasserstoffatom, einen Alkylrest mit 1-6 Kohlenstoffatomen, wie z.B. Methyl, Ethyl, Propyl, Isopropyl, Butyl, Pentyl, Hexyl und X⁻ ein Säureanion einer anorganischen oder organischen, ein- oder mehrbasischen Säure darstellt, wie z.B. Chlorid, Sulfat, Phosphat, Acetat, Succinat, Lactat, Maleat, Malonat, Citrat, Fumarat. Beispiele für Verbindungen der Formel II sind:

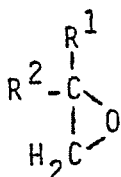
10 N,N-Dimethyl-N-3-ethoxycarbonylpropyl-N-2-methylcarbamoyloxyoctadecyl-ammoniumchlorid

Bis-(N,N-dimethyl-N-5-isopropoxycarbonylpentyl-N-2-methoxyeicosyl-ammonium)-sulfat

15 N-Ethoxycarbonylmethyl-N-methyl-N-2-methoxyoctadecyl-ammoniumfumarat.

Verbindungen der Formel II werden hergestellt, indem man Epoxide der allgemeinen Formel III,

20



III

25

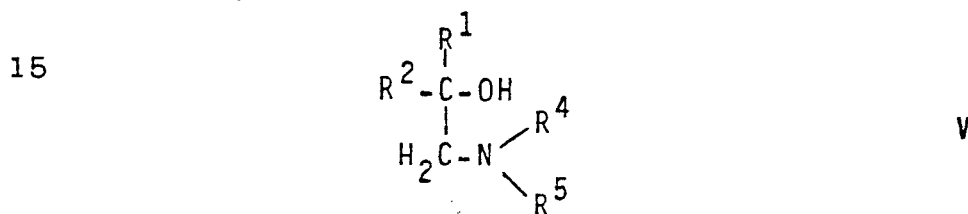
30

35

1 in der R^1 und R^2 die in den Formeln I und II angegebenen
Bedeutungen haben, mit Amininen der Formel IV,



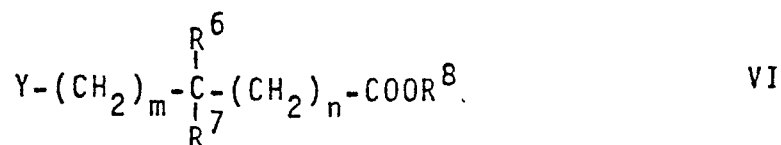
10 in der R^4 und R^5 die in den Formeln I und II angegebenen
Bedeutungen besitzen, in organischen oder organisch-wäss-
rigen Lösungsmittelsystemen, bevorzugt Methanol, Ethanol,
gegebenenfalls unter Druck, zu den β -Aminoalkoholen der
Formel V,



20

in der R^1 , R^2 , R^4 , R^5 die in den Formeln I und II angege-
benen Bedeutungen haben, umgesetzt und diese mit einem Alky-
lierungsmittel der Formel VI,

25



30

in der R^6 , R^7 , R^8 , m und n die in den Formeln I und II
angegebenen Bedeutungen haben und Y ein Chlor-, Brom-,
Jodatome oder eine ähnliche Abgangsgruppe darstellt, in
einem indifferenten organischen Lösungsmittel, wie z.B.
35 Acetonitril, Aceton bei Raum- bis Rückflußtemperatur be-
handelt, wobei Verbindungen der Formel II mit $R^3 = H$
entstehen.

1 Als Ausgangssubstanzen der Formel III kommen in Frage:

1,2-Epoxydodecan, 1,2-Epoxytridecan, 1,2-Epoxytetradecan,
 1,2-Epoxy-pentadecan, 1,2-Epoxyhexadecan, 1,2-Epoxyhepta-
 5 decan, 1,2-Epoxyoctadecan, 1,2-Epoxy-nonadecan, 1,2-Epoxy-
 eicosan, 1,2-Epoxyheneicosan, 1,2-Epoxydocosan, 2-Methyl-
 1,2-epoxydodecan, 2-Methyl-1,2-epoxytridecan, 2-Methyl-
 1,2-epoxytetradecan, 2-Methyl-1,2-epoxy-pentadecan,
 2-Methyl-1,2-epoxyhexadecan, 2-Methyl-1,2-epoxyheptadecan,
 2-Methyl-1,2-epoxyoctadecan, 2-Methyl-1,2-epoxy-nonadecan,
 10 2-Methyl-1,2-epoxyeicosan, 2-Methyl-1,2-epoxyheneicosan,
 2-Methyl-1,2-epoxydocosan, 1,2-Epoxy-2-ethyl-dodecan,
 1,2-Epoxy-2-ethyl-tridecan, 1,2-Epoxy-2-ethyl-tetradecan,
 1,2-Epoxy-2-ethyl-pentadecan, 1,2-Epoxy-2-ethyl-hexadecan,
 1,2-Epoxy-2-ethyl-heptadecan, 1,2-Epoxy-2-ethyl-octadecan,
 15 1,2-Epoxy-2-ethyl-nonadecan, 1,2-Epoxy-2-ethyl-eicosan,
 1,2-Epoxy-2-ethyl-heneicosan, 1,2-Epoxy-2-ethyl-docosan,
 1,2-Epoxy-2-propyl-dodecan, 1,2-Epoxy-2-propyl-tridecan,
 1,2-Epoxy-2-propyl-tetradecan, 1,2-Epoxy-2-propyl-penta-
 20 heptadecan, 1,2-Epoxy-2-propyl-octadecan, 1,2-Epoxy-2-pro-
 pyl-nonadecan, 1,2-Epoxy-2-propyl-eicosan, 1,2-Epoxy-2-pro-
 pyl-heneicosan, 1,2-Epoxy-2-propyl-docosan, 2-Butyl-1,2-
 epoxydodecan, 2-Butyl-1,2-epoxytridecan, 2-Butyl-1,2-
 epoxytetradecan, 2-Butyl-1,2-epoxy-pentadecan, 2-Butyl-1,2-
 25 epoxyhexadecan, 2-Butyl-1,2-epoxyheptadecan, 2-Butyl-1,2-
 epoxyoctadecan, 2-Butyl-1,2-epoxy-nonadecan, 2-Butyl-1,2-
 epoxyeicosan, 2-Butyl-1,2-epoxyheneicosan, 2-Butyl-1,2-
 epoxydocosan.

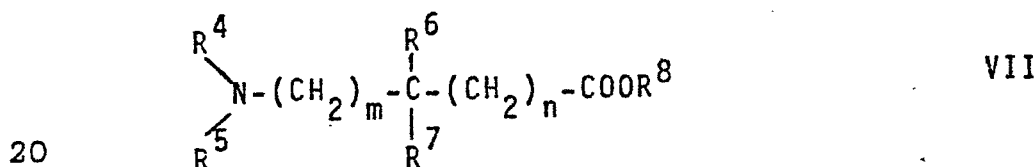
30 Als Ausgangssubstanzen der Formel IV kommen z.B. in Frage:
 Methylamin, Ethylamin, Propylamin, Isopropylamin, Butyl-
 amin, Anilin, Benzylamin, Dimethylamin, Diethylamin, Di-
 propylamin, Dibutylamin, N-Methyl-ethylamin, N-Methyl-pro-
 pylamin, N-Methyl-butylamin, N-Methylanilin, N-Methyl-
 35 benzylamin, N-Ethyl-propylamin, N-Ethyl-isopropylamin,
 N-Ethyl-butylamin, N-Ethylanilin, N-Ethyl-benzylamin,
 N-Isopropyl-propylamin, N-Propyl-butylamin, N-Propylanilin,

1 N-Propyl-benzylamin, N-Butylanilin, N-Butyl-benzylamin.

Als Alkylierungsmittel der Formel VI kommen z.B. die
 5 Methnyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, Pentyl-,
 Hexylester folgender Säuren in Frage:
 Chloressigsäure, Bromessigsäure, 2-Chlorpropionsäure,
 2-Brompropionsäure, 3-Chlorpropionsäure, 3-Brompropion-
 säure, 2-Chlorbuttersäure, 2-Brombuttersäure, 4-Chlor-
 10 buttersäure, 4-Brombuttersäure, 2-Chlorvaleriansäure,
 2-Bromvaleriansäure, 5-Chlorvaleriansäure, 5-Bromvalerian-
 säure, 2-Chlorcapronsäure, 2-Bromcapronsäure, 6-Chlor-
 capronsäure, 6-Bromcapronsäure, 7-Chlorönanthsäure,
 7-Bromönanthsäure, 8-Chlorcaprylsäure, 8-Bromcaprylsäure,
 9-Chlorpelargonsäure, 9-Brompelargonsäure, 10-Chlorcaprin-
 15 säure, 10-Bromcaprinsäure, 11-Chlorundecansäure, 11-Brom-
 undecansäure, 12-Chlordodecansäure, 12-Bromdodecansäure,
 2-Chlor-3-methylbuttersäure, 2-Brom-3-methylbuttersäure,
 2-Chlor-4-methylvaleriansäure, 2-Brom-4-methylvalerian-
 säure, 2-Chlor-3-methylvaleriansäure, 2-Brom-3-methyl-
 20 valeriansäure, 2-Chlor-2-phenyl-propionsäure, 2-Brom-2-
 phenyl-propionsäure, 2-Chlor-3-phenyl-propionsäure,
 2-Brom-3-phenyl-propionsäure, 2-Chlor-2-phenylessigsäure,
 2-Brom-2-phenylessigsäure, 2-Chlor-4-methylthio-butтер-
 säure, 2-Brom-4-methylthio-buttersäure, 3-Chlor-2-methyl-
 25 propionsäure, 3-Brom-2-methylpropionsäure, 4-Chlor-2-
 methylbuttersäure, 4-Brom-2-methylbuttersäure, 5-Chlor-2-
 methylvaleriansäure, 5-Brom-2-methylvaleriansäure,
 6-Chlor-2-methylcapronsäure, 6-Brom-2-methylcapronsäure,
 7-Chlor-2-methylönanthsäure, 7-Brom-2-methylönanthsäure,
 30 8-Chlor-2-methylcaprylsäure, 8-Brom-2-methylcaprylsäure,
 9-Chlor-2-methylpelargonsäure, 9-Brom-2-methylpelargon-
 säure, 10-Chlor-2-methylcaprinsäure, 10-Brom-2-methyl-
 caprinsäure, 11-Chlor-2-methylundecansäure, 11-Brom-2-
 methylundecansäure, 12-Chlor-2-methyldodecansäure,
 35 12-Brom-2-methyldodecansäure, 3-Chlor-2,2-dimethylpropion-
 säure, 3-Brom-2,2-dimethylpropionsäure, 4-Chlor-2,2-

1 dimethylbuttersäure, 4-Brom-2,2-dimethylbuttersäure,
 5-Chlor-2,2-dimethyl-valeriansäure, 5-Brom-2,2-dimethyl-
 valeriansäure, 6-Chlor-2,2-dimethylcapronsäure, 6-Brom-
 2,2-dimethylcapronsäure, 7-Chlor-2,2-dimethylönanthsäure,
 5 7-Brom-2,2-dimethylönanthsäure, 8-Chlor-2,2-dimethyl-
 caprylsäure, 8-Brom-2,2-dimethylcaprylsäure, 9-Chlor-2,2-
 dimethylpelargonsäure, 9-Brom-2,2-dimethylpelargonsäure,
 10-Chlor-2,2-dimethylcaprinsäure, 10-Brom-2,2-dimethyl-
 caprinsäure, 11-Chlor-2,2-dimethylundecansäure, 11-Brom-
 10 2,2-dimethylundecansäure, 12-Chlor-2,2-dimethyldodecan-
 säure, 12-Brom-2,2-dimethyldodecansäure.

Verbindungen der Formel II können auch hergestellt werden,
 indem man Epoxide der allgemeinen Formel III mit Aminocar-
 15 bonsäureestern der allgemeinen Formel VII,

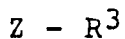


25 in der R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , m und n die in den Formeln I
 und II angegebenen Bedeutungen haben, in organischen oder
 organisch-wässrigen Lösungsmittelsystemen, bevorzugt
 Methanol oder Ethanol, gegebenenfalls unter Druck umgesetzt
 und nachfolgend mit einer Säure der Formel HX , deren Anion
 X^- die in Formel II angegebene Bedeutung hat, behandelt.
 30

Als Ausgangsverbindungen der Formel VII kommen z.B. die
 Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, Pentyl-,
 hexylester folgender Säuren in Frage:
 Aminoessigsäure, 2-Aminopropionsäure, 3-Aminopropionsäure,
 35 2-Aminobuttersäure, 4-Aminobuttersäure, 2-Aminovalerian-
 säure, 5-Aminovaleriansäure, 2-Aminocapronsäure,

1 6-Aminocaprinsäure, 2-Aminoönanthsäure, 7-Aminoönanth-
 säure, 2-Aminocaprylsäure, 8-Aminocaprylsäure, 2-Amino-
 pelargonsäure, 9-Aminopelargonsäure, 2-Aminocaprinsäure,
 5 10-Aminocaprinsäure, 2-Aminoundecansäure, 11-Aminoundecan-
 säure, 2-Aminododecansäure, 12-Aminododecansäure, Valin,
 Leucin, Isoleucin, Phenylalanin, Methionin, 2-Amino-2-
 phenylpropionsäure, 2-Amino-2-phenylelessigsäure, 3-Amino-
 2-methylpropionsäure, 4-Amino-2-methylbuttersäure, 5-Ami-
 10 no-2-methylvaleriansäure, 6-Amino-2-methylcapronsäure,
 7-Amino-2-methylönanthsäure, 8-Amino-2-methylcaprylsäure,
 9-Amino-2-methylpelargonsäure, 10-Amino-2-methylcaprin-
 säure, 11-Amino-2-methyl-undecansäure, 12-Amino-2-methyl-
 codecansäure, 3-Amino-2,2-dimethylpropionsäure, 4-Amino-
 2,2-dimethylbuttersäure, 5-Amino- 2,2-dimethylvalerian-
 15 säure, 6-Amino-2,2-dimethylcapronsäure, 7-Amino-2,2-di-
 methylönanthsäure, 8-Amino-2,2- dimethylcaprylsäure,
 9-Amino-2,2-dimethylpelargonsäure, 10-Amino-2,2-dimethyl-
 caprinsäure, 11-Amino-2,2-dimethylundecansäure, 12-Amino-
 2,2-dimethyldodecansäure sowie die N-Methyl-, N-Ethyl-,
 20 N-Propyl-, N-Isopropyl-, N-Butyl-, N-PHENYL- und N-Benzyl-
 Derivate der genannten Ester.

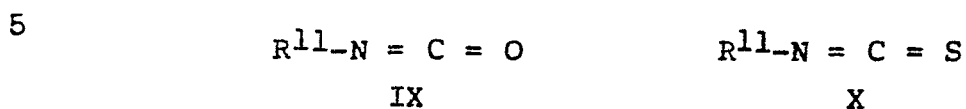
Verbindungen der Formel I und II mit R^3 ungleich Wasser-
 25 stoff werden hergestellt, indem man Verbindungen der For-
 mel I und II mit $R^3 =$ Wasserstoff und R^4, R^5 ungleich Was-
 serstoff mit Alkylierungsmitteln oder Acylierungsmitteln
 der Formel VIII,



VIII

30 worin R^3 die in den Formeln I und II angegebene Bedeutung
 hat (mit Ausnahme von Wasserstoff) und Z ein Halogenatom,
 Tosyloxy-, Acyloxy-Rest oder eine ähnliche Abgangsgruppe
 darstellt, in Substanz oder in einem indifferenten organi-
 schen Lösungsmittel, gegebenenfalls unter Druck und Anwen-
 35 dung einer Hilfsbase, die mit dem Acylierungsmittel oder
 Alkylierungsmittel und dem Rest R^8 compatibel ist, um-

1 setzt, wobei als Acylierungsmittel sinngemäß auch organisch Isocyanate oder Isothiocyanate der Formeln IX und X in Frage kommen,



in denen R^{11} die in den Formeln I und II angegebene Bedeutung hat.

10

Als Alkylierungsmittel der Formel VIII können z.B. eingesetzt werden:

Diazomethan, Dimethylsulfat, Chlormethan, Brommethan, Jodmethan, Chlorethan, Bromethan, Jodethan, Chlorpropan, Brompropan, Jodpropan, Allylchlorid, Allylbromid, Chlorbutan, Brombutan, Jodbutan, Chlorpentan, Brompentan, Jodpentan, Chlorhexan, Bromhexan, Jodhexan, 6-Brom-1-hexen, Chlorheptan, Bromheptan, Jodheptan, Chloroctan, Bromoctan, Jodoctan, p-Toluolsulfonsäureoctylester, Chlornonan, Bromnonan, Jodnonan, Chlordecan, Bromdecan, Joddodecan, p-Toluolsulfonsäuredecylester, Chlorundecan, Bromundecan, Jodundecan, Chlordodecan, Bromdodecan, Joddodecan, p-Toluolsulfonsäuredodecylester, Chlortridecan, Bromtridecan, Jodtridecan, Chlortetradecan, Bromtetradecan, Jodtetradecan, p-Toluolsulfonsäuretetradecylester, Chlorpentadecan, Brompentadecan, Jodpentadecan, Chlorhexadecan, Bromhexadecan, Jodhexadecan, p-Toluolsulfonsäurehexadecylester, Methansulfonsäurehexadecylester, Chlorheptadecan, Bromheptadecan, Jodheptadecan, Chloroctadecan, Bromoctadecan, Jodoctadecan, p-Toluolsulfonsäureoctadecylester, 1-Chlor-9-octadecen, 1-Brom-9-octadecen, 1-Jod-9-octadecen, Chlornonadecan, Bromnonadecan, Jodnonadecan, Chloreicosan, Bromeicosan, Jodeicosan, p-Toluolsulfonsäureeicosylester, Benzylchlorid, Benzylbromid, 3-Chlorpropylbenzol, 3-Brompropylbenzol, 3-Jodpropylbenzol, 4-Chlorbutylbenzol, 4-Brombutylbenzol, 4-Jodbutylbenzol, p-Toluolsulfonsäure-

- 1 4-phenylbutylester, wobei Chlor- und Bromverbindungen zweckmäßigerweise in Gegenwart von Alkalijodiden, insbesondere Natriumjodid, angewendet werden.
- 5 Als Acylierung der Formel VIII kommen z.B. die folgenden Säurechloride und -anhydride in Frage:
- Essigsäurechlorid, -anhydrid, Propionsäurechlorid, -anhydrid, Buttersäurechlorid, -anhydrid, Valeriansäurechlorid, -anhydrid, Isovaleriansäurechlorid, -anhydrid, Capron-
- 10 säurechlorid, -anhydrid, Önanthsäurechlorid, -anhydrid, Caprylsäurechlorid, -anhydrid, Pelargonsäurechlorid, -anhydrid, Caprinsäurechlorid, -anhydrid, Undecansäurechlorid, -anhydrid, Dodecansäurechlorid, -anhydrid, Tri-
- 15 decansäurechlorid, -anhydrid, Tetradecansäurechlorid, -anhydrid, Pentadecansäurechlorid, -anhydrid, Hexadecansäurechlorid, -anhydrid, Heptadecansäurechlorid, -anhydrid, Octadecansäurechlorid, -anhydrid, Ölsäurechlorid, -anhydrid, Linolsäurechlorid, -anhydrid, Nonadecansäure-
- 20 chlorid, -anhydrid, Eicosansäurechlorid, -anhydrid, Benzoesäurechlorid, 4-Chlor-benzoesäurechlorid, 3,4-Dimethoxybenzoesäurechlorid, Phenylessigsäurechlorid, 3-Phenylpropionsäurechlorid, 4-Phenylbuttersäurechlorid, Chlorameisensäuremethylester, Chlorameisensäureethylester, Chlorameisensäurepropylester, Chlorameisensäureisopropyl-
- 25 ester, Chlorameisensäureallylester, Chlorameisensäurebutylester, Chlorameisensäurepentylester, Chlorameisensäurehexylester, Chlorameisensäureheptylester, Chlorameisensäureoctylester, Chlorameisensäurenonylester, Chlorameisensäuredecylester, Chlorameisensäureundecylester,
- 30 Chlorameisensäuredodecylester, Chlorameisensäuretridecylester, Chlorameisensäuretetradeccylester, Chlorameisensäurepentadecylester, Chlorameisensäurehexadecylester, Chlorameisensäureheptadecylester, Chlorameisensäureoctadecylester, Chlorameisensäureoleylester, Chlorameisensäure-
- 35 linolylester, Chlorameisensäurenadecylester, Chlorameisensäureeicosylester, Chlorameisensäurebenzylester,

1 Methansulfonsäurechlorid, Ethansulfonsäurechlorid, Propan-
 sulfonsäurechlorid, Allylsulfonsäurechlorid, Butansulfon-
 säurechlorid, p-Toluolsulfonsäurechlorid, Phenylmethansul-
 fonsäurechlorid, Dimethylcarbamidsäurechlorid, Ethyl-
 5 methylcarbamidsäurechlorid, Diethylcarbamidsäurechlorid.

Als Acylierungsmittel der Formeln IX und X kommen z.B. in
 Frage:

10 Methylisocyanat, Methylisothiocyanat, Ethylisocyanat,
 Ethylisothiocyanat, Propylisocyanat, Propylisothiocyanat,
 Allylisocyanat, Allylisothiocyanat, Butylisocyanat,
 Pentylisocyanat, Hexylisocyanat, Heptylisocyanat, Octyl-
 isocyanat, Nonylisocyanat, Decylisocyanat, Undecylisocya-
 15 nat, Dodecylisocyanat, Tridecylisocyanat, Tetradecyliso-
 cyanat, Pentadecylisocyanat, Hexadecylisocyanat, Hepta-
 decylisocyanat, Octadecylisocyanat, Oleylisocyanat, Lino-
 lylisocyanat, Nonadecylisocyanat, Eicosylisocyanat, Phe-
 nylisocyanat, 4-Chlorphenylisocyanat, Phenylisothiocyanat,
 Benzylisocyanat.

20

Verbindungen der Formel I werden hergestellt, indem man
 Verbindungen der Formel II mit $R^8 = \text{Alkyl}$ nach den übli-
 chen Verfahren, z.B. durch Reaktion mit Natrium- oder
 Kaliumhydroxid in wässrigen, wässrig-organischen oder
 25 organischen Reaktionsmedien, in die entsprechenden Alkali-
 salze der Formel II ($R^8 = \text{Alkali}$) und durch nachfolgenden
 Zusatz einer Mineralsäure in die Betaine der Formel I
 überführt, wobei für den Fall, daß R^3 ein alkalihydroxid-
 stabiler Rest ist, R^3 in den Formeln I und II identisch
 30 ist, während für den Fall, daß R^3 eine verseifbare Gruppe
 enthält, R^3 in Formel I ein Wasserstoffatom darstellt.

35

1 Verbindungen der Formel II können auch hergestellt werden,
 indem man Verbindungen der Formel V (mit R⁴, R⁵ ungleich
 wasserstoff) mit Acylierungsmitteln der Formel VIII in
 Substanz oder in einem indifferenten organischen Lösungs-
 5 mittel, gegebenenfalls unter Anwendung einer Hilfsbase,
 reagieren läßt, wobei als Acylierungsmittel sinngemäß auch
 organische Isocyanate oder Isothiocyanate der Formeln IX
 und X in Frage kommen, und die entstandenen Verbindungen
 der Formel XI,

10



15

worin R¹, R², R³, R⁴, R⁵ die in der Formel II angegebenen
 Bedeutungen haben, mit einem Alkylierungsmittel der Formel
 VI in einem indifferenten organischen Lösungsmittel behan-
 delt.

20

Die vorliegende Erfindung betrifft ebenfalls pharmazeuti-
 sche Präparate, welche die N-(2-Hydroxyalkyl)-aminosäuren
 und ihre Derivate der allgemeinen Formel I und II enthal-
 ten.

25

Bei den erfindungsgemäßen pharmazeutischen Präparaten han-
 delt es sich um solche zur enteralen wie oralen oder rek-
 talen sowie parenteralen Verabreichung, welche die pharma-
 zeutischen Wirkstoffe allein oder zusammen mit einem übli-
 30 chen, pharmazeutisch anwendbaren Trägermaterial enthalten.
 Vorteilhafterweise liegt die pharmazeutische Zubereitung
 des Wirkstoffes in Form von Einzeldosen vor, die auf die
 gewünschte Verabreichung abgestimmt sind, wie z.B. Tablet-
 ten, Dragées, Kapseln, Suppositorien, Granulate, Lösungen,
 35 Emulsionen oder Suspensionen. Die Dosierung der Verbindun-
 gen liegt üblicherweise zwischen 1 - 1000 mg pro Tag,

1 vorzugsweise zwischen 10 und 500 mg und kann ein- oder
mehrmals, bevorzugt zwei- bis dreimal täglich, verabreicht
werden.

5 Die Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen wird
durch die folgenden Beispiele näher erläutert. Die angege-
benen Schmelzpunkte wurden mit einem Büchi-Schmelzpunkt-
bestimmungsapparat gemessen und sind nicht korrigiert. Die
IR-Spektren wurden mit dem Gerät Nicolet NIC-3600 aufge-
10 nommen.

15

20

25

30

35

Die erfindungsgemäßen Verbindungen zeigen *in vitro* an der Hemmung der Koloniebildung von Zellen der Mäuse-Leukämie L 1210 eine gute proliferationshemmende und zytotoxische Antitumor-Wirksamkeit.

5

Beispielsweise wird bei obengenannter Versuchsmethode bei einer Konzentration von weniger als 1 µg/ml das Auswachsen von Leukämie-zell-Kolonien um mehr als 90 % inhibiert.

10

Diese antiproliferative, tumorzellwachstumhemmende Wirkung ist mit der Wirkung des bekannten Arzneimittels cis-Platin vergleichbar.

15

Die niedrigste, bereits proliferationshemmende Konzentration im Versuch ist beispielsweise 1 ng/ml.

20

Als allgemeiner Konzentrationsbereich für die proliferationshemmende Wirkung (Versuch wie oben) kommt beispielsweise infrage: 1ng/ml bis 10 µg/ml.

Indikationen, für die die erfindungsgemäßen Verbindungen in Betracht kommen können: Neoplasien, maligne Erkrankungen.

25

Kontraindikationen: Unbekannt, evtl. Schwangerschaft.

Die pharmazeutischen Zubereitungen enthalten im allgemeinen zwischen 25 bis 4000 mg, vorzugsweise 100 bis 1000 mg der erfindungsgemäßen aktiven Komponente(n).

30

Die Verabreichung kann beispielsweise in Form von Kapseln, Zäpfchen, Salben, Gelees, Cremes oder in flüssiger Form erfolgen. Als flüssige Anwendungsformen kommen zum Beispiel in Frage: ölige oder alkoholische beziehungsweise wässrige Lösungen sowie Suspensionen und Emulsionen beziehungsweise Lyophilisate. Bevorzugte Anwendungsformen sind Kapseln, die zwischen 100 und 500 mg oder Lösungen, die zwischen 1 bis

35

20 % an aktiver Substanz enthalten.

Die Einzeldosis der erfindungsgemäßen aktiven Komponenten kann beispielsweise liegen

- 5 a) bei oralen Arzneiformen zwischen 0,5 bis 500 mg/kg, vorzugsweise zwischen 5 bis 100 mg/kg,
- b) bei parenteralen Arzneiformen (zum Beispiel intravenös, intramuskulär) zwischen 0,1 bis 20 mg/kg, vorzugsweise 1 bis 10 mg/kg,
- 10 c) bei Arzneiformen zur lokalen Applikation auf die Haut und Schleimhäute (zum Beispiel in Form von Lösungen, Lotionen, Emulsionen, Salben und so weiter) zwischen 1 und 1000 mg/g, vorzugsweise zwischen 20 und 200 mg/g.

15 Beispielsweise können 3 mal täglich 1 bis 3 Kapseln mit einem Gehalt von 50 bis 250 mg wirksamer Substanz oder zum Beispiel bei intravenöser Injektion 1 bis 4 mal täglich eine Ampulle von 10 bis 100 ml Inhalt mit 200 bis 1000 mg Substanz empfohlen werden. Bei oraler Verabreichung ist die minimale tägliche Dosis beispielsweise 250 mg; die maximale tägliche Dosis bei oraler Verabreichung soll nicht über 4 g liegen.

20

Die akute Toxizität der erfindungsgemäßen Verbindungen an der Maus (ausgedrückt durch die LD 50 mg/kg; Methode nach Miller und Tainter: Proc. Soc. Exper. Biol. a. Med. 57 (1944) 261) liegt beispielsweise bei oraler Applikation oberhalb 1000 mg/kg, bei 4maliger oraler Applikation an aufeinanderfolgenden Tagen oberhalb einer Gesamtdosis von 2150 mg/kg.

25

30 Bei intraperitonealer Verabfolgung an der Maus liegt die akute Toxizität, ausgedrückt durch die LD 50, zwischen 50 und 150 mg/kg.

Die Arzneimittel können in der Humanmedizin, der Veterinärmedizin sowie in der Landwirtschaft allein oder im Gemisch mit anderen pharmakologisch aktiven Stoffen verwendet werden.

35

1

5

10

Beispiel 1

N-2-Acetyloxyoctadecyl-N,N-dimethyl-3-ethoxycarbonyl-propylammoniumbromid

15

a) 1-Dimethylamino-octadecan-2-ol

41 g 1,2-Epoxyoctadecan werden in 150 ml Tetrahydrofuran gelöst, 38 ml einer 40 %igen Lösung von Dimethylamin in Wasser hinzugefügt und die Mischung 2 Stunden bei 60°C im geschlossenen Gefäß gerührt. Die Reaktionslösung wird im Vakuum eingeengt und der Rückstand durch Säulenchromatographie (Kieselgel//Chloroform/Methanol/Wasser) gereinigt.

20

Ausbeute: 39,1 g

IR (in KBr): 3450, 1470 cm^{-1}

25

b) 2-Acetyloxy-1-(N,N-dimethylamino)-octadecan

39 g 1-Dimethylamino-octadecan-2-ol und 27 ml Triethylamin werden in 200 ml absolutem Chloroform gelöst und 13,2 ml Acetylchlorid bei 20°C eingetropft. Die Mischung wird 1 Stunde gerührt, mehrfach mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum eingedampft. Der Rückstand wird durch Säulenchromatographie (Kieselgel//Chloroform/Methanol) gereinigt.

30

Ausbeute: 39,5 g mit Schmp. 35-36°C

35

IR (in KBr): 1740 cm^{-1}

- 1 c) N-2-Acetyloxyoctadecyl-N,N-dimethyl-N-3-ethoxycarbonyl-
propylammoniumbromid
31,5 g 2-Acetyloxy-1-(N,N-dimethylamino)-octadecan und
5 17,2 g 4-Brombuttersäureethylester werden in 200 ml
Dimethylformamid gelöst und die Mischung 8 Stunden bei
100°C gerührt. Das Lösungsmittel wird im Vakuum abge-
dampft und der Rückstand durch Säulenchromatographie
(Kieselgel//Chloroform/Methanol) gereinigt.
Ausbeute: 38 g mit Schmp. 55-61°C
10 IR (in KBr): 1736 cm⁻¹
Das entsprechende N-2-Acetyloxyoctadecyl-N,N-dimethyl-
N-3-ethoxycarbonylpropylammoniumchlorid wird analog aus
2-Acetyloxy-1-(N,N-dimethylamino)-octadecan und
15 4-Chlorbuttersäureethylester hergestellt.

Beispiel 2

- 4-(N,N-Dimethyl-N-2-hydroxyoctadecylammonio)-butyrat
- 20 33 g N-2-Acetyloxyoctadecyl-N,N-dimethyl-N-3-ethoxycarbo-
nyl-propylammoniumbromid werden in 100 ml Ethanol aufge-
nommen und eine Lösung von 9,6 g Natriumhydroxid in 150 ml
Ethanol/Wasser = 2/1 (V/V) zugetropft. Die Mischung wird
24 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, mit 25 %iger Salz-
25 säure auf ca. pH 8 eingestellt, im Vakuum zur Trockne ein-
geengt und der Rückstand mit Chloroform extrahiert. Die
Chloroformlösung wird über Magnesiumsulfat getrocknet und
eingengt. Der Rückstand wird mit Aceton aufgekocht, abge-
kühlt, abgesaugt und getrocknet.
30 Ausbeute: 21,2 g mit Schmp. 195-198°C
IR (in KBr): 3370, 1578 cm⁻¹

1

Beispiel 3

5

N-2-Acetyloxyoctadecyl-N,N-dimethyl-N-3-hydroxycarbonyl-propylammoniumchlorid

10

2 g 4-(N,N-Dimethyl-N-2-hydroxyoctadecylammonio)-butyrat werden in 10 ml Chloroform gelöst und 1 g Essigsäureanhydrid hinzugefügt. Die Mischung wird 48 Stunden bei 40°C gerührt, überschüssiges Acetanhydrid durch Zugabe von Wasser und wenig verd. Salzsäure hydrolysiert, die Lösungsmittel im Vakuum eingedampft und der Rückstand durch Säulenchromatographie (Kieselgel//Chloroform/Methanol/Wasser) gereinigt.

15

Ausbeute: 1,6 g mit Schmp. 184-186°C
IR (in KBr): 1741, 1720 cm⁻¹ (Schulter)

Beispiel 4

20

4-(N,N-Dimethyl-N-2-oleoyloxyoctadecylammonio)-butyrat

25

2 g 4-(N,N-Dimethyl-N-2-hydroxyoctadecylammonio)-butyrat werden in 20 ml Chloroform gelöst und nacheinander 1 g Triethylamin und 3 g Ölsäurechlorid hinzugefügt. Die Mischung wird 48 Stunden bei 40°C gerührt, mit gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, im Vakuum zur Trockne eingeeengt und der Rückstand durch Säulenchromatographie (Kieselgel//Chloroform/Methanol) gereinigt.

30

Ausbeute: 0,3 g mit Schmp. 102-104°C
IR (in KBr): 1731, 1584 cm⁻¹

35

1 Beispiel 5

4-(N,N-Dimethyl-N-2-stearoyloxyoctadecylammonio)-butyrat.

Analog Beispiel 4 aus:

- 5 2 g 4-(N,N-Dimethyl-N-2-hydroxyoctadecylammonio)-butyrat
in 20 ml Chloroform,
1 g Triethylamin,
3 g Stearoylchlorid

10 Ausbeute: 0,4 g mit Schmp. 110-113°C
IR (in KBr): 1730, 1585 cm⁻¹

Beispiel 6

15 N,N-Dimethyl-N-3-hydroxycarbonylpropyl-N-2-methylcarba-
moyloxyoctadecylammoniumchlorid

- 2 g 4-(N,N-Dimethyl-N-2-hydroxyoctadecylammonio)-butyrat
werden in 10 ml Chloroform gelöst und 1 ml Dimethylform-
amid sowie 0,57 g Methylisocyanat hinzugefügt. Die
20 Mischung wird 48 Stunden bei 40°C gerührt, wenig verd.
Salzsäure zugetropft, die Lösungsmittel im Vakuum einge-
dampft und der Rückstand durch Säulenchromatographie (Kie-
selgel//Chloroform/Methanol/Wasser) gereinigt.

Ausbeute: 0,9 g mit Schmp. 170-172°C
25 IR (in KBr): 1719, 1684 cm⁻¹

30

35

Beispiel 7

4- \overline{N} -(2-Hydroxyoctadecyl)-N-methyl-ammonio \overline{J} -butyrat

a) 1-Methylamino-octadecan-2-ol

67 g 1,2-Epoxyoctadecan werden in 250 ml 33 %iger ethanolischer Methylaminlösung gelöst und die Lösung 6 Stunden bei 60°C im geschlossenen Gefäß gerührt. Die Reaktionslösung wird im Vakuum eingeengt und der Rückstand aus Ether/Hexan umkristallisiert.

Ausbeute: 45,9 g mit Schmp. 84-86°C

b) N-(2-Hydroxyoctadecyl)-N-(3-ethoxycarbonylpropyl)-N-methylammoniumbromid

25 g 1-Methylamino-octadecan-2-ol und 16,2 g 4-Brombuttersäureethylester werden in 160 ml Dimethylformamid gelöst und die Mischung 5 Stunden bei 60°C gerührt. Das Lösungsmittel wird im Vakuum abgedampft und der Rückstand durch Säulenchromatographie (Kieselgel//Chloroform/Methanol) gereinigt.

Ausbeute: 22,9 g

c) 4- \overline{N} -(2-Hydroxyoctadecyl)-N-methyl-ammonio \overline{J} -butyrat

22,5 g N-(2-Hydroxyoctadecyl)-N-(3-ethoxycarbonylpropyl)-N-methyl-ammoniumbromid werden in 100 ml Ethanol aufgenommen und eine Lösung von 4,3 g Natriumhydroxid in 150 ml Ethanol/Wasser = 2/1 (V/V) zugetropft. Die Mischung wird 24 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, mit 25 %iger Salzsäure auf pH 8,5-9,0 eingestellt, im Vakuum zur Trockne eingeengt und der Rückstand mit Ethanol extrahiert. Die ethanolische Lösung wird wiederum eingeengt und der Rückstand mit Chloroform extrahiert, die Chloroformlösung mit Magnesiumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel abgezogen. Der Rückstand wird mehrfach mit warmem Aceton gewaschen und getrocknet.

Ausbeute: 14,7 g mit Schmp. 92-95°C

IR (in KBr): 1588 cm⁻¹

1

Beispiel 8

N-(2-Acetyloxyoctadecyl)-N-(3-hydroxycarbonylpropyl)-N-methyl-ammoniumchlorid

5

1,4 g 4- \overline{N} -(2-Hydroxyoctadecyl)-N-methyl-ammonio $\overline{7}$ -butyrat, 1,3 g Ionenaustauscher (Permutit RSP-120, saure Form), 5 ml Eisessig und 5 ml Essigsäureanhydrid werden gemischt und die Mischung 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt.

10

Der Ionenaustauscher wird abfiltriert, das Filtrat mit 1 ml 25 %iger Salzsäure versetzt, zur Trockne eingeeengt und der Rückstand durch Säulenchromatographie (Kieselgel//Chloroform/Methanol) gereinigt.

Ausbeute: 0,9 g mit Schmp. 77-78°C

15

IR (in KBr): 1745, 1713 cm^{-1}

Beispiel 9

4- $\overline{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-methoxyoctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat

20

1,5 g 4- $\overline{N,N}$ -Dimethyl-N-(2-hydroxyoctadecyl)-ammonio $\overline{7}$ -butyrat werden in 30 ml trockenem Dimethylformamid gelöst und die Lösung nach Zugabe von 2,1 g gepulvertem Kaliumhydroxid und 1,1 g Methyljodid 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Das Lösungsmittel wird im Vakuum abgezogen,

25

der Rückstand mit Wasser aufgenommen und mit verd. Salzsäure auf pH 9-9,5 eingestellt. Die Lösung wird eingeeengt und der Rückstand mit Chloroform verrührt, die Chloroformlösung filtriert und das Filtrat erneut eingeeengt. Das zurückbleibende Rohprodukt wird durch Säulenchromatographie (Kieselgel//Chloroform/Methanol) gereinigt und lyophilisiert (Lösungsmittel: Wasser).

30

Ausbeute: 0,8 g mit Schmp. 132-134°C

35

1 Beispiel (Lyophilisat)

In 3 Liter Wasser für Injektionszwecke werden unter
Stickstoffbegasung 500 g Mannit und 100 g Verbindung
5 gemäß Beispiel 2 gelöst und mit Wasser für Injektions-
zwecke auf 4 Liter aufgefüllt. Diese milchige Dispersion
wird durch Ultraschall-Behandlung oder mit Hilfe eines
Spalthomogenisators in ein leicht opaleszierendes
kollöiddisperses System überführt.

10 Unter aseptischen Bedingungen wird nun über ein Membran-
filter von 0,22 µm Porenweite sterilfiltriert und zu
40 ml in 100 ml Injektionsflaschen unter Stickstoff-
begasung abgefüllt. Die Flaschen versieht man mit Ge-
friertrocknungsstopfen und lyophilisiert in einer ge-
15 eigneten Anlage. Nach der Trocknung wird mit sterilem,
getrocknetem Stickstoff begast und die Flaschen in der
Anlage verschlossen. Die Stopfen werden mit einer Bördel-
kappe gesichert.

Für die intravenöse Anwendung wird das Lyophilisat in
20 100 ml Wasser für Injektionszwecke rekonstituiert.
1 Flasche enthält 1 g Verbindung gemäß Beispiel 2.

Beispiel (Kapseln)

25 1,25 kg Verbindung gemäß Beispiel 3 werden in 5 kg
Chloroform gelöst und in dieser Lösung 1,25 kg Aerosil
suspendiert. Anschließend wird das Lösungsmittel im
Vakuum bei 30° C abgezogen.

30 Die trockene Masse wird durch ein 1 mm-Sieb gegeben und
noch einmal im Vakuum bei 30° C getrocknet, um letzte
Lösungsmittelrückstände zu entfernen.

Dieses Granulat wird in bekannter Weise auf einer ge-
eigneten Kapselmaschine in Gelatinehartkapseln der
35 Größe 00 zu 500 mg abgefüllt.

Eine Kapsel enthält 250 mg Verbindung gemäß Beispiel 3.

1

5

10 ASTA-Werke Aktiengesellschaft, Chemische Fabrik
 Artur-Ladebeck-Straße 128-152, 4800 Bielefeld 14

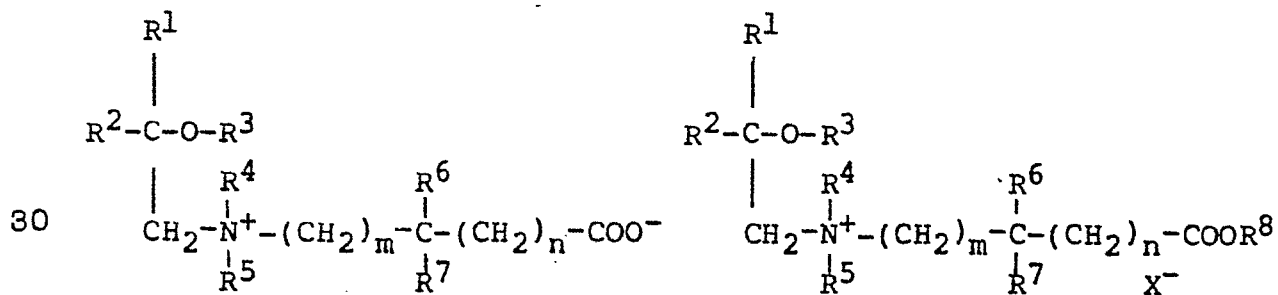
15 Titel: Neue N-(2-Hydroxyalkyl)-aminosäuren und
 ihre Derivate, Verfahren zu ihrer Her-
 stellung und diese enthaltende pharma-
 zeutische Präparate

20

Patentansprüche

1. N-(2-Hydroxyalkyl)-aminosäuren und ihre Derivate der
 allgemeinen Formeln I und II

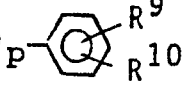
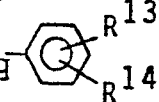
25

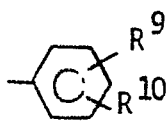


I

II

35

- 1 worin
 R^1 einen Alkylrest mit 10-20 Kohlenstoff-
 atomen,
 R^2 Wasserstoff oder einen Alkylrest mit
 5 R^3 1-4 Kohlenstoffatomen,
 R^3 Wasserstoff, einen gesättigten oder
 ungesättigten, geradkettigen oder ver-
 zweigten Alkylrest mit 1-20 Kohlen-
 10 stoffatomen, einen Aralkylrest der
 Formel $-(CH_2)_p$ -
 mit p gleich 1-4, $-CO-R^{11}$, $-COOR^{11}$,
 R^4, R^5 $-CO-NR^{11}R^{12}$, $-CS-NH-R^{11}$, $-O_2S-R^{11}$,
 gleich oder voneinander verschieden
 15 sind und Wasserstoff, einen Alkylrest
 mit 1-4 Kohlenstoffatomen, Phenyl oder
 Benzyl,
 R^6, R^7 gleich oder voneinander verschieden
 sind und Wasserstoff, einen linearen
 20 oder verzweigten Alkylrest mit 1-4
 Kohlenstoffatomen, einen Aralkylrest
 der Formel $-(CH_2)_q$ -
 mit q gleich 0-4, eine Methylthio-
 25 ethyl-Gruppe,
 R^8 Wasserstoff, einen Alkylrest mit 1-6
 Kohlenstoffatomen,
 $R^9, R^{10}, R^{13}, R^{14}$ gleich oder voneinander verschieden
 sind und Wasserstoff, Halogen, einen
 30 Alkyl- oder Alkoxy-Rest mit 1-4 Koh-
 lenstoffatomen, eine Trifluormethyl-
 gruppe oder jeweils zusammen (R^9+R^{10} ,
 $R^{13}+R^{14}$) eine Methylendioxygruppe,
 R^{11}, R^{12} gleich oder voneinander verschieden
 sind und Wasserstoff, einen gesättig-
 35 ten oder ungesättigten, linearen oder
 verzweigten Alkylrest mit 1-19 Kohlen-
 stoffatomen, einen Aralkylrest der

- 1 Formel $-(\text{CH}_2)_r$  mit
 r gleich 0-4,
 5 X^- ein Säureanion einer anorganischen
 oder organischen, ein- oder mehrbasi-
 5 sischen Säure und die Summe aus
 m + n eine ganze Zahl von 0-10
 bedeuten.
- 10 2. N-(2-Hydroxyalkyl)-aminosäuren und ihre Derivate der
 allgemeinen Formeln I und II
- worin
- 15 R^1 einen Alkylrest mit 10-20 Kohlenstoff-
 atomen,
 R^2 Wasserstoff,
 R^3 Wasserstoff, einen gesättigten oder
 ungesättigten Alkylrest mit 1-20 Koh-
 lenstoffatomen, $-\text{CO}-\text{R}^{11}$, $-\text{COOR}^{11}$,
 $-\text{CO}-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{CS}-\text{NH}-\text{R}^{11}$, $-\text{O}_2\text{S}-\text{R}^{11}$,
 20 R^4, R^5 gleich oder voneinander verschieden
 sind und Wasserstoff oder einen Alkyl-
 rest mit 1-4 Kohlenstoffatomen,
 R^6, R^7 Wasserstoff,
 R^8 Wasserstoff oder einen Alkylrest mit
 25 1-6 Kohlenstoffatomen,
 $\text{R}^{11}, \text{R}^{12}$ gleich oder voneinander verschieden
 sind und Wasserstoff, einen gesättig-
 ten oder ungesättigten Alkylrest mit
 30 1-19 Kohlenstoffatomen, Phenyl oder
 Benzyl,
 X^- ein Säureanion einer anorganischen
 oder organischen, ein- oder mehrbasi-
 sischen Säure und die Summe aus
 m + n eine ganze Zahl von 0-10
 35 bedeuten.

- 1 3. N-(2-Hydroxyalkyl)-aminosäuren und ihre Derivate der
allgemeinen Formeln I und II,

5 worin
 R^1 einen Alkylrest mit 10-20 Kohlenstoff-
 atomen,
 R^2, R^3, R^6, R^7 Wasserstoff,
 R^4, R^5 Methyl,
 10 R^8 Wasserstoff, einen Alkylrest mit 1-6
 Kohlenstoffatomen,
 X^- ein Säureanion einer anorganischen
 oder organischen, ein- oder mehrbasi-
 schen Säure und die Summe aus
 15 $m + n$ eine ganze Zahl von 0-10
 bedeuten.

4. N-(2-Hydroxyalkyl)-aminosäuren und ihre Derivate der
allgemeinen Formeln I und II,

20 worin
 R^1 einen Alkylrest mit 10-20 Kohlenstoff-
 atomen,
 R^2, R^6, R^7 Wasserstoff,
 R^3 -CO- R^{11} , -O₂S-CH₃
 25 R^4, R^5 Methyl,
 R^8 Wasserstoff, einen Alkylrest mit 1-6
 Kohlenstoffatomen,
 R^{11} Wasserstoff, einen gesättigten oder
 ungesättigten Alkylrest mit 1-19 Koh-
 30 lenstoffatomen,
 X^- ein Säureanion einer anorganischen
 oder organischen, ein- oder mehrbasi-
 schen Säure und die Summe aus
 35 $m + n$ eine ganze Zahl von 0-10
 bedeuten.

- 1 5. N-(2-Hydroxyalkyl)-aminosäuren und ihre Derivate der
allgemeinen Formeln I und II,
- 5 worin
- | | |
|--|--|
| R ¹ | einen Alkylrest mit 10-20 Kohlenstoff- atomen, |
| R ² , R ⁶ , R ⁷ | Wasserstoff, |
| R ³ | -COOR ¹¹ , |
| 10 R ⁴ , R ⁵ | Methyl, |
| R ⁸ | Wasserstoff, einen Alkylrest mit 1-6 Kohlenstoffatomen, |
| R ¹¹ | Wasserstoff, einen gesättigten oder ungesättigten Alkylrest mit 1-19 Koh- lenstoffatomen, |
| 15 X ⁻ | ein Säureanion einer anorganischen oder organischen, ein- oder mehrbasi- schen Säure und die Summe aus |
| m + n | eine ganze Zahl von 0-10 bedeuten. |
- 20
6. N-(2-Hydroxyalkyl)-aminosäuren und ihre Derivate der
allgemeinen Formeln I und II,
- 25 worin
- | | |
|--|--|
| R ¹ | einen Alkylrest mit 10-20 Kohlenstoff- atomen, |
| R ² , R ⁶ , R ⁷ | Wasserstoff, |
| R ³ | -CO-NR ¹¹ R ¹² , -CS-NH-R ¹¹ |
| 30 R ⁴ , R ⁵ | Methyl, |
| R ⁸ | Wasserstoff, einen Alkylrest mit 1-6 Kohlenstoffatomen, |
| R ¹¹ | Wasserstoff, Methyl, Ethyl, |
| R ¹² | einen gesättigten oder ungesättigten Alkylrest mit 1-9 Kohlenstoffatomen, |
- 35

1 X^- ein Säureanion einer anorganischen
oder organischen, ein- oder mehrbasischen
Säure und die Summe aus
m + n eine ganze Zahl von 0-10 bedeuten.

5

10 7. Verbindungen der Formel I oder II,
worin

R^1 C_{10} - C_{20} -Alkyl,

15 R^2 Wasserstoff,

R^3 Wasserstoff oder C_2 - C_6 -Alkanoyl,

R^4, R^5 C_1 - C_6 -Alkyl,

20

R^6, R^7 Wasserstoff,

R^8 C_1 - C_6 -Alkyl oder Wasserstoff,

25

m die Zahl Null und

n eine Zahl von 1 bis 6, insbesondere
1, 2, 3 oder 4 ist.

30

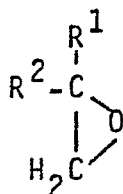
35

1

5

8. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel II gemäß den Ansprüchen 1-7, dadurch gekennzeichnet, daß man Epoxide der allgemeinen Formel III,

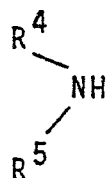
10



15

in der R^1 und R^2 die in den Formeln I und II angegebenen Bedeutungen haben, mit Aminen der Formel IV,

20

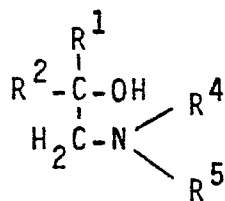


IV

25

in der R^4 und R^5 die in den Formeln I und II angegebenen Bedeutungen besitzen, in organischen oder organisch-wässrigen Lösungsmittelsystemen, bevorzugt Methanol oder Ethanol, gegebenenfalls unter Druck, zu den β -Aminoalkoholen der Formel V,

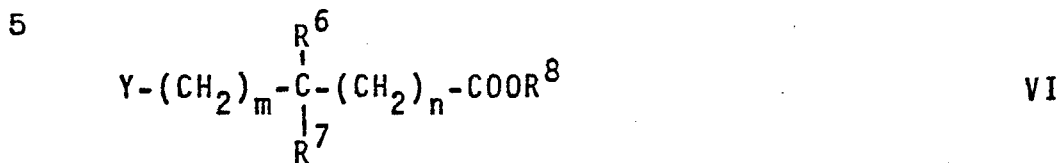
30



V

35

1 in der R^1 , R^2 , R^4 , R^5 die in den Formeln I und II angegebenen Bedeutungen haben, umgesetzt und diese mit einem Alkylierungsmittel der Formel VI,



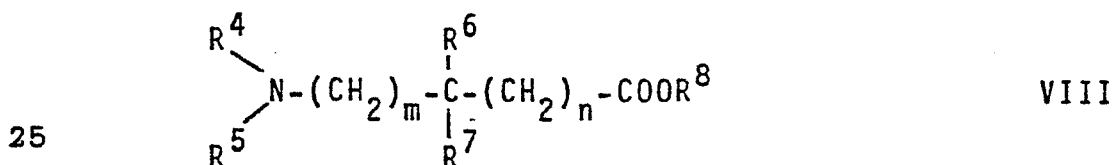
10

in der R^6 , R^7 , R^8 , m und n die in den Formeln I und II angegebenen Bedeutungen haben und Y ein Chlor-, Brom-, Jodatom oder eine ähnliche Abgangsgruppe darstellt, in einem indifferenten organischen Lösungsmittel behandelt, wobei Verbindungen der Formel II mit $R^3=H$ entstehen.

15

9. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel II mit $R^3=H$ gemäß den Ansprüchen 1-7, dadurch gekennzeichnet, daß man Epoxide der allgemeinen Formel III mit Aminocarbonsäureestern der allgemeinen Formel VII,

20



30 in der R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , m und n die in den Formeln I und II angegebenen Bedeutungen haben, in organischen oder organisch-wässrigen Lösungsmittelsystemen, bevorzugt Methanol oder Ethanol, umgesetzt und die entstandene Stickstoffbase mit einer Säure der Formel II HX, deren Anion X^- die in Formel II angegebene Bedeutung hat,

35

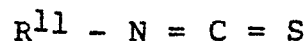
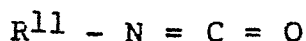
behandelt.

- 1
 10. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der For-
 meln I und II gemäß den Ansprüchen 1-7, dadurch ge-
 5
 kennzeichnet, daß man Verbindungen der Formeln I und
 II (mit R^3 = Wasserstoff; R^4 , R^5 ungleich Wasserstoff)
 mit Alkylierungsmitteln oder Acylierungsmitteln der
 Formel VIII,



VIII

- 10
 worin R^3 die in den Formeln I und II angegebene Bedeu-
 tung hat (mit Ausnahme von Wasserstoff) und Z ein
 Halogenatom, Acyloxy-Rest oder ähnliche Abgangsgruppe
 15
 darstellt, in Substanz oder einem indifferenten orga-
 nischen Lösungsmittel, gegebenenfalls unter Anwendung
 einer Hilfsbase, die mit dem Acylierungsmittel oder
 Alkylierungsmittel und dem Rest R^8 kompatibel ist,
 umgesetzt, wobei als Acylierungsmittel sinngemäß auch
 organische Isocyanate oder Isothiocyanate der For-
 20
 meln IX und X in Frage kommen,



IX

X

- 25
 in denen R^{11} die in den Formeln I und II angegebene
 Bedeutung hat.

- 30
 11. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel
 I gemäß den Ansprüchen 1-7, dadurch gekennzeichnet,
 daß man Verbindungen der Formel II nach dem üblichen
 Verfahren, z.B. durch Reaktion mit einem Alkali-
 35
 hydroxid in wässrigen, wässrig-organischen oder organi-
 schen Reaktionsmedien, in die entsprechenden Alkali-
 salze der Formel II (R^8 = Alkali) und durch nachfol-
 genden Zusatz einer Mineralsäure in die Betaine der
 Formel I überführt, wobei für den Fall, daß R^3 ein

1 gegenüber Alkalihydroxid stabiler Rest ist, R^3 in den
 Formeln I und II identisch ist, während für den Fall,
 daß R^3 eine verseifbare Gruppe enthält, R^3 in der For-
 5 mel I ein Wasserstoffatom darstellt.

12. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel
 II mit R^4 , $R^5 \neq H$, dadurch gekennzeichnet, daß man
 Verbindungen der Formel V mit R^4 , $R^5 \neq H$ mit Acylier-
 10 rungsmitteln der Formel VIII in Substanz oder in einem
 indifferenten organischen Lösungsmittel, gegebenen-
 falls unter Anwendung einer Hilfsbase, reagieren läßt,
 wobei als Acylierungsmittel sinngemäß auch organische
 Isocyanate oder Isothiocyanate der Formeln IX und X in
 15 Frage kommen, und die entstandenen Verbindungen der
 Formel XI,



worin R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 die in der Formel II angege-
 25 benen Bedeutungen haben, mit einem Alkylierungsmittel
 der Formel VI in einem indifferenten organischen
 Lösungsmittel behandelt.

13. Pharmazeutische Präparate, dadurch gekennzeichnet, daß
 30 sie eine Verbindung der Formel I oder II gemäß den
 Ansprüchen 1-7 als Wirkstoff im Gemisch mit üblichen
 pharmazeutischen Hilfs- und Trägerstoffen enthalten.

14. Verwendung von Verbindungen der Formel I oder II
 35 nach einem oder mehreren der vorangegangenen Ansprüche
 zur Herstellung eines Arzneimittels.