



(19)  
Bundesrepublik Deutschland  
Deutsches Patent- und Markenamt

(10) DE 696 29 133 T2 2004.02.05

(12)

## Übersetzung der europäischen Patentschrift

(97) EP 0 987 255 B1

(21) Deutsches Aktenzeichen: 696 29 133.9

(96) Europäisches Aktenzeichen: 99 123 596.1

(96) Europäischer Anmeldetag: 28.03.1996

(97) Erstveröffentlichung durch das EPA: 22.03.2000

(97) Veröffentlichungstag

der Patenterteilung beim EPA: 16.07.2003

(47) Veröffentlichungstag im Patentblatt: 05.02.2004

(51) Int Cl.<sup>7</sup>: C07D 239/80

C07D 401/12, C07D 405/06, C07D 405/12,  
C07D 417/12, A01N 43/54

(30) Unionspriorität:  
**9987995** 31.03.1995 JP

(84) Benannte Vertragsstaaten:  
**AT, CH, DE, ES, FR, GB, IT, LI, NL**

(73) Patentinhaber:  
**Nihon Nohyaku Co., Ltd., Tokio/Tokyo, JP**

(72) Erfinder:  
**Uehara, Masahiro, Sakai-shi, Osaka, JP; Shimizu, Toshiaki, Kawachinagano-shi, Osaka, JP; Fujioka, Shinsuke, Kawachinagano-shi, Osaka, JP; Kimura, Masayuki, Kawachinagano-shi, JP; Tsubata, Kenji, Kawachinagano-shi, JP**

(74) Vertreter:  
**Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser, 80538 München**

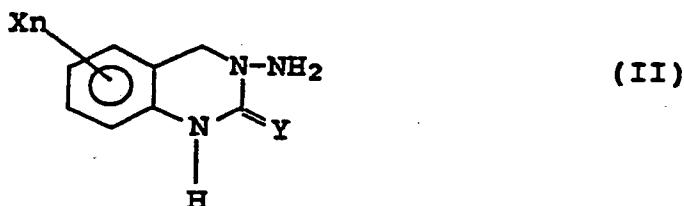
(54) Bezeichnung: **Substituierte Aminochinazolinon (thion) Derivate**

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzureichen und zu begründen. Er gilt erst als eingereicht, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99 (1) Europäisches Patentübereinkommen).

Die Übersetzung ist gemäß Artikel II § 3 Abs. 1 IntPatÜG 1991 vom Patentinhaber eingereicht worden. Sie wurde vom Deutschen Patent- und Markenamt inhaltlich nicht geprüft.

**Beschreibung**

[0001] Die vorliegende Erfindung betrifft Verbindungen der allgemeinen Formel (II).

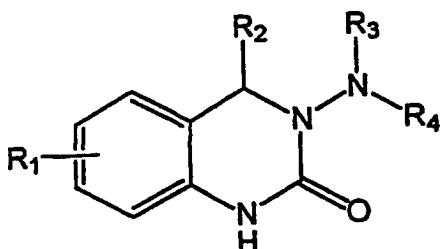


worin die Gruppen X, die gleich oder verschieden sein können, Halogenatome; Hydroxylgruppen; Nitrogruppen; Cyanogruppen; ( $C_{1-8}$ )Alkylgruppen; Halo( $C_{1-6}$ )alkylgruppen; ( $C_{1-6}$ )Alkoxygruppen; Halo( $C_{1-6}$ )Alkoxygruppen; ( $C_{1-3}$ )Alkylendioxygruppen; Hydroxycarbonylgruppen; ( $C_{1-6}$ )Alkoxycarbonylgruppen; ( $C_{2-6}$ )Alkenyloxycarbonylgruppen; ( $C_{2-6}$ )Alkynyloxycarbonylgruppen; unsubstituierte Aminocarbonylgruppen; substituierte Aminocarbonylgruppen mit ein oder zwei Substituenten, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus ( $C_{1-6}$ )Alkylgruppen, ( $C_{2-6}$ )Alkenylgruppen und ( $C_{2-6}$ )Alkynylgruppen; unsubstituierte Aminogruppen; substituierte Aminogruppen mit ein oder zwei Substituenten, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus ( $C_{1-6}$ )Alkylgruppen, ( $C_{2-6}$ )Alkenylgruppen und ( $C_{2-6}$ )Alkynylgruppen; bedeuten, n eine ganze Zahl von 0 oder 1 bis 4 ist und Y ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom ist,

die Verwendung der Verbindung der allgemeinen Formel (II) für die Herstellung eines substituierten Aminochinazolinon(thion)-Derivats und ein Verfahren zur Herstellung der Verbindung der Formel (II).

[0002] Die nicht geprüften japanischen Patentveröffentlichungen Nr. 1-132580, 2-290871 und 6-234748 beschreiben, dass Triazinonderivate oder Imidazolderivate als Schädlingsbekämpfungsmittel geeignet sind.

[0003] In Journal of Heterocyclic Chemistry, 21, (6), 1984, Seiten 1709 bis 1711 werden 3-Amino-3,4-dihydro-2(1H)-chinazolinonverbindungen mit der folgenden Formel beschrieben

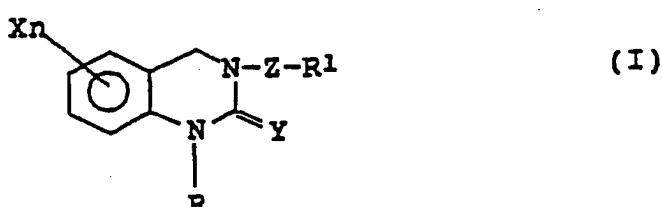


worin  $R^1$  H, 6-Cl, 6- $CH_3$  oder 8- $OCH_3$  ist,  $R^2$  H,  $CH_3$  oder Phenyl bedeutet und  $R^3$  und  $R^4$  jeweils  $CH_3$  sind oder miteinander verbunden sind, um eine  $(CH_2)_5$ -Gruppe oder eine  $O(CH_2CH_2)_2$ -Gruppe zu bilden.

[0004] Die Erfinder der vorliegenden Erfindung haben intensive Forschungen zur Entwicklung eines neuen Schädlingsbekämpfungsmittels unternommen und haben so die vorliegende Erfindung abgeschlossen. Die substituierten Aminochinazolinon(thion)-Derivate der allgemeinen Formel (I) und Verbindungen der allgemeinen Formel (II), Zwischenprodukte zur Herstellung der Derivate, sind neue Verbindungen, die in der Literatur nicht bekannt sind.

[0005] Im Folgenden wird die vorliegende Erfindung detailliert beschrieben.

[0006] Die vorliegende Erfindung betrifft Verbindungen der allgemeinen Formel (II), die als Zwischenprodukte in der Herstellung eines substituierten Aminochinazolinon(thion)-Derivats der allgemeinen Formel (I) oder eines Salzes davon geeignet sind:



worin R ein Wasserstoffatom; eine Hydroxylgruppe; eine Formylgruppe; eine ( $C_{1-12}$ )Alkylgruppe; eine Halo( $C_{1-6}$ )alkylgruppe; eine Hydroxy( $C_{1-6}$ )alkylgruppe; eine ( $C_{2-6}$ )Alkenylgruppe; eine ( $C_{2-6}$ )Alkynylgruppe; eine

(C<sub>1-6</sub>)Alkoxygruppe; eine Halo(C<sub>1-6</sub>)alkoxygruppe; eine (C<sub>1-6</sub>)Alkoxy(C<sub>1-3</sub>)alkylgruppe; eine (C<sub>1-6</sub>)Alkoxy(C<sub>1-3</sub>)alkoxy(C<sub>1-3</sub>)alkylgruppe; eine (C<sub>1-6</sub>)Alkylthiogruppe; eine Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylthiogruppe; eine (C<sub>1-6</sub>)Alkylsulfinylgruppe; eine (C<sub>1-6</sub>)Alkylsulfonylgruppe; eine (C<sub>1-6</sub>)Alkylthio-(C<sub>1-3</sub>)alkylgruppe; eine Di(C<sub>1-6</sub>)alkoxy(C<sub>1-3</sub>)alkylgruppe, in der die (C<sub>1-6</sub>)Alkoxygruppen gleich oder verschieden sein können; eine unsubstituierte Amino(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppe; eine substituierte Amino(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppe mit 1 oder 2 Substituenten, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppen, (C<sub>2-6</sub>)Alkenylgruppen und (C<sub>2-6</sub>)Alkynylgruppen; eine Cyano(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppe; eine (C<sub>1-6</sub>)Alkylcarbonylgruppe; eine (C<sub>1-6</sub>)Alkoxy carbonylgruppe; eine Hydroxycarbonyl(C<sub>1-3</sub>)alkylgruppe; eine (C<sub>1-6</sub>)Alkoxy carbonyl(C<sub>1-3</sub>)alkylgruppe; eine unsubstituierte Aminocarbonylgruppe; eine substituierte Aminocarbonylgruppe mit 1 oder 2 Substituenten, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppen, (C<sub>2-6</sub>)Alkenylgruppen und (C<sub>2-6</sub>)Alkynylgruppen; eine (C<sub>3-6</sub>)Cycloalkyl(C<sub>1-3</sub>)alkylgruppe; eine unsubstituierte Phenyl(C<sub>1-3</sub>)alkylgruppe; eine substituierte Phenyl(C<sub>1-3</sub>)alkylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkoxygruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkoxygruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylthiogruppen und Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylthiogruppen; eine unsubstituierte Phenylcarbonylgruppe; eine substituierte Phenylcarbonylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkoxygruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkoxygruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylthiogruppen und Halo-(C<sub>1-6</sub>)alkylthiogruppen; eine unsubstituierte Phenylthiogruppe; eine substituierte Phenylthiogruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylthiogruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkoxygruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkoxygruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylthiogruppen und Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylthiogruppen; eine unsubstituierte Phenylsulfonylgruppe; eine substituierte Phenylsulfonylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkoxygruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkoxygruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylthiogruppen und Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylthiogruppen; eine unsubstituierte Phenyl(C<sub>1-6</sub>)alkylsulfonylgruppe; eine substituierte Phenyl-(C<sub>1-6</sub>)alkylsulfonylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkoxygruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkoxygruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylthiogruppen und Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylthiogruppen; eine unsubstituierte Phenoxy carbonylgruppe; eine substituierte Phenoxy carbonylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkoxygruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkoxygruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylthiogruppen und Halo-(C<sub>1-6</sub>)alkylthiogruppen; eine unsubstituierte Phenoxy(C<sub>1-3</sub>)alkylgruppe; eine substituierte Phenoxy(C<sub>1-3</sub>)alkylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkoxygruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkoxygruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylthiogruppen und Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylthiogruppen; eine unsubstituierte Phenyl(C<sub>2-6</sub>)alkenylgruppe; eine substituierte Phenyl(C<sub>2-6</sub>)alkenylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkoxygruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkoxygruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylthiogruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylthiogruppen und (C<sub>1-2</sub>)Alkylendioxygruppen; eine Phenyl(C<sub>2-6</sub>)alkynylgruppe; eine substituierte Phenyl(C<sub>2-4</sub>)alkynyl(C<sub>1-3</sub>)alkylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen, (C<sub>1-6</sub>)alkylgruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkoxygruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkoxygruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylthiogruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylthiogruppen und (C<sub>1-2</sub>)Alkylendioxygruppen; eine 1,3-Dioxolan-2-yl(C<sub>1-3</sub>)alkylgruppe; oder eine Phthalimido(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppe bedeutet;

R<sup>1</sup> ein 5- oder 6-gliedriger heterozyklischer Ring mit 1 bis 3 Heteroatomen ist, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoffatomen, Schwefelatomen und Stickstoffatomen, wobei der heterozyklische Ring 1 bis 5 Substituenten aufweisen kann, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Cyanogruppen, (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppen, Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppen und (C<sub>1-6</sub>)Alkoxygruppen, und das Stickstoffatom in dem heterozyklischen Ring eine N-Oxidgruppe bilden kann,

Y ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom bedeutet,

Z

-N=C(R<sup>2</sup>)

(worin R<sup>2</sup> ein Wasserstoffatom, eine (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppe oder eine Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppe bedeutet),

-N(R<sup>3</sup>)-CH(R<sup>2</sup>)

(worin R<sup>2</sup> wie oben definiert ist und R<sup>3</sup> ein Wasserstoffatom, eine (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppe, eine Formylgruppe, eine (C<sub>1-3</sub>)Alkylcarbonylgruppe, eine Halo(C<sub>1-3</sub>)alkylcarbonylgruppe oder eine (C<sub>1-3</sub>)Alkyldithiocarbonylgruppe bedeutet), oder

-N(R<sup>3</sup>)-CO

(worin R<sup>3</sup> wie oben definiert ist) bedeutet,

die Gruppen X, die gleich oder verschieden sein können, Halogenatome; Hydroxylgruppen; Nitrogruppen; Cyanogruppen; (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppen; Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppen; (C<sub>1-6</sub>)Alkoxygruppen; Halo(C<sub>1-6</sub>)alkoxygruppen; (C<sub>1-3</sub>)Alkenen-dioxygruppen; Hydroxycarbonylgruppen; (C<sub>1-6</sub>)Alkoxy carbonylgruppen; (C<sub>2-6</sub>)Alkenyloxycarbonylgruppen; (C<sub>2-6</sub>)Alkynyloxycarbonylgruppen; unsubstituierte Aminocarbonylgruppen; substituierte Aminocarbonylgruppen mit 1 oder 2 Substituenten, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus (C<sub>2-6</sub>)Alkylgruppen, (C<sub>2-6</sub>)Alkenylgruppen und (C<sub>2-6</sub>)Alkynylgruppen; unsubstituierte Aminogruppen; oder substituierte Aminogruppen mit 1 oder 2 Substituenten, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppen, (C<sub>2-6</sub>)Alkenylgruppen und (C<sub>2-6</sub>)Alkynylgruppen, sind und

n eine ganze Zahl von 0 oder 1 bis 4 ist.

[0007] In der Definition der Substituenten des erfindungsgemäßen substituierten Aminochinazolinon(thion)-Derivats der allgemeinen Formel (I) umfasst der Begriff "Halogenatom" Chloratome, Bromatome, Iodatome und Fluoratome. Der Begriff "(C<sub>1-12</sub>)Alkylgruppe" bedeutet eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, wie Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, s-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl, n-Hexyl, n-Heptyl, n-Octyl, n-Nonyl, n-Decyl, n-Undecyl, n-Dodecyl, etc.. Der Begriff "Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppe" bedeutet eine substituierte und lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, die als Substituenten) ein oder mehrere Halogenatome aufweist, welche gleich oder verschieden sein können. Der Begriff "(C<sub>2-6</sub>)Alkenylgruppe" bedeutet eine lineare oder verzweigte Alkenylgruppe mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und einer oder mehreren Doppelbindungen. Der Begriff "Halo(C<sub>2-6</sub>)Alkenylgruppe" bedeutet eine substituierte und lineare oder verzweigte Alkenylgruppe mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und als Substituenten) ein oder mehrere Halogenatome, die gleich oder verschieden sein können. Der Begriff "(C<sub>2-6</sub>)Alkynylgruppe" bedeutet eine lineare oder verzweigte Alkynylgruppe mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und einer oder mehreren Dreifachbindungen. Der Begriff "Halo(C<sub>2-6</sub>)Alkynylgruppe" bedeutet eine substituierte und lineare oder verzweigte Alkynylgruppe mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und einem oder mehreren Halogenatomen als Substituent(en), welche gleich oder verschieden sein können.

[0008] Der Begriff "5- oder 6-gliedriger heterocyclischer Ring mit 1 bis 3 Heteroatomen, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoffatomen, Schwefelatomen und Stickstoffatomen" bedeutet einen beliebigen heterocyclischen Ring, der von Furan, Thiophen, Pyrrol, Oxazol, Thiazol, Isothiazol, Pyrazol, Imidazol, 1,2,3-Thiadiazol, 1,2,4-Thiadiazol, 1,2,5-Thiadiazol, 1,3,4-Thiadiazol, 1,2,4-Triazol, Pyridin, Pyridazin, Pyrimidin, Pyrazin, Pyrrolidin, Piperidin, Morpholin, Thiomorpholin, Dithiolan, Dithian, Piperazin, Dioxolan, Imidazolizin, Tetrahydrofuran und ähnlichen abgeleitet ist.

[0009] Die Substituenten des substituierten Aminochinazolinon(thion)-Derivats der allgemeinen Formel (I) sind vorzugsweise folgende: R ist eine Formylgruppe, eine (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppe, eine (C<sub>2-6</sub>)Alkenylgruppe, eine (C<sub>1-6</sub>)Alkynylgruppe, eine (C<sub>1-6</sub>)Alkylcarbonylgruppe, eine (C<sub>1-6</sub>)Alkoxy carbonylgruppe, eine (C<sub>1-6</sub>)Alkylthiogruppe, eine Halo(C<sub>1-6</sub>)alkylthiogruppe, eine unsubstituierte Phenylcarbonylgruppe, eine substituierte Phenylcarbonylgruppe, eine substituierte Phenyl(C<sub>1-6</sub>)alkylgruppe, eine substituierte Phenyl(C<sub>2-6</sub>)Alkenylgruppe oder eine substituierte Phenyl(C<sub>2-6</sub>)Alkynylgruppe; R<sup>1</sup> ist eine Pyridylgruppe, insbesondere eine 3-Pyridylgruppe; Y ist ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom; Z ist

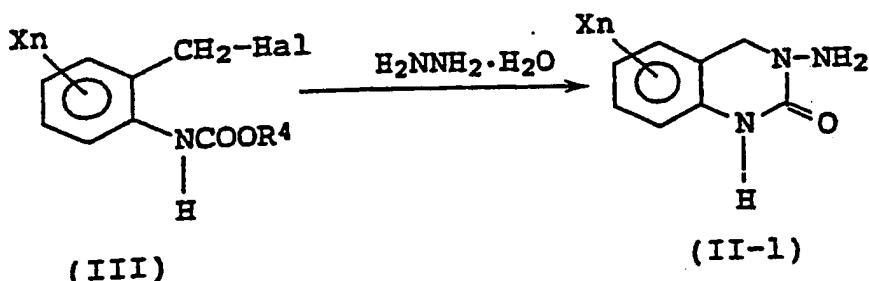
-N(R<sup>3</sup>)-CH(R<sup>2</sup>)

(worin jedes von R<sup>3</sup> und R<sup>2</sup> ein Wasserstoffatom oder eine (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppe bedeutet); jede der Gruppen X ist ein Halogenatom, eine (C<sub>1-6</sub>)Alkylgruppe oder eine Methylendioxygruppe; und n ist 0 bis 2.

[0010] Als Beispiele für die Salze des substituierten Aminochinazolinon(thion)-Derivats der allgemeinen Formel (I) können Salze mit Mineralsäuren, wie Chlorwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Salpetersäure, etc., und Salze mit Alkalimetallatomen, wie Natrium, Kalium, etc., genannt werden.

[0011] Die Verbindung der allgemeinen Formel (II), ein Zwischenprodukt zur Herstellung des substituierten Aminochinazolinon(thion)-Derivats der vorliegenden Erfindung, kann nach einem der folgenden Verfahren hergestellt werden.

Herstellungsverfahren 1



worin X und n wie oben definiert sind,  $R^4$  eine  $(C_1-C_6)$ -Alkylgruppe ist und Hal ein Halogenatomen bedeutet.

[0012] Eine Verbindung der allgemeinen Formel (II-1) kann hergestellt werden durch Umsetzen einer Verbindung der oben angegebenen allgemeinen Formel (III) mit Hydrazinhydrat in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels.

[0013] Als für diese Reaktion geeignetes inertes Lösungsmittel kann jedes inerte Lösungsmittel verwendet werden, solange es das Fortschreiten der Reaktion nicht merklich inhibiert. Als Beispiele können Alkohole, wie Methanol, Ethanol, Propanol und Butanol; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan, Chloroform und Kohlenstofftetrachlorid; aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Benzol, Toluol und Xylol; Nitrile, wie Acetonitril und Benzonitril; Cellosolve, wie Methylcellosolve; Ether, wie Diethylether, Diglyme, Dioxan und Tetrahydrofuran; Amide, wie Dimethylformamid, Dimethylacetamid, 1,3-Dimethyl-2-imidazolidinon und 1-Methyl-2-pyrrolidon; Dimethylsulfoxid; Sulfolan; und Wasser genannt werden. Diese inerten Lösungsmittel können einzeln oder als Mischungen verwendet werden.

[0014] Die Reaktionstemperatur kann in geeigneter Weise gewählt werden im Bereich von Raumtemperatur bis zum Siedepunkt des verwendeten inerten Lösungsmittels, und liegt vorzugsweise im Bereich von Raumtemperatur bis 90°C.

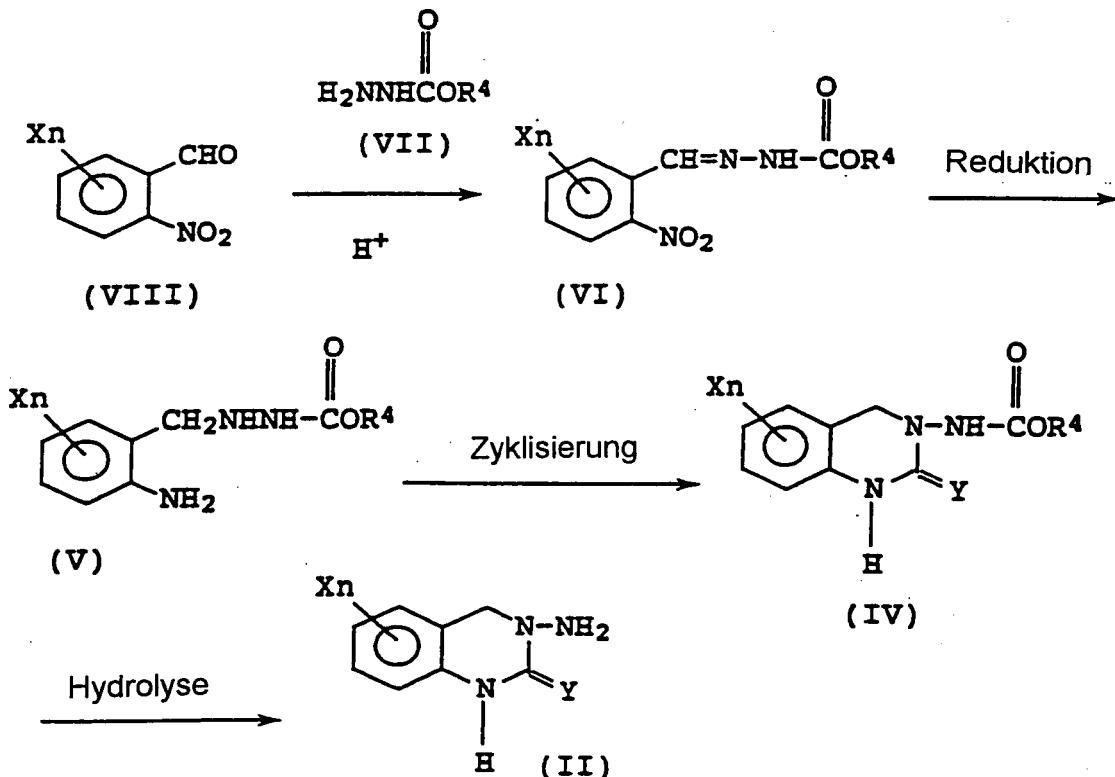
[0015] Da die Reaktion eine äquimolare Reaktion ist, ist es ausreichend, wenn die Verbindung der allgemeinen Formel (III) und das Hydrazinhydrat in äquimolaren Mengen verwendet werden, obwohl jeder dieser Reaktanten im Überschuss eingesetzt werden kann. Es ist bevorzugt, Hydrazinhydrat im Überschuss einzusetzen.

[0016] Obwohl die Reaktionszeit in Abhangigkeit von der Groenordnung der Reaktion, der Reaktionstemperatur etc. variiert, liegt sie im Bereich von wenigen Minuten bis 48 Stunden.

[0017] Nach Beendigung der Reaktion wird die gewünschte Verbindung aus der Reaktionsmischung, die die gewünschte Verbindung enthält, durch übliche Verfahren isoliert und, wenn notwendig, beispielsweise durch Umkristallisation oder Chromatografie auf einer trockenen Kolonne, gereinigt, wodurch die gewünschte Verbindung hergestellt werden kann.

[0018] Die Verbindung der obengenannten allgemeinen Formel (III) kann gemäß Collect. Czech. Chem. Comm. (Band 55), 752 (1990) hergestellt werden.

## Herstellungsverfahren 2



worin  $R^4$ , X, Y und n wie oben definiert sind.

2-1. Allgemeine Formel (VIII) → allgemeine Formel (VI)

[0019] Eine Verbindung der allgemeinen Formeln (VI) kann hergestellt werden durch Umsetzen einer Verbindung der allgemeinen Formel (VIII) mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (VII) in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels und eines Katalysators.

[0020] Als in dieser Reaktion einsetzbare inerte Lösungsmittel können beispielsweise die inerten Lösungsmittel, die beispielhaft mit Bezug auf das Herstellungsverfahren 1 angegeben wurden, eingesetzt werden. Diese inerten Lösungsmittel können einzeln oder als Mischung verwendet werden.

[0021] Als Katalysator können beispielsweise anorganische Säuren (z. B. Chlorwasserstoffsäure und Schwefelsäure), Essigsäure und p-Toluolsulfonsäure verwendet werden. Die Menge an einzusetzendem Katalysator kann so gewählt werden, dass der Katalysator in dem Reaktionssystem in einer Menge von 0,001 Gew.-% bis 10 Gew.-%, bezogen auf das Gewicht der Verbindung der allgemeinen Formel (VIII), vorliegt.

[0022] Da die Reaktion eine äquimolare Reaktion ist, ist es ausreichend, wenn die Verbindung der allgemeinen Formel (VIII) und die Verbindung der allgemeinen Formel (VII) in äquimolaren Mengen eingesetzt werden, obwohl jede der beiden Reaktanten im Überschuss verwendet werden kann.

[0023] Die Reaktionstemperatur kann in geeigneter Weise im Bereich von Raumtemperatur bis zum Siedepunkt des verwendeten inerten Lösungsmittels gewählt werden, und liegt vorzugsweise im Bereich von Raumtemperatur bis 90°C.

[0024] Obwohl die Reaktionszeit beispielsweise in Abhangigkeit von der Groenordnung der Reaktion und/oder der Reaktionstemperatur variiert, liegt sie im Bereich von wenigen Minuten bis 48 Stunden.

[0025] Nach Beendigung der Reaktion wird die Reaktionsmischung, die die gewünschte Verbindung enthält, in derselben Weise wie im Herstellungsverfahren 1 behandelt, wodurch die gewünschte Verbindung hergestellt werden kann.

[0026] Die Verbindung der allgemeinen Formel (VIII) kann im Handel erhalten werden oder durch Nitrieren eines substituierten Benzaldehyds hergestellt werden.

2-2. Allgemeine Formel (VI) → allgemeine Formel (V)

[0027] Eine Verbindung der allgemeinen Formel (V) kann durch Reduzieren der Verbindung der allgemeinen Formel (VI) mit einem Reduktionsmittel oder durch katalytische Reduktion in Anwesenheit oder Abwesenheit

eines inerten Lösungsmittels hergestellt werden.

[0028] Als Reduktionsmittel können beispielsweise Metallhydride wie  $\text{NaBH}_3\text{CN}$  und  $\text{LiBH}_3\text{CN}$ , und Reduktionsmittel, wie  $\text{BH}_3$ , verwendet werden. Die Menge an verwendetem Reduktionsmittel kann in geeigneter Weise im Bereich von 1 Mol bis zu überschüssigen Molen (bezogen auf die Zahl der Mole an Hydrid als Reduktionsmittel) pro Mol der Verbindung der Formel (VI) gewählt werden.

[0029] Als inertes Lösungsmittel, das in der Reaktion verwendet werden kann, kann jedes inerte Lösungsmittel verwendet werden, solange es den Fortgang der Reaktion nicht deutlich inhibiert. Beispiele umfassen Alkohole, wie Methanol, Ethanol, Propanol und Butanol; Cellosolve, wie Methylcellosolve; Ether, wie Diethylether, Diglyme, Dioxan und Tetrahydrofuran; Ester, wie Ethylacetat; Amide, wie Dimethylformamid, Dimethylacetamid, 1,3-Dimethyl-2-imidazolidinon und 1-Methyl-2-pyrrolidon; Dimethylsulfoxid; Sulfolan; und Wasser. Diese inerten Lösungsmittel können einzeln oder als Mischung verwendet werden.

[0030] Die Reaktion wird unter sauren oder neutralen Bedingungen im pH-Bereich von 1 bis 7, vorzugsweise von 4 bis 6, durchgeführt. Es ist ausreichend, wenn der pH-Wert beispielsweise durch Zugabe von Chlorwasserstoff oder Bromwasserstoff zu dem Reaktionssystem eingestellt wird.

[0031] Die Reaktionstemperatur wird im Bereich von 0°C bis zum Siedepunkt des Lösungsmittels gewählt und liegt vorzugsweise im Bereich von Raumtemperatur bis 70°C.

[0032] Obwohl die Reaktionszeit beispielsweise in Abhängigkeit von der Größenordnung der Reaktion und/oder der Temperatur variiert, liegt sie im Bereich von wenigen Minuten bis 48 Stunden.

[0033] Nach Beendigung der Reaktion wird die gewünschte Verbindung enthaltende Reaktionsmischung in derselben Weise wie im Herstellungsverfahren 1 behandelt, wodurch die gewünschte Verbindung hergestellt werden kann.

[0034] Wenn die katalytische Reduktion als Reduktionsreaktion durchgeführt wird, wird sie beispielsweise nach dem Verfahren, das in Shin Jikken Kagaku Koza, Band 15-11, Maruzen Co., Ltd. beschrieben wird, durchgeführt. Beispiele für das inerte Lösungsmittel, das in diesem Fall verwendet werden kann, umfassen Alkohole, wie Methanol, Ethanol, Propanol und Butanol; Cellosolve, wie Methylcellosolve; Ether, wie Diethylether, Diglyme, Dioxan und Tetrahydrofuran; Kohlenwasserstoffe, wie Hexan und Cyclohexan; Fettsäuren oder Ester davon, wie Essigsäure und Ethylacetat; Amide, wie Dimethylformamid, Dimethylacetamid, 1,3-Dimethyl-2-imidazolidinon und 1-Methyl-2-pyrrolidon; und Harnstoffe, wie Tetramethylharnstoff. Diese inerten Lösungsmittel können einzeln oder als Mischung verwendet werden.

[0035] Beispiele für die in der Reduktionsreaktion verwendeten Katalysatoren umfassen typische Katalysatoren für die katalytische Reduktion, wie Palladium-Kohlenstoff, Palladiumschwarz, Platindioxid und Raneynickel. Die Menge an eingesetztem Katalysator kann in geeigneter Weise im Bereich von 0,1% Moläquivalente bis 5% Moläquivalente, vorzugsweise im Bereich von 0,5% Moläquivalente bis 1% Moläquivalente, bezogen auf die Verbindung der allgemeinen Formel (VI), gewählt werden.

[0036] Der Wasserstoffdruck in der Reaktion liegt im Bereich von  $1,01 \times 10^5$  Pa bis  $30^3 \times 10^5$  Pa (Atmosphärendruck bis 300 Atmosphären), vorzugsweise im Bereich von  $1,01 \times 10^5$  Pa bis  $50,5 \times 10^5$  Pa (Atmosphärendruck bis 50 Atmosphären).

[0037] Die Reaktionstemperatur kann in geeigneter Weise im Bereich von Raumtemperatur bis zum Siedepunkt des verwendeten inerten Lösungsmittels gewählt werden und liegt vorzugsweise im Bereich von Raumtemperatur bis 70°C.

[0038] Obwohl die Reaktionszeit beispielsweise in Abhängigkeit von der Größenordnung der Reaktion und/oder der Reaktionstemperatur variiert, liegt sie im Bereich von wenigen Minuten bis 48 Stunden.

[0039] Nach Beendigung der Reaktion wird die Reaktionsmischung, die die gewünschte Verbindung enthält, in derselben Weise wie bei der Verwendung des Reduktionsmittels behandelt, wodurch die gewünschte Verbindung hergestellt werden kann.

### 2-3. Allgemeine Formel (V) → allgemeine Formel (IV)

[0040] Eine Verbindung der allgemeinen Formel (IV) kann hergestellt werden durch Umsetzen der Verbindung der allgemeinen Formel (V) mit 1,1'-Carbonylbis-1H-imidazol (CDI), einem Alkoxy carbonylhalogenid, Phosgen oder Thiophosgen in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels und in der Anwesenheit oder Abwesenheit einer Base.

[0041] Als Beispiele für die inerten Lösungsmittel, die in der Reaktion verwendet werden können, können Ether, wie Diethylether, Diglyme, Dioxan und Tetrahydrofuran; und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Benzol, Toluol und Xylol, genannt werden. Diese inerten Lösungsmittel können einzeln oder als Mischung verwendet werden.

[0042] Als Base kann eine anorganische Base oder eine organische Base verwendet werden. Beispiele für die Base umfassen anorganische Basen, wie Hydroxide und Carbonate von Alkalimetallen und Erdalkalimetallen [z. B. Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Magnesiumhydroxid, Natriumcarbonat, Natriumhydrogencarbonat und Kaliumcarbonat], Triethylamin und Pyridin. Wenn CDI als Reaktant eingesetzt wird, kann die Reaktion

ohne Base durchgeführt werden.

[0043] Die Menge der verwendeten Base beträgt 2 Mol oder mehr pro Mol der Verbindung der allgemeinen Formel (V).

[0044] Die Reaktionstemperatur kann in geeigneter Weise im Bereich von Raumtemperatur bis zum Siedepunkt des verwendeten inerten Lösungsmittels gewählt werden und liegt vorzugsweise im Bereich von Raumtemperatur bis 100°C.

[0045] Obwohl die Reaktionszeit beispielsweise in Abhängigkeit der Größenordnung der Reaktion und/oder der Reaktionstemperatur variiert, liegt sie im Bereich von wenigen Minuten bis 48 Stunden.

[0046] Nach Beendigung der Reaktion wird die die gewünschte Verbindung enthaltende Reaktionsmischung in derselben Weise wie im Herstellungsverfahren 1 behandelt, wodurch die gewünschte Verbindung hergestellt werden kann.

#### 2-4. Allgemeine Formel (IV) → allgemeine Formel (II)

[0047] Eine Verbindung der allgemeinen Formel (II) kann hergestellt werden durch Hydrolysieren der Verbindung der allgemeinen Formel (IV) unter Verwendung eines Alkali in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels.

[0048] Beispiele für das inerte Lösungsmittel, das in dieser Reaktion verwendet werden kann, umfassen Alkohole, wie Methanol, Ethanol, Propanol und Butanol; aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Benzol, Toluol und Xylol; Ether, wie Diethylether, Diglyme, Dioxan und Tetrahydrofuran; und Wasser. Diese inerten Lösungsmittel können einzeln oder als Mischung verwendet werden.

[0049] Als Base können Hydroxide von Alkalimetallen oder Erdalkalimetallen, wie Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Magnesiumhydroxid, verwendet werden.

[0050] Abhängig von der Alkylgruppe R<sup>4</sup> kann die Reaktion auch unter sauren Bedingungen unter Verwendung einer organischen oder anorganischen Säure, wie Trifluoressigsäure oder Chlorwasserstoffsäure, durchgeführt werden.

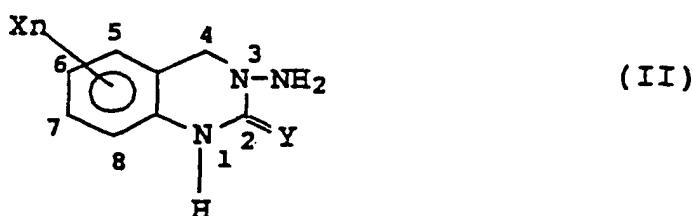
[0051] Die Reaktionstemperatur kann in geeigneter Weise im Bereich von 0°C bis zum Siedepunkt des verwendeten inerten Lösungsmittels gewählt werden.

[0052] Obwohl die Reaktionszeit z. B. in Abhängigkeit von der Größenordnung der Reaktion und/oder der Reaktionstemperatur variiert, liegt sie im Bereich von wenigen Minuten bis 48 Stunden.

[0053] Nach Beendigung der Reaktion wird die die gewünschte Verbindung enthaltende Reaktionsmischung in derselben Weise wie in Herstellungsverfahren 1 behandelt, wodurch die gewünschte Verbindung hergestellt werden kann.

[0054] Typische Beispiele für die Verbindungen der allgemeinen Formel (II), hergestellt nach den Herstellungsverfahren 1 und 2, werden in Tabelle 1 angegeben.

#### Allgemeine Formel (II)



[0055] Die in den nachstehenden Tabellen verwendete Abkürzung "Smp." bedeutet "Schmelzpunkt".

Tabelle 1

Nr.	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
II-1	H	o	Smp. 178,4-183,5°C
II-2	5-Cl	o	
II-3	6-Cl	o	Smp. 210,1°C
II-4	7-Cl	o	Smp. 215,1°C
II-5	8-Cl	o	
II-6	5-F	o	Smp. 183°C
II-7	6-F	o	Smp. 236,4-238,1°C
II-8	7-F	o	
II-9	8-F	o	
II-10	5-CH <sub>3</sub>	o	
II-11	6-CH <sub>3</sub>	o	Smp. 190,3°C
II-12	7-CH <sub>3</sub>	o	
II-13	8-CH <sub>3</sub>	o	
II-14	5-OCH <sub>3</sub>	o	
II-15	6-OCH <sub>3</sub>	o	
II-16	7-OCH <sub>3</sub>	o	
II-17	8-OCH <sub>3</sub>	o	Smp. 173,0°C
II-18	5-CF <sub>3</sub>	o	
II-19	6-CF <sub>3</sub>	o	
II-20	7-CF <sub>3</sub>	o	
II-21	8-CF <sub>3</sub>	o	
II-22	5-NO <sub>2</sub>	o	
II-23	6-NO <sub>2</sub>	o	
II-24	7-NO <sub>2</sub>	o	
II-25	8-NO <sub>2</sub>	o	

- Forts. -

Tabelle 1 (Forts.)

Nr.	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
II-26	5-CN	O	
II-27	6-CN	O	
II-28	7-CN	O	
II-29	8-CN	O	
II-30	5-COOCH <sub>3</sub>	O	
II-31	6-COOCH <sub>3</sub>	O	
II-32	7-COOCH <sub>3</sub>	O	
II-33	8-COOCH <sub>3</sub>	O	
II-34	5-CONHCH <sub>3</sub>	O	
II-35	6-CONHCH <sub>3</sub>	O	
II-36	7-CONHCH <sub>3</sub>	O	
II-37	8-CONHCH <sub>3</sub>	O	
II-38	5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	
II-39	6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	
II-40	7-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	
II-41	8-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	
II-42	6,7-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	
II-43	6-OCH <sub>2</sub> O-7	O	Smp. 211,0°C
II-44	6,7-Cl <sub>2</sub>	O	
II-45	6,7-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	
II-46	6,7-F <sub>2</sub>	O	
II-47	H	S	Smp. 174,0°C
II-48	5-Cl	S	
II-49	6-Cl	S	
II-50	7-Cl	S	

- Forts. -

Tabelle 1 (Forts.)

Nr.	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
II-51	8-Cl	S	
II-52	5-F	S	
II-53	6-F	S	
II-54	7-F	S	
II-55	8-F	S	
II-56	5-CH <sub>3</sub>	S	
II-57	6-CH <sub>3</sub>	S	
II-58	7-CH <sub>3</sub>	S	
II-59	8-CH <sub>3</sub>	S	
II-60	5-OCH <sub>3</sub>	S	
II-61	6-OCH <sub>3</sub>	S	
II-62	7-OCH <sub>3</sub>	S	
II-63	8-OCH <sub>3</sub>	S	
II-64	5-CF <sub>3</sub>	S	
II-65	6-CF <sub>3</sub>	S	
II-66	7-CF <sub>3</sub>	S	
II-67	8-CF <sub>3</sub>	S	
II-68	5-NO <sub>2</sub>	S	
II-69	6-NO <sub>2</sub>	S	
II-70	7-NO <sub>2</sub>	S	
II-71	8-NO <sub>2</sub>	S	
II-72	5-CN	S	
II-73	6-CN	S	
II-74	7-CN	S	
II-75	8-CN	S	

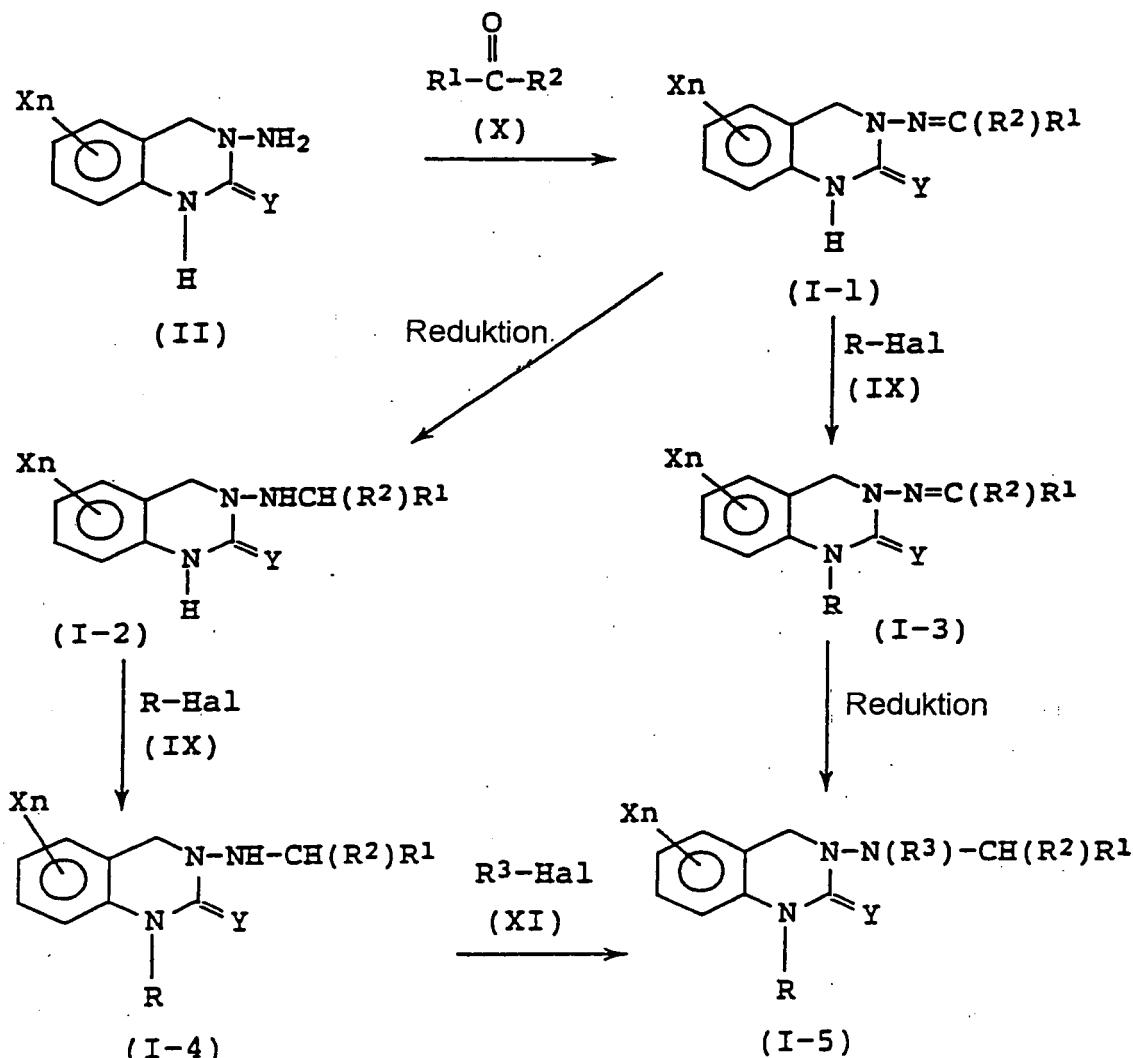
- Forts. -

Tabelle 1 (Forts.)

Nr.	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
II-76	5-COOCH <sub>3</sub>	S	
II-77	6-COOCH <sub>3</sub>	S	
II-78	7-COOCH <sub>3</sub>	S	
II-79	8-COOCH <sub>3</sub>	S	
II-80	5-CONHCH <sub>3</sub>	S	
II-81	6-CONHCH <sub>3</sub>	S	
II-82	7-CONHCH <sub>3</sub>	S	
II-83	8-CONHCH <sub>3</sub>	S	
II-84	5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
II-85	6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
II-86	7-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
II-87	8-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
II-88	6,7-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
II-89	6-OCH <sub>2</sub> O-7	S	
II-90	6,7-Cl <sub>2</sub>	S	
II-91	6,7-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
II-92	6,7-F <sub>2</sub>	S	
II-93	5-OCF <sub>3</sub>	O	
II-94	6-OCF <sub>3</sub>	O	
II-95	7-OCF <sub>3</sub>	O	
II-96	8-OCF <sub>3</sub>	O	
II-97	5-OCF <sub>3</sub>	S	
II-98	6-OCF <sub>3</sub>	S	
II-99	7-OCF <sub>3</sub>	S	
II-100	8-OCF <sub>3</sub>	S	

[0056] Typische Beispiele für das Verfahren zur Herstellung des erfindungsgemäßen Aminochinazolinon(thion)-Derivats der allgemeinen Formel (I) oder eines Salzes davon werden nachstehend schematisch angegeben.

## Herstellungsverfahren 3



worin R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, X, n und Y wie oben angegeben definiert sind, außer dass keines von R und R<sup>3</sup> ein Wasserstoff ist und Hal ein Halogenatom bedeutet.

## 3-1. Allgemeine Formel (II) → allgemeine Formel (I-1)

[0057] Ein Aminochinazolinon(thion)-Derivat der allgemeinen Formel (I-1) kann hergestellt werden durch Umsetzen einer Verbindung der allgemeinen Formel (II) mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (X) in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels und eines Katalysators.

[0058] Bei dieser Reaktion kann die gewünschte Verbindung in ähnlicher Weise wie im Herstellungsverfahren 2-1 beschrieben hergestellt werden.

## 3-2. Allgemeine Formel (I-1) → allgemeine Formel (I-3)

[0059] Ein Aminochinazolinon(thion)-Derivat der allgemeinen Formel (I-3) kann hergestellt werden durch Umsetzen des Aminochinazolinon(thion)-Derivats der allgemeinen Formel (I-1) mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (IX) in Anwesenheit oder Abwesenheit eines inerten Lösungsmittels und einer Base.

[0060] Als in dieser Reaktion einsetzbare inerte Lösungsmittel können beispielsweise die für das Herstellungsverfahren 1 beispielhaft angegebenen inerten Lösungsmittel verwendet werden.

[0061] Als Base kann eine anorganische oder eine organische Base verwendet werden. Zusätzlich zu den beispielhaft im Herstellungsverfahren 2-3 angegebenen organischen Basen können auch Alkoxide, wie CH<sub>3</sub>ONa, C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>ONa, t-C<sub>4</sub>H<sub>9</sub>ONa, CH<sub>3</sub>OK, C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>OK und t-C<sub>4</sub>H<sub>9</sub>OK, und Alkalimetallhydride, wie NaH, verwendet werden. Die Menge an Base kann in geeigneter Weise im Bereich von 1 Mol bis zu überschüssigen Molen pro Mol des Aminochinazolinon(thion)-Derivats der allgemeinen Formel (I-1) gewählt werden.

- [0062] Die Reaktionstemperatur kann im Bereich von 0°C bis zum Siedepunkt des verwendeten inerten Lösungsmittels gewählt werden und liegt vorzugsweise im Bereich von Raumtemperatur bis 70°C.
- [0063] Obwohl die Reaktionszeit beispielsweise in Abhängigkeit von der Größenordnung der Reaktion und/oder der Reaktionstemperatur variiert liegt sie im Bereich von wenigen Minuten bis 48 Stunden.
- [0064] Nach Beendigung der Reaktion wird die die gewünschte Verbindung enthaltende Reaktionsmischung in derselben Weise wie im Herstellungsverfahren 1 behandelt, wodurch die gewünschte Verbindung hergestellt werden kann.

3-3. Allgemeine Formel (I-3) → allgemeine Formel (I-5)

- [0065] Ein Aminochinazolinon(thion)-Derivat der allgemeinen Formel (I-5) kann hergestellt werden durch Umsetzen des Aminochinazolinon(thion)-Derivats der allgemeinen Formel (I-3) mit einem Reduktionsmittel oder durch eine katalytische Reduktion in Anwesenheit oder Abwesenheit eines inerten Lösungsmittels.
- [0066] In dieser Reaktion kann die gewünschte Verbindung in ähnlicher Weise wie im Herstellungsverfahren 2-2 beschrieben hergestellt werden.

3-4. Allgemeine Formel (I-1) → allgemeine Formel (I-2)

- [0067] In dieser Reaktion kann die gewünschte Verbindung in einer ähnlichen Weise wie im Herstellungsverfahren 3-3 beschrieben hergestellt werden.

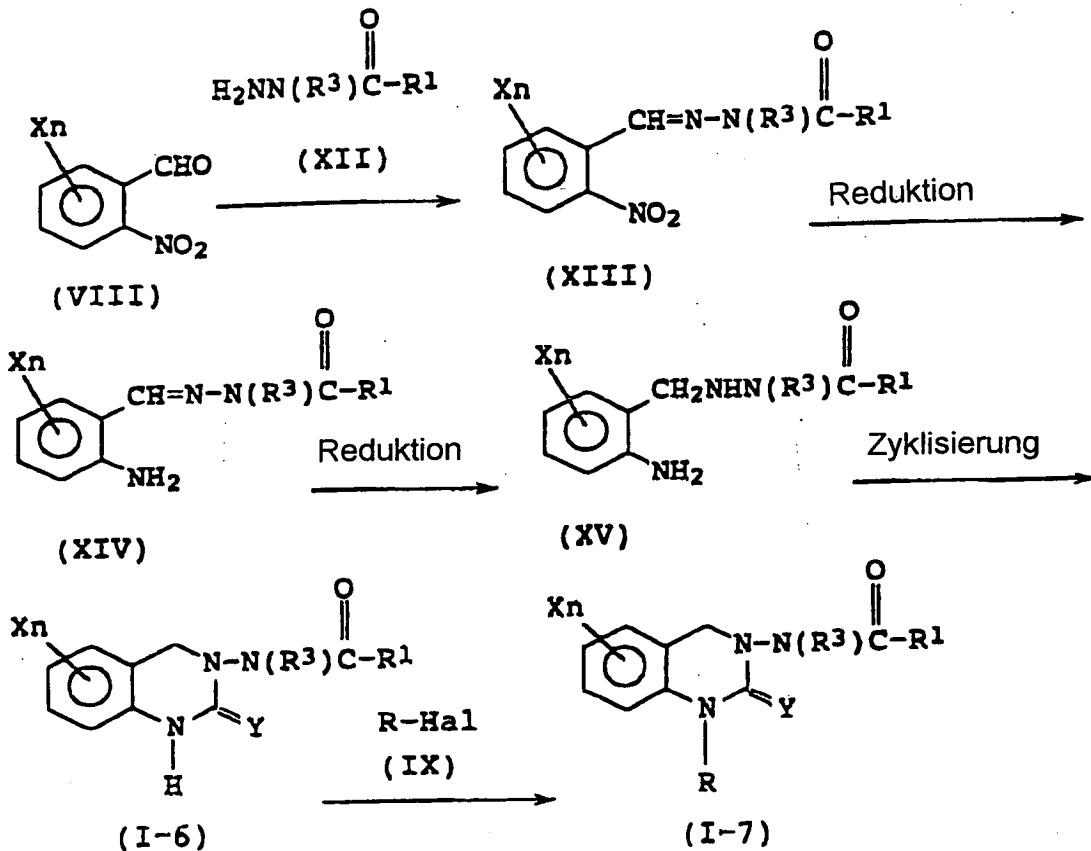
3-5. Allgemeine Formel (I-2) → allgemeine Formel (I-4)

- [0068] In dieser Reaktion kann die gewünschte Verbindung in ähnlicher Weise wie im Herstellungsverfahren 3-2 beschrieben hergestellt werden.

3-6. Allgemeine Formel (I-4) → allgemeine Formel (I-5)

- [0069] Ein Aminochinazolinon(thion)-Derivate der allgemeinen Formel (I-5) kann hergestellt werden durch Umsetzen des Aminochinazolinon(thion)-Derivats der allgemeinen Formel (I-4) mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (XI) in Anwesenheit oder Abwesenheit eines inerten Lösungsmittels und einer Base.

Herstellungsverfahren 4



worin R, R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, X, Y, Hal und n wie oben definiert sind, außer dass R kein Wasserstoffatom ist.

4-1. Allgemeine Formel (VIII) → allgemeine Formel (XIII)

[0070] Eine Verbindung der allgemeinen Formel (XIII) kann hergestellt werden durch Umsetzen einer Verbindung der Formel (VIII) mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (XII) in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels und eines Katalysators.

[0071] In dieser Reaktion kann die gewünschte Verbindung in ähnlicher Weise wie im Herstellungsverfahren 2-1 beschrieben hergestellt werden.

4-2. Allgemeine Formel (XIII) → allgemeine Formel (XIV)

[0072] Eine Verbindung der allgemeinen Formel (XIV) kann hergestellt werden durch Reduzieren der Verbindung der allgemeinen Formel (XIII) mit einem Reduktionsmittel oder durch katalytische Reduktion in Anwesenheit oder Abwesenheit eines inerten Lösungsmittels.

[0073] In dieser Reaktion kann die gewünschte Verbindung in ähnlicher Weise wie im Herstellungsverfahren 2-2 beschrieben hergestellt werden.

4-3. Allgemeine Formel (XIV) → allgemeine Formel (XV)

[0074] Eine Verbindung der allgemeinen Formel (XV) kann hergestellt werden durch Umsetzen der Verbindung der allgemeinen Formel (XIV) mit einem Reduktionsmittel oder durch katalytische Reduktion in Anwesenheit oder Abwesenheit eines inerten Lösungsmittels.

[0075] In dieser Reaktion kann die gewünschte Verbindung in ähnlicher Weise wie im Herstellungsverfahren 2-2 beschrieben hergestellt werden.

4-4. Allgemeine Formel (XV) → allgemeine Formel (I-6)

[0076] Ein Aminochinazolinon(thion)-Derivat der allgemeinen Formel (I-6) kann hergestellt werden durch Umsetzen der Verbindung der allgemeinen Formel (XV) mit 1,1'-Carbonylbis-1H-imidazol (CDI), einem Alkoxy carbonylhalogenid, Phosgen oder Thiophosgen in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels und in Anwesenheit oder Abwesenheit einer Base.

[0077] In dieser Reaktion kann die gewünschte Verbindung in ähnlicher Weise wie im Herstellungsverfahren 2-3 beschrieben hergestellt werden.

4-5. Allgemeine Formel (I-6) → allgemeine Formel (I-7)

[0078] Ein Aminochinazolinon(thion)-Derivat der allgemeinen Formel (I-7) kann hergestellt werden durch Umsetzen des Aminochinazolinon(thion)-Derivats der allgemeinen Formel (I-6) mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (IX) in Anwesenheit oder Abwesenheit eines inerten Lösungsmittels und einer Base.

[0079] In dieser Reaktion kann die gewünschte Verbindung in ähnlicher Weise wie im Herstellungsverfahren 3-2 beschrieben hergestellt werden.

[0080] Typische Beispiele für das erfindungsgemäße Aminochinazolinon(thion)-Derivat der Formel (I) oder Salze davon werden in Tabelle 2 angegeben, sie sollen jedoch den Umfang der vorliegenden Erfindung nicht beschränken.

[0081] Die Abkürzungen in Tabelle 2, Tabelle 4 und Tabelle 6 stehen für die folgenden Substituenten:

Ph: Phenylgruppe,

Q<sub>1</sub>: 2-Pyridylgruppe,

Q<sub>2</sub>: 3-Pyridylgruppe,

Q<sub>3</sub>: 4-Pyridylgruppe,

Q<sub>4</sub>: 2-Pyridyl-N-oxid-Gruppe,

Q<sub>5</sub>: 3-Pyridyl-N-oxid-Gruppe,

Q<sub>6</sub>: 4-Pyridyl-N-oxid-Gruppe,

Q<sub>7</sub>: Thiazol-5-yl-Gruppe,

Q<sub>8</sub>: Furan-2-yl-Gruppe,

Q<sub>9</sub>: 1,3-Dioxolan-2-yl-Gruppe,

Q<sub>10</sub>: Phthalimid-1-yl-Gruppe.

Smp.: Schmelzpunkt

Allgemeine Formel (I')

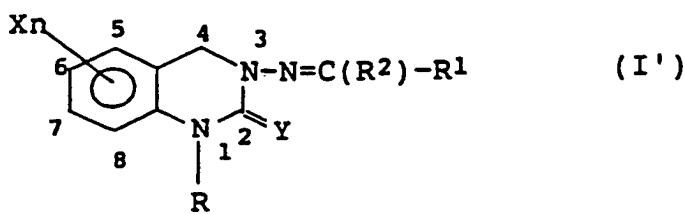


Tabelle 2

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
1	H	Q <sub>1</sub>	H	H	0	Smp. 265, 1-266, 0°C
2	H	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 216, 6-219, 4°C
3	H	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 220, 0°C
4	H	H	H	H	0	Smp. 214, 6-219, 5°C (Hydrochlorid)
5	H	H	CH <sub>3</sub>	H	0	Smp. 214, 6-219, 0°C
6	H	H	CH <sub>3</sub>	H	0	Smp. 212, 4-217, 3°C
7	H	H	CH <sub>3</sub>	H	0	Smp. 241, 5-245, 1°C
8	H	H	H	H	0	
9	H	H	Q <sub>5</sub>	H	0	
10	H	H	Q <sub>6</sub>	H	0	
11	H	H	Q <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
12	H	H	Q <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
13	H	H	Q <sub>6</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
14	H	H	Q <sub>7</sub>	H	H	
15	H	H	2-C <sub>1</sub> -Q <sub>7</sub>	H	H	
16	H	H	5-NQ <sub>2</sub> -Q <sub>8</sub>	H	H	Smp. 265, 1-266, 9°C
17	H	H	6-C <sub>1</sub> -Q <sub>2</sub>	H	H	Smp. 236, 1-240, 0°C
18	H	H	Q <sub>2</sub>	H	S-C <sub>1</sub>	0

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
19	H	Q <sub>2</sub>	H	6-C1	0	Smp. 267, 9-269, 9°C
20	H	Q <sub>2</sub>	H	7-C1	0	Smp. 247, 6-250, 0°C
21	H	Q <sub>2</sub>	H	8-C1	0	
22	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5-C1	0	
23	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-C1	0	
24	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-C1	0	
25	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-C1	0	
26	H	Q <sub>2</sub>	H	5-F	0	Smp. 251, 3-253, 1°C
27	H	Q <sub>2</sub>	H	6-F	0	Smp. 241, 7-243, 8°C
28	H	Q <sub>2</sub>	H	7-F	0	
29	H	Q <sub>2</sub>	H	8-F	0	
30	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	0	
31	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-F	0	
32	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-F	0	
33	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	0	
34	H	Q <sub>2</sub>	H	5-CH <sub>3</sub>	0	
35	H	Q <sub>2</sub>	H	6-CH <sub>3</sub>	0	Smp. 237, 9-240, 2°C
36	H	Q <sub>2</sub>	H	7-CH <sub>3</sub>	0	
37	H	Q <sub>2</sub>	H	8-CH <sub>3</sub>	0	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
38	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	0	
39	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	0	
40	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-CH <sub>3</sub>	0	
41	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-CH <sub>3</sub>	0	
42	H	Q <sub>2</sub>	H	5-OCH <sub>3</sub>	0	
43	H	Q <sub>2</sub>	H	6-OCH <sub>3</sub>	0	
44	H	Q <sub>2</sub>	H	7-OCH <sub>3</sub>	0	
45	H	Q <sub>2</sub>	H	8-OCH <sub>3</sub>	0	Smp. 198, 4-200, 1°C
46	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5-OCH <sub>3</sub>	0	
47	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-OCH <sub>3</sub>	0	
48	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-OCH <sub>3</sub>	0	
49	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-OCH <sub>3</sub>	0	
50	H	Q <sub>2</sub>	H	5-CF <sub>3</sub>	0	
51	H	Q <sub>2</sub>	H	6-CF <sub>3</sub>	0	
52	H	Q <sub>2</sub>	H	7-CF <sub>3</sub>	0	
53	H	Q <sub>2</sub>	H	8-CF <sub>3</sub>	0	
54	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	0	
55	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-CF <sub>3</sub>	0	
56	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-CF <sub>3</sub>	0	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
57	H	Q2	CH <sub>3</sub>	8-CF <sub>3</sub>	0	
58	H	Q2	H	5-NO <sub>2</sub>	0	
59	H	Q2	H	6-NO <sub>2</sub>	0	
60	H	Q2	H	7-NO <sub>2</sub>	0	
61	H	Q2	H	8-NO <sub>2</sub>	0	
62	H	Q2	CH <sub>3</sub>	5-NO <sub>2</sub>	0	
63	H	Q2	CH <sub>3</sub>	6-NO <sub>2</sub>	0	
64	H	Q2	CH <sub>3</sub>	7-NO <sub>2</sub>	0	
65	H	Q2	CH <sub>3</sub>	8-NO <sub>2</sub>	0	
66	H	Q2	H	5-CN	0	
67	H	Q2	H	6-CN	0	
68	H	Q2	H	7-CN	0	
69	H	Q2	H	8-CN	0	
70	H	Q2	CH <sub>3</sub>	5-CN	0	
71	H	Q2	CH <sub>3</sub>	6-CN	0	
72	H	Q2	CH <sub>3</sub>	7-CN	0	
73	H	Q2	CH <sub>3</sub>	8-CN	0	
74	H	Q2	H	5-COOCH <sub>3</sub>	0	
75	H	Q2	H	6-COOCH <sub>3</sub>	0	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
76	H	Q2	H	7-COOCH <sub>3</sub>	0	
77	H	Q2	H	8-COOCH <sub>3</sub>	0	
78	H	Q2	CH <sub>3</sub>	5-COOCH <sub>3</sub>	0	
79	H	Q2	CH <sub>3</sub>	6-COOCH <sub>3</sub>	0	
80	H	Q2	CH <sub>3</sub>	7-COOCH <sub>3</sub>	0	
81	H	Q2	CH <sub>3</sub>	8-COOCH <sub>3</sub>	0	
82	H	Q2	H	5-CONHCH <sub>3</sub>	0	
83	H	Q2	H	6-CONHCH <sub>3</sub>	0	
84	H	Q2	H	7-CONHCH <sub>3</sub>	0	
85	H	Q2	H	8-CONHCH <sub>3</sub>	0	
86	H	Q2	CH <sub>3</sub>	5-CONHCH <sub>3</sub>	0	
87	H	Q2	CH <sub>3</sub>	6-CONHCH <sub>3</sub>	0	
88	H	Q2	CH <sub>3</sub>	7-CONHCH <sub>3</sub>	0	
89	H	Q2	CH <sub>3</sub>	8-CONHCH <sub>3</sub>	0	
90	H	Q2	H	5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	
91	H	Q2	H	6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	
92	H	Q2	H	7-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	
93	H	Q2	H	8-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	
94	H	Q2	CH <sub>3</sub>	5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
95	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	
96	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	
97	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	
98	H	Q <sub>2</sub>	H	6-OCH <sub>2</sub> -7	0	Smp. 272,7°C
99	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-OCH <sub>2</sub> -7	0	
100	H	Q <sub>2</sub>	H	5,6-Cl <sub>2</sub>	0	
101	H	Q <sub>2</sub>	H	6,7-Cl <sub>2</sub>	0	
102	H	Q <sub>2</sub>	H	7,8-Cl <sub>2</sub>	0	
103	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5,6-Cl <sub>2</sub>	0	
104	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6,7-Cl <sub>2</sub>	0	
105	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7,8-Cl <sub>2</sub>	0	
106	H	Q <sub>2</sub>	H	5,6-F <sub>2</sub>	0	
107	H	Q <sub>2</sub>	H	6,7-F <sub>2</sub>	0	
108	H	Q <sub>2</sub>	H	7,8-F <sub>2</sub>	0	
109	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5,6-F <sub>2</sub>	0	
110	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6,7-F <sub>2</sub>	0	
111	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7,8-F <sub>2</sub>	0	
112	H	Q <sub>2</sub>	H	5,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	
113	H	Q <sub>2</sub>	H	6,7-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
114	H	Q2	H	7,8-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	
115	H	Q2	CH <sub>3</sub>	5,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	
116	H	Q2	CH <sub>3</sub>	6,7-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	
117	H	Q2	CH <sub>3</sub>	7,8-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	
118	H	Q1	H	H	S	
119	H	Q2	H	H	S	
120	H	Q2	H	H	S	
121	H	Q3	H	H	S	
122	H	Q1	CH <sub>3</sub>	H	S	
123	H	Q2	CH <sub>3</sub>	H	S	
124	H	Q3	CH <sub>3</sub>	H	S	
125	H	Q4	H	H	S	
126	H	Q5	H	H	S	
127	H	Q6	H	H	S	
128	H	Q4	CH <sub>3</sub>	H	S	
129	H	Q5	CH <sub>3</sub>	H	S	
130	H	Q6	CH <sub>3</sub>	H	S	
131	H	Q7	H	H	S	
132	H	2-C1-Q <sub>7</sub>	H	H	S	
				Smp. 225,1°C		

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
133	H	5-NO <sub>2</sub> -Q <sub>8</sub>	H	H	S	
134	H	6-Cl-Q <sub>2</sub>	H	H	S	
135	H	Q <sub>2</sub>	H	5-Cl	S	
136	H	Q <sub>2</sub>	H	6-Cl	S	
137	H	Q <sub>2</sub>	H	7-Cl	S	
138	H	Q <sub>2</sub>	H	8-Cl	S	
139	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5-Cl	S	
140	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-Cl	S	
141	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-Cl	S	
142	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-Cl	S	
143	H	Q <sub>2</sub>	H	5-F	S	
144	H	Q <sub>2</sub>	H	6-F	S	
145	H	Q <sub>2</sub>	H	7-F	S	
146	H	Q <sub>2</sub>	H	8-F	S	
147	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	S	
148	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-F	S	
149	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-F	S	
150	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	S	
151	H	Q <sub>2</sub>	H	5-CH <sub>3</sub>	S	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
152	H	Q2	H	6-CH <sub>3</sub>	S	
153	H	Q2	H	7-CH <sub>3</sub>	S	
154	H	Q2	H	8-CH <sub>3</sub>	S	
155	H	Q2	CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	S	
156	H	Q2	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	S	
157	H	Q2	CH <sub>3</sub>	7-CH <sub>3</sub>	S	
158	H	Q2	CH <sub>3</sub>	8-CH <sub>3</sub>	S	
159	H	Q2	H	5-OCH <sub>3</sub>	S	
160	H	Q2	H	6-OCH <sub>3</sub>	S	
161	H	Q2	H	7-OCH <sub>3</sub>	S	
162	H	Q2	H	8-OCH <sub>3</sub>	S	
163	H	Q2	CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	S	
164	H	Q2	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	S	
165	H	Q2	CH <sub>3</sub>	7-CH <sub>3</sub>	S	
166	H	Q2	CH <sub>3</sub>	8-CH <sub>3</sub>	S	
167	H	Q2	H	5-CF <sub>3</sub>	S	
168	H	Q2	H	6-CF <sub>3</sub>	S	
169	H	Q2	H	7-CF <sub>3</sub>	S	
170	H	Q2	H	8-CF <sub>3</sub>	S	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
171	H	Q2	CH <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	S	
172	H	Q2	CH <sub>3</sub>	6-CF <sub>3</sub>	S	
173	H	Q2	CH <sub>3</sub>	7-CF <sub>3</sub>	S	
174	H	Q2	CH <sub>3</sub>	8-CF <sub>3</sub>	S	
175	H	Q2	H	5-NO <sub>2</sub>	S	
176	H	Q2	H	6-NO <sub>2</sub>	S	
177	H	Q2	H	7-NO <sub>2</sub>	S	
178	H	Q2	H	8-NO <sub>2</sub>	S	
179	H	Q2	CH <sub>3</sub>	5-NO <sub>2</sub>	S	
180	H	Q2	CH <sub>3</sub>	6-NO <sub>2</sub>	S	
181	H	Q2	CH <sub>3</sub>	7-NO <sub>2</sub>	S	
182	H	Q2	CH <sub>3</sub>	8-NO <sub>2</sub>	S	
183	H	Q2	H	5-CN	S	
184	H	Q2	H	6-CN	S	
185	H	Q2	H	7-CN	S	
186	H	Q2	H	8-CN	S	
187	H	Q2	CH <sub>3</sub>	5-CN	S	
188	H	Q2	CH <sub>3</sub>	6-CN	S	
189	H	Q2	CH <sub>3</sub>	7-CN	S	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
190	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-CN	S	
191	H	Q <sub>2</sub>	H	5-COOCH <sub>3</sub>	S	
192	H	Q <sub>2</sub>	H	6-COOCH <sub>3</sub>	S	
193	H	Q <sub>2</sub>	H	7-COOCH <sub>3</sub>	S	
194	H	Q <sub>2</sub>	H	8-COOCH <sub>3</sub>	S	
195	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5-COOCH <sub>3</sub>	S	
196	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-COOCH <sub>3</sub>	S	
197	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-COOCH <sub>3</sub>	S	
198	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-COOCH <sub>3</sub>	S	
199	H	Q <sub>2</sub>	H	5-CONHCH <sub>3</sub>	S	
200	H	Q <sub>2</sub>	H	6-CONHCH <sub>3</sub>	S	
201	H	Q <sub>2</sub>	H	7-CONHCH <sub>3</sub>	S	
202	H	Q <sub>2</sub>	H	8-CONHCH <sub>3</sub>	S	
203	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5-CONHCH <sub>3</sub>	S	
204	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-CONHCH <sub>3</sub>	S	
205	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-CONHCH <sub>3</sub>	S	
206	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-CONHCH <sub>3</sub>	S	
207	H	Q <sub>2</sub>	H	5-CONHCH <sub>3</sub>	S	
208	H	Q <sub>2</sub>	H	6-CONHCH <sub>3</sub>	S	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
209	H	Q <sub>2</sub>	H	7-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
210	H	Q <sub>2</sub>	H	8-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
211	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
212	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
213	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
214	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
215	H	Q <sub>2</sub>	H	6-OCH <sub>2</sub> O-7	S	
216	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-OCH <sub>2</sub> O-7	S	
217	H	Q <sub>2</sub>	H	5,6-Cl <sub>2</sub>	S	
218	H	Q <sub>2</sub>	H	6,7-Cl <sub>2</sub>	S	
219	H	Q <sub>2</sub>	H	7,8-Cl <sub>2</sub>	S	
220	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5,6-Cl <sub>2</sub>	S	
221	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6,7-Cl <sub>2</sub>	S	
222	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7,8-Cl <sub>2</sub>	S	
223	H	Q <sub>2</sub>	H	5,6-F <sub>2</sub>	S	
224	H	Q <sub>2</sub>	H	6,7-F <sub>2</sub>	S	
225	H	Q <sub>2</sub>	H	7,8-F <sub>2</sub>	S	
226	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5,6-F <sub>2</sub>	S	
227	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6,7-F <sub>2</sub>	S	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
228	H	Q2	CH <sub>3</sub>	7,8-F <sub>2</sub>	S	
229	H	Q2	H	5,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
230	H	Q2	H	6,7-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
231	H	Q2	H	7,8-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
232	H	Q2	CH <sub>3</sub>	5,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
233	H	Q2	CH <sub>3</sub>	6,7-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
234	H	Q2	CH <sub>3</sub>	7,8-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
235	CHO	Q2	H	H	0	Smp. 199°C
236	CH <sub>3</sub>	Q2	H	H	0	Smp. 117°C
237	CH <sub>3</sub>	Q2	H	5-C1	0	
238	CH <sub>3</sub>	Q2	H	6-C1	0	
239	CH <sub>3</sub>	Q2	H	7-C1	0	
240	CH <sub>3</sub>	Q2	H	8-C1	0	
241	CH <sub>3</sub>	Q2	H	5-F	0	
242	CH <sub>3</sub>	Q2	H	6-F	0	
243	CH <sub>3</sub>	Q2	H	7-F	0	
244	CH <sub>3</sub>	Q2	H	8-F	0	
245	CH <sub>3</sub>	Q2	H	6-(OCH <sub>2</sub> O)-7	0	
246	CH <sub>3</sub>	Q2	CH <sub>3</sub>	H	0	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
247	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5-C1	0	
248	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-C1	0	
249	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-C1	0	
250	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-C1	0	
251	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	0	
252	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-F	0	
253	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-F	0	
254	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	0	
255	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-(OCH <sub>2</sub> O)-7	0	
256	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 104°C
257	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	H	5-C1	0	
258	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	H	6-C1	0	
259	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	H	7-C1	0	
260	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	H	8-C1	0	
261	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	H	6-(OCH <sub>2</sub> O)-7	0	
262	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0	
263	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5-C1	0	
264	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-C1	0	
265	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-C1	0	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
266	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-C1	0	Smp. 93°C
267	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-(OCH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub>	0	Smp. 83°C
268	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 79°C
269	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 70°C
270	n-C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 78°C
271	n-CH <sub>12</sub> H <sub>25</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 143°C
272	C1CH <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 105°C
273	C1 <sub>3</sub> CS	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 189°C
274	CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 165°C
275	CH=CCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 137°C
276	PhCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 139°C
277	4-CH <sub>3</sub> O-PhCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 149°C
278	4-CF <sub>3</sub> -PhCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 162°C
279	4-C1-PhCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 145°C
280	3-C1-PhCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 118°C
281	2-C1-PhCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 129°C
282	PhCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	- Forts. -
283	CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	
284	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
285	CH <sub>3</sub> SCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 154 °C Paste
286	CH <sub>3</sub> O-CO	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 98 °C
287	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -O-CO	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. >300 °C
288	HO-COCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 92 °C
289	CH <sub>3</sub> O-COCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 119 °C
290	HOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 104 °C
291	(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 222 °C
292	NCCCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Paste
293	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O-CO	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 75 °C
294	CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 149 °C
295	CH <sub>3</sub> SO <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 175 °C
296	4-Cl-PhSO <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 95 °C
297	PhCH=CHCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 183 °C
298	4-Cl-Ph-OCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 215 °C
299	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	(Hydrochlorid) *
300	Q <sub>9</sub> -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	0	Smp. 121 °C
301	H	Q <sub>1</sub>	H	H	S	Smp. 225, 1 °C
302	H	Q <sub>2</sub>	H	H	S	- Forts.

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
303	H	Q3	H	H	S	
304	CHO	Q2	H	H	S	
305	CH <sub>3</sub>	Q2	H	H	S	
306	CH <sub>3</sub>	Q2	H	5-Cl	S	
307	CH <sub>3</sub>	Q2	H	6-Cl	S	
308	CH <sub>3</sub>	Q2	H	7-Cl	S	
309	CH <sub>3</sub>	Q2	H	8-Cl	S	
310	CH <sub>3</sub>	Q2	H	5-F	S	
311	CH <sub>3</sub>	Q2	H	6-F	S	
312	CH <sub>3</sub>	Q2	H	7-F	S	
313	CH <sub>3</sub>	Q2	H	8-F	S	
314	CH <sub>3</sub>	Q2	H	6-(OCH <sub>2</sub> O)-7	S	
315	CH <sub>3</sub>	Q2	CH <sub>3</sub>	H	S	
316	CH <sub>3</sub>	Q2	CH <sub>3</sub>	5-Cl	S	
317	CH <sub>3</sub>	Q2	CH <sub>3</sub>	6-Cl	S	
318	CH <sub>3</sub>	Q2	CH <sub>3</sub>	7-Cl	S	
319	CH <sub>3</sub>	Q2	CH <sub>3</sub>	8-Cl	S	
320	CH <sub>3</sub>	Q2	CH <sub>3</sub>	5-F	S	
321	CH <sub>3</sub>	Q2	CH <sub>3</sub>	6-F	S	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
322	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-F	S	
323	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	S	
324	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-(OCH <sub>2</sub> O)-7	S	
325	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
326	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	H	5-Cl	S	
327	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	H	6-Cl	S	
328	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	H	7-Cl	S	
329	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	H	8-Cl	S	
330	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	H	6-(OCH <sub>2</sub> O)-7	S	
331	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	S	
332	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	5-Cl	S	
333	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-Cl	S	
334	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	7-Cl	S	
335	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	8-Cl	S	
336	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-(OCH <sub>2</sub> O)-7	S	
337	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
338	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
339	n-C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
340	n-C <sub>12</sub> H <sub>25</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
341	C1CH <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
342	C1 <sub>3</sub> CS	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
343	CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
344	CH=CCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
345	PhCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
346	4-CH <sub>3</sub> O-PhCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
347	4-CF <sub>3</sub> -PhCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
348	4-Cl-PhCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
349	3-Cl-PhCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
350	2-Cl-PhCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
351	PhCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
352	CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
353	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
353	CH <sub>3</sub> SCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
354	CH <sub>3</sub> O-CO	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
355	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O-CO	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
356	HO-COCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
357	CH <sub>3</sub> O-COCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
358	HOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
359	(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub> CCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
360	NCCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
361	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O-CO	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
362	CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
363	CH <sub>3</sub> SO <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
364	4-Cl-PhSO <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
365	PhCH=CHCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
366	4-Cl-Ph-OCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
367	Q <sub>9</sub> -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Q <sub>1</sub>	H	H	S	
368	PhCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Paste
369	p-CH <sub>3</sub> -phCH=CHCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Paste
370	p-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -phCH=CHCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Smp. 156°C
371	6-OCH <sub>2</sub> O-7-Ph-CH=CHCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Paste
372	p-Cl-phCH=CHCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Smp. 98°C
373	p-Br-phCH=CHCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Smp. 138°C
374	p-CF <sub>3</sub> O-phCH=CHCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Smp. 83°C
375	PhC≡CCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Paste
376	p-CF <sub>3</sub> O-PhC≡CCH <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Smp. 215°C
377	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -CO <sub>2</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Smp. 101°C

- Forts. -

Tabelle 2 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	Y	Physikalische Eigenschaft
378	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O-CO	Q <sub>2</sub>	H	S		Smp. 154°C
379	K (salt)	Q <sub>2</sub>	H	S		Smp. 256°C
380	Q <sub>10</sub>	Q <sub>2</sub>	H	S		Smp. 226°C
381	CH <sub>3</sub> CO	Q <sub>2</sub>	H	S		Smp. 153°C
382	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> CO	Q <sub>2</sub>	H	S	Paste	
383	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CO	Q <sub>2</sub>	H	S		Smp. 73°C
384	p-Cl-phCO	Q <sub>2</sub>	H	S		Smp. 153°C
385	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -CO	Q <sub>2</sub>	H	S		Smp. 240°C
386	CH <sub>3</sub> S	Q <sub>2</sub>	H	S		Smp. 182°C
387	ph-S	Q <sub>2</sub>	H	O		

[0082] Tabelle 3 zeigt NMR-Daten der folgenden in Tabelle 2 angegebenen Verbindungen: Verbindungen Nr. 293, 286, 368, 369, 371, 375, 382 und 383.

Tabelle 3

Nr.	$^1\text{H-NMR}$ [ $\text{CDCl}_3/\text{TMS}$ , $\delta$ -Wert (ppm)]
293	1,38 (3H, t), 4,39 (2H, q), 4,87 (2H, s), 7,1-7,43 (4H, m), 7,69 (1H, r.), 8,07-8,14 (1H, m), 8,60 (1H, br.), 8,84 (1H, s), 9,04 (1H, s).
286	3,95 (3H, s), 4,88 (2H, s), 7,18-7,42 (1H, m), 7,72 (1H, br. s), 8,10 (1H, m), 8,61 (1H, m), 8,87 (1H, m), 9,15 (s, 1H, s)
368	2,18 (2H, m), 2,78 (2H, t), 4,01 (2H, t), 4,86 (2H, s), 6,78 (1H, d), 7,05 (1H, t), 7,17-7,38 (8H, m), 8,08 (1H, s), 8,28 (1H, m), 8,60 (1H, m), 8,60 (1H, m), 8,87 (1H, m)
369	2,32 (3H, s), 4,78 (2H, d), 4,95 (2H, s), 6,29 (1H, dt), 6,62 (1H, d), 7,05-7,39 (1H, m), 8,61 (1H, m), 8,88 (1H, m)
371	4,72 (2H, d), 4,91 (2H, s), 5,91 (2H, s), 6,15 (1H, dt), 6,55 (1H, ds), 6,20-7,38 (8H, m), 8,12 (1H, s), 8,26 (1H, m), 8,58 (1H, m), 8,87 (1H, m)
375	4,90 (2H, s), 5,00 (2H, s), 7,07-7,45 (10H, m), 8,20-8,30 (2H, m), 8,61 (1H, m), 8,85 (1H, m)
382	1,23 (3H, t), 2,98 (2H, g), 4,83 (2H, s), 7,22-7,43 (4H, m), 7,80 (1H, m), 8,15 (1H, m), 8,63 (1H, m), 8,83-8,94 (2H, m)
383	0,98 (3H, t), 1,68-1,88 (2H, m), 2,95 (2H, t), 4,82 (2H, s), 7,20-7,41 (4H, m), 7,78 (1H, m), 8,13 (1H, m), 8,62 (1H, m), 8,82-8,93 (2H, m)

Allgemeine Formel (I'')

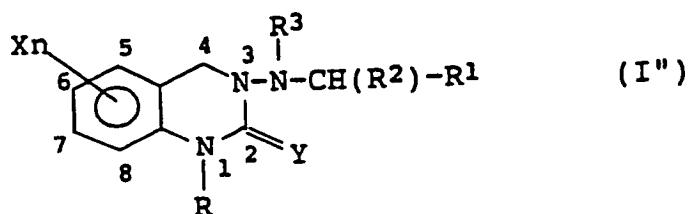


Tabelle 4

Nr.	R	R1	R2	Xn	R3	Y	Physikalische Eigenschaft
388	H	Q1	H	H	H	O	
389	H	Q2	H	H	H	O	Smp. 144,2-150,0°C
390	H	Q3	H	H	H	O	
391	H	Q1	H	5-C1	H	O	
392	H	Q2	H	6-C1	H	O	
393	H	Q3	H	7-C1	H	O	
394	H	Q3	H	8-C1	H	O	
395	H	Q1	H	5-F	H	O	
396	H	Q2	H	6-F	H	O	
397	H	Q3	H	7-F	H	O	
398	H	Q3	H	8-F	H	O	
399	H	Q1	CH <sub>3</sub>	H	H	O	
400	H	Q2	CH <sub>3</sub>	H	H	O	
401	H	Q3	CH <sub>3</sub>	H	H	O	
402	H	Q1	CH <sub>3</sub>	5-C1	H	O	
403	H	Q2	CH <sub>3</sub>	6-C1	H	O	
404	H	Q3	CH <sub>3</sub>	7-C1	H	O	
405	H	Q3	CH <sub>3</sub>	8-C1	H	O	
406	H	Q1	CH <sub>3</sub>	5-F	H	O	

- Forts. -

Tabelle 4 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	R3	Y	Physikalische Eigenschaft
407	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-F	H	0	
408	H	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7-F	H	0	
409	H	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	H	0	
410	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	H	H	H	0	
411	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	H	0	Paste
412	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	H	0	Hydrochlorid
413	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	H	H	H	0	
414	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	H	6-C1	H	0	
415	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	H	7-C1	H	0	
416	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	H	8-C1	H	0	
417	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	H	5-F	H	0	
418	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	H	6-F	H	0	
419	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	H	7-F	H	0	
420	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	H	8-F	H	0	
421	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	0	
422	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	CH <sub>3</sub>	5-C1	H	0	
423	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-C1	H	0	
424	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7-C1	H	0	
425	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-C1	H	0	

- Forts. -

Tabelle 4 (Forts.)

Nr.	R	R1	R2	Xn	R3	Y	Physikalische Eigenschaft
426	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	H	O	
427	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-F	H	O	
428	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7-F	H	O	
429	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	H	O	
430	H	Q <sub>1</sub>	H	H	H	S	
431	H	Q <sub>2</sub>	H	H	H	S	
432	H	Q <sub>3</sub>	H	H	H	S	
433	H	Q <sub>1</sub>	H	H	H	S	
434	H	Q <sub>2</sub>	H	H	H	S	
435	H	Q <sub>3</sub>	H	H	H	S	
436	H	Q <sub>3</sub>	H	H	H	S	
437	H	Q <sub>1</sub>	H	H	H	S	
438	H	Q <sub>2</sub>	H	H	H	S	
439	H	Q <sub>3</sub>	H	H	H	S	
440	H	Q <sub>3</sub>	H	H	H	S	
441	H	Q <sub>1</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	S	
442	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	S	
443	H	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	S	
444	H	Q <sub>1</sub>	CH <sub>3</sub>	5-C1	H	S	

- Forts. -

Tabelle 4 (Forts.)

Nr.	R	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	Xn	R <sub>3</sub>	Y	Physikalische Eigenschaft
445	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-C1	H	S	
446	H	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7-C1	H	S	
447	H	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-C1	H	S	
448	H	Q <sub>1</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	H	S	
449	H	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-F	H	S	
450	H	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7-F	H	S	
451	H	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	H	S	
452	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	H	H	H	S	
453	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	H	S	
454	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	H	S	
455	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	H	5-C1	H	S	
456	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	H	6-C1	H	S	
457	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	H	7-C1	H	S	
458	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	H	8-C1	H	S	
459	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	H	5-F	H	S	
460	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	H	6-F	H	S	
461	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	H	7-F	H	S	
462	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	H	8-F	H	S	
463	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	S	

- Forts. -

Tabelle 4 (Forts.)

Nr.	R	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Xn	R <sup>3</sup>	Y	Physikalische Eigenschaft
464	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	CH <sub>3</sub>	5-C1	H	S	
465	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-C1	H	S	
466	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7-C1	H	S	
467	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-C1	H	S	
468	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	H	S	
469	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	6-F	H	S	
470	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7-F	H	S	
471	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	H	S	
472	H	Q <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub> CO	O	Smp. 72°C Paste	
473	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub> CO	O	Smp. 104°C Paste	
474	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> OCO	Q <sub>2</sub>	H	HCO	O		
475	H	Q <sub>2</sub>	H	HCO	O	Paste	
476	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> OCO	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Paste	
477	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> OCO	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Paste	
478	CH <sub>3</sub> CO	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Paste	
479	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> CO	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Smp. 59°C	
480	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> CO	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Smp. 100°C Paste	
481	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> OCO	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Paste	
482	CH <sub>3</sub> OCO	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Paste	

- Forts. -

Tabelle 4 (Forts.)

Nr.	R	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	Xn	R3	Y	Physikalische Eigenschaft
483	H	Q <sub>2</sub>	H	H	CF <sub>3</sub> CO	0	Smp. 186 °C
484	phCO	Q <sub>2</sub>	H	H	H	0	Smp. 133 °C
485	H	Q <sub>2</sub>	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> SCS	0	Smp. 181 °C
486	CH <sub>3</sub> CO	Q <sub>2</sub>	H	H	CF <sub>3</sub> CO	0	Paste
487	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> OCO	Q <sub>2</sub>	H	H	CF <sub>3</sub> CO	0	Paste
488	p-Cl- phCO	Q <sub>2</sub>	H	H	H	0	Paste
489	m-Cl- phCO	Q <sub>2</sub>	H	H	H	0	Smp. 181 °C
490	n-C <sub>1</sub> H <sub>7</sub> OCO	Q <sub>2</sub>	H	H	H	0	Paste
491	CH <sub>3</sub> CO	Q <sub>2</sub>	H	H	H	0	Paste
491,1	3-CH <sub>3</sub> O-ph-CO	Q <sub>2</sub>	H	H	H	0	Paste
491,2	4-CH <sub>3</sub> O-ph-CO	Q <sub>2</sub>	H	H	H	0	Paste
491,3	2,6-F <sub>2</sub> -ph-CO	Q <sub>2</sub>	H	H	H	0	Paste
491,4	4-CF <sub>3</sub> -ph-CO	Q <sub>2</sub>	H	H	H	0	Smp. 127 °C
491,5	3-CH <sub>3</sub> -ph-CO	Q <sub>2</sub>	H	H	H	0	Smp. 140 °C
491,6	3-F-ph-CO	Q <sub>2</sub>	H	H	H	0	Smp. 153 °C

[0083] Tabelle 5 zeigt NMR-Daten für die folgenden in Tabelle 4 angegebenen Verbindungen: Verbindungen Nr. 411, 473, 475, 476, 477, 480, 481, 482, 486, 487, 488, 490, 491., und 491,1 bis 491,3.

Tabelle 5

Nr.	<sup>1</sup> H-NMR [ CDCl <sub>3</sub> /TMS, δ-Wert (ppm)]
411	3,33 (3H, s), 4,01 (2H, br.), 4,36 (2H, s), 5,21 (1H, br. t), 6,84 (1H, br.), 6,92-7,03 (2H, m), 7,19-7,32 (2H, m), 7,68-7,76 (1H, m), 8,51 (1H, br.), 8,62 (1H, s).
473	2,06 (3H, s), 3,32 (3H, s), 4,22-5,40 (4H, m), 6,85-7,73 (6H, m), 8,45-8,56 (2H, m)
475	4,32-5,24 (4H, m), 6,72-7,31 (6H, m), 8,33 (1H, s), 8,47 (1H, bs) 8,56-8,65 (2H, m)
476	1,38 (6H, d), 4,02 (2H, d), 4,25 (2H, s), 5,15 (1H, m), 5,33 (1H, t), 6,81-7,28 (5H, m), 7,53 (1H, m), 8,48-8,50 (2H, m)
477	0,95 (3H, t), 1,42 (2H, m), 1,71 (2H, m), 4,01 (2H, d), 4,22 (2H, s), 4,28 (2H, t), 5,31 (1H, t), 6,85-7,58 (6H, m), 8,43-8,50 (2H, m)
480	0,99 (3H, t), 1,69-1,78 (2H, m), 2,88 (2H, t), 4,03 (2H, d), 4,25 (2H, d), 5,30 (2H, t), 6,90-7,72 (6H, m), 8,50-8,52 (2H, m)
481	1,58 (9H, s), 4,04 (2H, d), 4,26 (2H, s), 5,28 (1H, t), 6,89-7,62 (6H, m), 8,50-8,55 (2H, m)
482	3,92 (3H, s), 4,05 (2H, d), 4,26 (2H, s), 5,29 (1H, t), 6,90-7,76 (6H, m), 8,49-8,56 (2H, m)
486	2,50 (3H, s), 4,20-5,18 (4H, m), 6,88-7,98 (6H, m), 8,50-8,65 (2H, m).
487	1,41 (3H, t), 3,91-5,35 (6H, m), 6,80 (1H, d), 7,12-7,68 (5H, m), 8,47-8,58 (2H, m)

- Forts. -

Tabelle 5: (Forts.)

Nr.	$^1\text{H-NMR}$ [ $\text{CDCl}_3/\text{TMS}$ , $\delta$ -Wert (ppm)]
488	4,01 (2H, d), 4,52 (2H, s), 5,22 (1H, t), 7,03-7,85 (10H, m), 8,53-8,60 (2H, m)
490	1,01 (3H, t), 1,75 (2H, m), 4,03 (2H, d), 4,20-4,35 (4H, m), 5,30 (1H, t), 6,85-7,32 (4H, m), 7,55-7,68 (2H, m), 8,45-8,53 (2H, m)
491	2,35 (5H, s), 4,21 (2H, s), 4,48 (2H, s), 7,15-7,35 (3H, m), 7,56 (1H, d), 8,01 (1H, m), 8,55 (1H, m), 8,82-8,92 (2H, m)
491,1	3,86 (s, 3H), 4,01 (d, 2H), 4,50 (s, 2H), 5,23 (t, 1H), 6,95-7,35 (m, 8H), 7,61-7,73 (m, 2H), 8,45-8,59 (m, 2H)
491,2	3,87 (s, 3H), 4,04 (d, 2H), 4,53 (s, 2H), 5,22 (t, 1H), 6,93-7,30 (m, 7H), 7,65-7,85 (m, 3H), 8,50-8,60 (m, 2H)
491,3	3,93 (d, 2H), 4,32 (s, 2H), 5,10 (t, 1H), 6,92-7,55 (m, 8H), 8,03 (d, 1H), 8,42-8,55 (m, 2H).

Allgemeine Formel (I'')

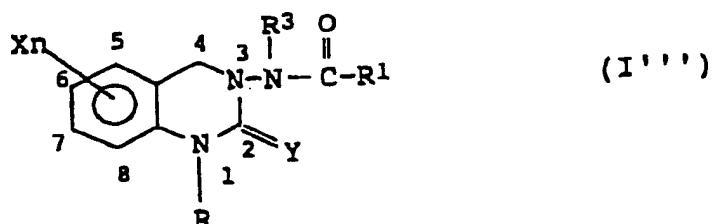


Tabelle 6

No.	R	R <sup>1</sup>	Xn	R <sup>3</sup>	Y	Physikalische Eigenschaft
492	H	Q <sub>1</sub>	H	H	O	
493	H	Q <sub>2</sub>	H	H	O	Smp. 221-224, 0°C
494	H	Q <sub>3</sub>	H	H	O	
495	H	Q <sub>1</sub>	5-Cl	H	O	
496	H	Q <sub>2</sub>	6-Cl	H	O	
497	H	Q <sub>3</sub>	7-Cl	H	O	
498	H	Q <sub>3</sub>	8-Cl	H	O	
499	H	Q <sub>1</sub>	5-F	H	O	
500	H	Q <sub>2</sub>	6-F	H	O	
501	H	Q <sub>3</sub>	7-F	H	O	
502	H	Q <sub>3</sub>	8-F	H	O	
503	H	Q <sub>1</sub>	H	H	O	
504	H	Q <sub>2</sub>	H	H	O	
505	H	Q <sub>3</sub>	H	H	O	
506	H	Q <sub>1</sub>	5-Cl	H	O	
507	H	Q <sub>2</sub>	6-Cl	H	O	
508	H	Q <sub>3</sub>	7-Cl	H	O	
509	H	Q <sub>3</sub>	8-Cl	H	O	
510	H	Q <sub>1</sub>	5-F	H	O	
511	H	Q <sub>2</sub>	6-F	H	O	
512	H	Q <sub>3</sub>	7-F	H	O	
513	H	Q <sub>3</sub>	8-F	H	O	
514	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	H	H	O	
515	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	O	
516	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	O	

- Forts. -

Tabelle 6 (Forts.)

Nr.	R	R <sup>1</sup>	Xn	R <sup>3</sup>	Y	Physikalische Eigenschaft
517	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	5-Cl	H	O	
518	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	6-Cl	H	O	
519	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	7-Cl	H	O	
520	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	8-Cl	H	O	
521	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	5-F	H	O	
522	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	6-F	H	O	
523	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	7-F	H	O	
524	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	8-F	H	O	
525	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	H	H	O	
526	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	5-Cl	H	O	
527	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	6-Cl	H	O	
528	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	7-Cl	H	O	
529	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	8-Cl	H	O	
530	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	5-F	H	O	
531	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	6-F	H	O	
532	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	7-F	H	O	
533	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	8-F	H	O	
534	H	Q <sub>1</sub>	H	H	S	
535	H	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
536	H	Q <sub>3</sub>	H	H	S	
537	H	Q <sub>1</sub>	5-Cl	H	S	
538	H	Q <sub>2</sub>	6-Cl	H	S	
539	H	Q <sub>3</sub>	7-Cl	H	S	
540	H	Q <sub>3</sub>	8-Cl	H	S	
541	H	Q <sub>1</sub>	5-F	H	S	

- Forts. -

Tabelle 6 (Forts.)

Nr.	R	R <sup>1</sup>	Xn	R <sup>3</sup>	Y	Physikalische Eigenschaft
542	H	Q <sub>2</sub>	6-F	H	S	
543	H	Q <sub>3</sub>	7-F	H	S	
544	H	Q <sub>3</sub>	8-F	H	S	
545	H	Q <sub>1</sub>	H	H	S	
546	H	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
547	H	Q <sub>3</sub>	H	H	S	
548	H	Q <sub>1</sub>	5-Cl	H	S	
549	H	Q <sub>2</sub>	6-Cl	H	S	
550	H	Q <sub>3</sub>	7-Cl	H	S	
551	H	Q <sub>3</sub>	8-Cl	H	S	
552	H	Q <sub>1</sub>	5-F	H	S	
553	H	Q <sub>2</sub>	6-F	H	S	
554	H	Q <sub>3</sub>	7-F	H	S	
555	H	Q <sub>3</sub>	8-F	H	S	
556	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	H	H	S	
557	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
558	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	H	H	S	
559	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	5-Cl	H	S	
560	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	6-Cl	H	S	
561	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	7-Cl	H	S	
562	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	8-Cl	H	S	
563	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	5-F	H	S	
564	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	6-F	H	S	
565	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	7-F	H	S	
566	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	8-F	H	S	

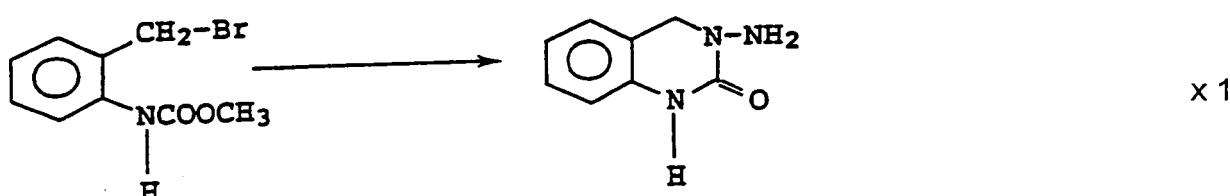
- Forts. -

Tabelle 6 (Forts.)

Nr.	R	R <sup>1</sup>	Xn	R <sup>3</sup>	Y	Physikalische Eigenschaft
567	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	H	H	S	
568	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	5-Cl	H	S	
569	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	6-Cl	H	S	
570	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	7-Cl	H	S	
571	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	8-Cl	H	S	
572	CH <sub>3</sub>	Q <sub>1</sub>	5-F	H	S	
573	CH <sub>3</sub>	Q <sub>2</sub>	6-F	H	S	
574	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	7-F	H	S	
575	CH <sub>3</sub>	Q <sub>3</sub>	8-F	H	S	

[0084] Typische Beispiele der vorliegenden Erfindung werden nachstehend beschrieben, sie sollen aber den Umfang der Erfindung nicht beschränken.

Beispiel 1  
Herstellung von 3-Amino-3,4-dihydro-2(1H)-chinazolinon (Verbindung Nr. II-1)



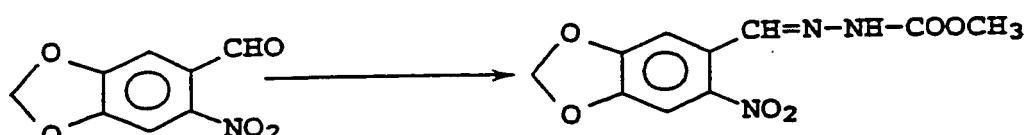
[0085] In 20 ml Methanol wurden 2,44 g (0,01 Mol) Methyl-2-brommethylphenylcarbamat gelöst. Danach wurden 5 g (0,1 Mol) Hydrazinhydrat zu der Lösung gegeben und die Reaktion wurde unter Erwärmen unter Rückfluss 3 Stunden lang durchgeführt.

[0086] Nach Beendigung der Reaktion wurden das überschüssige Hydrazinhydrat und das Lösungsmittel von der die gewünschte Verbindung enthaltenden Reaktionslösung durch Filtration unter reduziertem Druck abgetrennt, um ein Rohprodukt zu erhalten. Das erhaltene Rohprodukt wurde aus 95% Methanol umkristallisiert, um 1,55 g der gewünschten Verbindung zu erhalten.

[0087] Physikalische Eigenschaft: Smp. 178,4–183,5°C.

[0088] Ausbeute: 95%.

Beispiel 2  
2-1. Herstellung von Methyl-2-(4,5-methylenedioxy-2-nitrophenylmethylene)carbazat



[0089] Zu 20 ml Methanol wurden 3,9 g (0,02 Mol) 6-Nitropiperonal, Methylcarbaminsäure und ein Tropfen Schwefelsäure gegeben und die Reaktion wurde unter Erwärmen unter Rückfluss 3 Stunden lang durchgeführt.

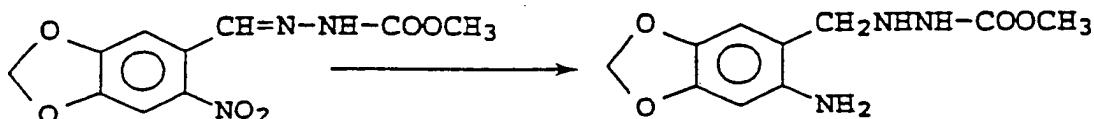
[0090] Nach Beendigung der Reaktion wurde die Reaktionsmischung auf Raumtemperatur abkühlen gelassen und die ausgefallenen Kristalle wurden durch Filtration gesammelt, wodurch 5,1 g der gewünschten Ver-

bindung erhalten wurden.

[0091]  $^1\text{H-NMR}$  [CDCl<sub>3</sub>/TMS,  $\delta$ -Werte (ppm)] 3,80 (3H, s.), 5,8 (2H, s.), 6,3 (1H, s.), 6,5 (1H, s.), 7,7 (1H, br. s.), 7,8 (1H, br. s.).

Ausbeute: 95%.

#### 2-2. Herstellung von 1-ethyl-2-(2-amino-4,5-methylenedioxyphenyl)methycarbazat



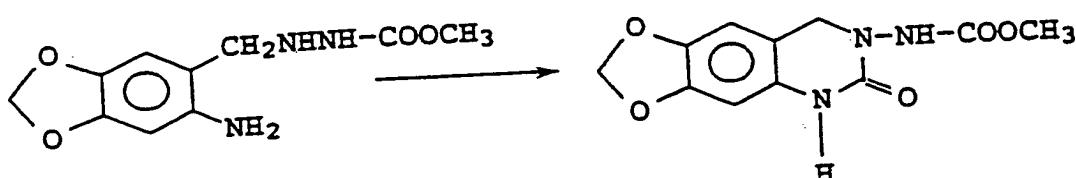
[0092] Zu 100 ml Methanol wurden 4,0 g (0,015 Mol) des in 2-1 erhaltenen Methyl-2-(4,5-methylenedioxy-2-nitrophenyl)methylenecarbazats und 0,4 g 5%iges Palladium-Kohlenstoff gegeben und die Hydrierung wurde bei 29,4 bis 39,2 Pa (3 bis 4 kg/m<sup>2</sup>) durchgeführt.

[0093] Nach der Absorption einer theoretischen Menge an Wasserstoff wurde der Katalysator aus der Reaktionsmischung durch Filtration abgetrennt und das Lösungsmittel unter reduziertem Druck abdestilliert, wodurch 3,6 g der gewünschten Verbindung erhalten wurden.

[0094]  $^1\text{H-NMR}$  [CDCl<sub>3</sub>/TMS,  $\delta$ -Werte (ppm)] 3,73 (3H, s.), 3,90 (2H, s.), 3,6-4,2 (3H, br.), 5,84 (2H, s.), 6,27 (1H, s.), 6,57 (1H, s.), 6,3 (1H, br.).

[0095] Ausbeute: quantitativ.

#### 2-3. Herstellung von 3-Methoxycarbonylamino-6,7-methylenedioxy-3,4-dihydro-2(1H)-chinazolin



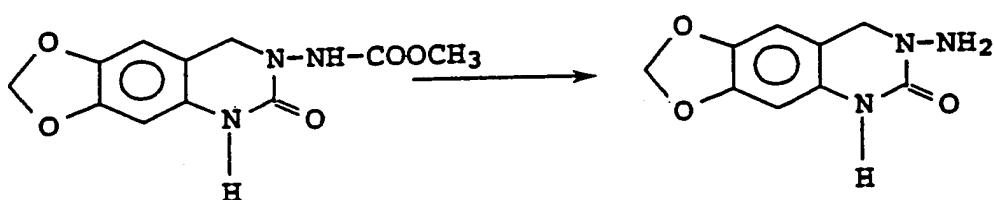
[0096] In 20 ml Tetrahydrofuran wurden 3,6 g (0,015 Mol) des in 2-2 erhaltenen Methyl-2-(2-amino-4,5-methylenedioxyphenyl)methylenecarbazats und 2,6 g (0,0165 Mol) 1,1'-Carbonyl-bis-1H-imidazol gelöst und die Reaktion wurde bei Raumtemperatur 3 Stunden lang durchgeführt.

[0097] Nach Beendigung der Reaktion wurde die Reaktionslösung in 20 ml Wasser gegossen und die gewünschte Verbindung wurde mit Ethylacetat extrahiert. Die extrahierte Lösung wurde mit Wasser und einer gesättigten wässrigen Natriumchloridlösung gewaschen, über wasserfreiem Magnesiumsulfat getrocknet und dann unter reduziertem Druck destilliert, um das Lösungsmittel abzutrennen, wodurch 3,6 g der gewünschten Verbindung erhalten wurden.

[0098]  $^1\text{H-NMR}$  [CDCl<sub>3</sub>/TMS,  $\delta$ -Werte (ppm)] 3,7 (3H, s.), 4,37 (2H, s.), 5,93 (2H, s.), 6,0 (1H, s.), 6,6 (1H, s.), 7,4 (1H, s.), 7,7 (1H, s.).

[0099] Ausbeute: 90%.

#### 2-4. Herstellung von 3-Amino-6,7-methylenedioxy-3,4-dihydro-2(1H)-chinazolinon (Verbindung Nr. II-43)



[0100] In 20 ml Methanol wurden 2,65 g (0,01 Mol) des in 2-3 erhaltenen 3-Methoxycarbonylamino-6,7-methylenedioxy-3,4-dihydro-2(1H)-chinazolins gelöst, gefolgt von der Zugabe von 4 ml einer 20%igen wässrigen Natriumhydroxidlösung. Die Reaktion wurde unter Erwärmen unter Rückfluss 3 Stunden lang durchgeführt.

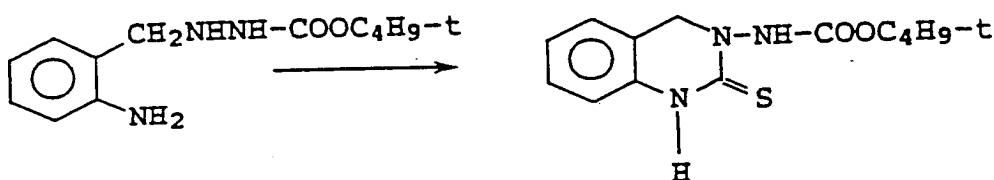
[0101] Nach Beendigung der Reaktion wurde das Lösungsmittel unter reduziertem Druck abdestilliert und Wasser wurde zu dem Rückstand gegeben, um Kristalle auszufällen. Die Kristalle wurden durch Filtration gesammelt und das so erhaltene Rohprodukt wurde aus 95% Methanol umkristallisiert, wodurch 1,3 g der gewünschten Verbindung erhalten wurden.

[0102] Physikalische Eigenschaft: Smp. 211,0°C.

[0103] Ausbeute: 62%.

## Beispiel 3

## 3-1. Herstellung von 3-t-Butoxycarbonylamino-3,4-dihydro-2(1H)-chinazololithion

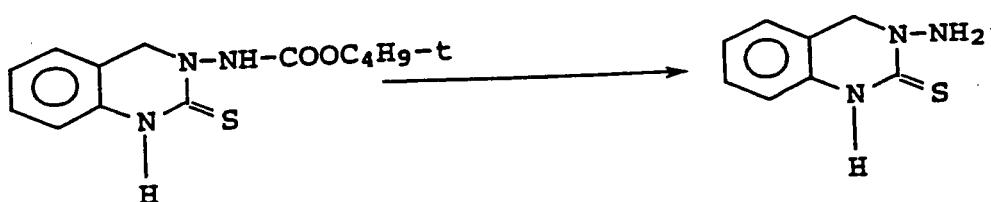


[0104] In 20 ml Ether wurden 1,38 g (5 mMol) des in ähnlicher Weise wie in Beispiel 2, 2-1 und 2-2 beschriebenen erhaltenen t-Butyl-2-(2-aminophenylmethyl)carbazats und 1,11 g (11,0 mMol) Triethylamin gelöst, und die Lösung wurde auf -20°C gekühlt. Danach wurden tropfenweise 1,54 g (5,25 mMol) Thiophosgen über einen Zeitraum von 30 Minuten zu der Lösung gegeben. Nach Beendigung der tropfenweisen Zugabe wurde die Reaktionslösung auf Raumtemperatur gebracht und das ausgefällte Salz abfiltriert. Das Filtrat wurde mit Wasser und einer gesättigten wässrigen Natriumchloridlösung gewaschen, über wasserfreiem Magnesiumsulfat getrocknet und dann unter reduziertem Druck destilliert, um das Lösungsmittel abzutrennen. Der erhaltene Rückstand wurde aus Ethylacetat-Ether umkristallisiert um 0,5 g der gewünschten Verbindung zu erhalten.

[0105]  $^1\text{H-NMR}$  [ $\text{CDCl}_3/\text{TMS}$ ,  $\delta$ -Werte (ppm)] 1,52 (9H, s.), 4,87 (2H, s.), 6,7 (1H, d.), 7,02-7,24 (4H, m.), 8,15 (1H, br. s.).

Ausbeute: 35,8 %.

## 3-2. Herstellung von 3-Amino-3,4-dihydro-2(1H)-chinazololithion (Verbindung Nr. II-47)



[0106] Zu 2 ml Trifluoressigsäure wurden 0,5 g (1,8 mMol) des in 3-1 erhaltenen 3-t-Butoxycarbonylamino-3,4-dihydro-2(1H)-chinazololithions gegeben und die Reaktion wurde bei Raumtemperatur 3 Stunden lang durchgeführt.

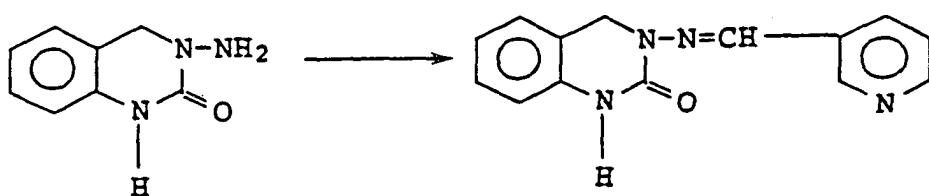
[0107] Nach Beendigung der Reaktion wurden 10 ml Ethanol zu der Reaktionslösung gegeben und das Lösungsmittel wurde unter reduziertem Druck abgetrennt. Der erhaltene Rückstand wurde aus Methanol umkristallisiert um 0,35 g der gewünschten Verbindung zu erhalten.

[0108] Physikalische Eigenschaft: Smp. 174,0°C.

[0109] Ausbeute: 93,1%.

## Beispiel 4

## 3-(3-Pyridylmethyleneamino)-3,4-dihydro-2(1 H)-chinazolinon (Verbindung Nr. 2)



[0110] Zu 10 ml Methanol wurden 0,4 g (2,5 mMol) 3-Amino-3,4-dihydro-2(1H)-chinazolin, 0,27 g (2,5 mMol) Nicotinaldehyd und ein Tropfen Schwefelsäure gegeben und die Reaktion wurde unter Erwärmen unter Rückfluss 3 Stunden lang durchgeführt.

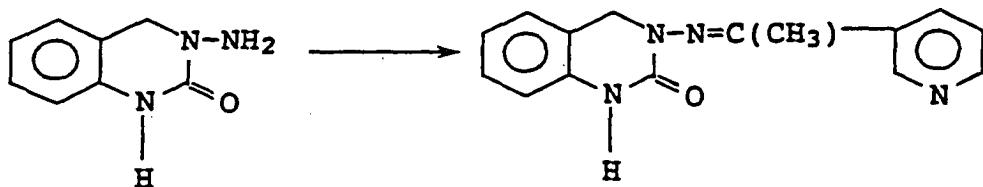
[0111] Nach Beendigung der Reaktion wurden die aus der Reaktionslösung ausgefällten Kristalle durch Filtration gesammelt und getrocknet, um 0,58 g der gewünschten Verbindung zu erhalten.

[0112] Physikalische Eigenschaft: Smp. 216,6–219,4°C.

[0113] Ausbeute: 92%.

## Beispiel 5

3-[1-(3-Pyridylethylidenamino)-3,4-dihydro-2(1H)-chinazolinon (Verbindung Nr. 6)



[0114] Zu 10 ml Methanol wurden 0,4 g (2,5 mMol) 3-Amino-3,4-dihydro-2(1 H)-chinazolinon, 0,31 g (2,5 mMol) 3-Acetylpyridin und ein Tropfen Schwefelsäure gegeben und die Reaktion wurde unter Erwärmen unter Rückfluss 3 Stunden lang durchgeführt.

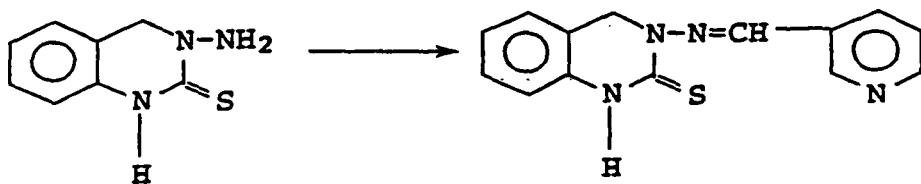
[0115] Nach Beendigung der Reaktion wurden die aus der Reaktionslösung ausgefällten Kristalle durch Filtration gesammelt und getrocknet, um 0,6 g der gewünschten Verbindung zu erhalten.

[0116] Physikalische Eigenschaft: Smp. 212,4–217,3°C.

[0117] Ausbeute: 90%.

## Beispiel 6

3-(3-Pyridylmethylidenamino)-3,4-dihydro-2(1 H)-chinazololithion (Verbindung Nr. 120)



[0118] Zu 10 ml Methanol wurden 0,15 g (1,4 mMol) 3-Amino-3,4-dihydro-2(1 H)-chinazololithion, 0,15 g (1,4 mMol) Nicotinaldehyd und ein Tropfen Schwefelsäure gegeben, und die Reaktion wurde unter Erwärmen unter Rückfluss 3 Stunden lang durchgeführt.

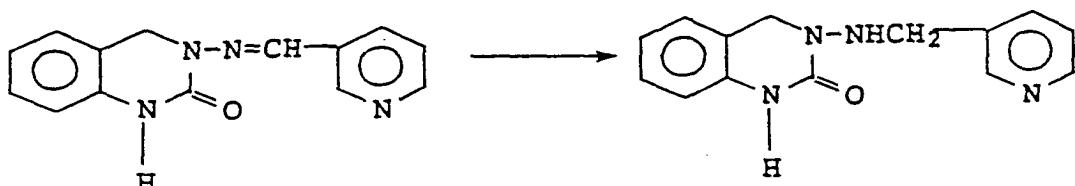
[0119] Nach Beendigung der Reaktion wurden die aus der Reaktionslösung ausgefällten Kristalle durch Filtration gesammelt und getrocknet, um 0,35 g der gewünschten Verbindung zu erhalten.

[0120] Physikalische Eigenschaft: Smp. 225,1°C.

[0121] Ausbeute: 94,5%.

## Beispiel 7

3-(3-Pyridylmethylamino)-3,4-dihydro-2(1 H)-chinazolinon (Verbindung Nr. 409)



[0122] Zu 50 ml Essigsäure wurden 1,26 g (5 mMol) 3-(3-Pyridylmethylidenamino)-3,4-dihydro-2(1H)-chinazolinon und 0,2 g 5% Palladium-Kohlenstoff gegeben, und die Hydrierung wurde bei 3 bis 4 kg/m<sup>2</sup> durchgeführt.

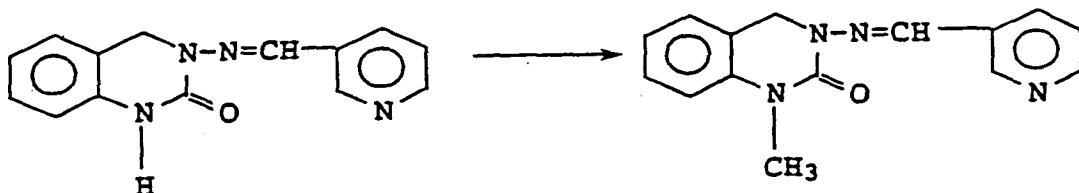
[0123] Nach Absorption einer theoretischen Menge an Wasserstoff wurde der Katalysator aus der Reaktionsmischung durch Filtration abgetrennt und das Lösungsmittel unter reduziertem Druck abdestilliert. Eine 20%ige wässrige Natriumhydroxidlösung wurde zu dem Rückstand gegeben und die gewünschte Verbindung wurde mit Ethylacetat (20 ml × 3) extrahiert. Die extrahierte Lösung wurde mit Wasser und einer gesättigten wässrigen Natriumchloridlösung gewaschen, über wasserfreiem Magnesiumsulfat getrocknet und dann unter reduziertem Druck destilliert, um das Lösungsmittel abzutrennen. Das so erhaltene Rohprodukt wurde aus Ethylacetat-Methanol umkristallisiert, um 1,14 g der gewünschten Verbindung zu erhalten.

[0124] Physikalische Eigenschaft: Smp. 144,2–150,0°C.

[0125] Ausbeute: 90%.

## Beispiel 8

1-Methyl-3-(3-pyridylmethylidenamino)-3,4-dihydro-2(1H)-chinazolinon (Verbindung Nr. 236)



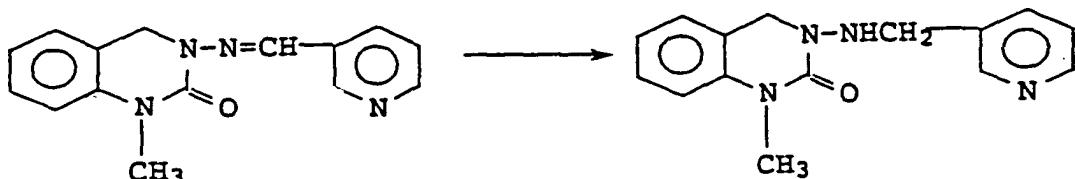
[0126] In 20 ml Dimethylformamid wurden 1,26 g (5 mMol) 3-(3-Pyridylmethylidenamino)-3,4-dihydro-2(1H)-chinazolinon gelöst. Danach wurden 0,21 g Natriumhydrid (62,4%) zu der Lösung gegeben und die Reaktion wurde bei Raumtemperatur 30 Minuten lang durchgeführt. Anschließend wurden 0,85 g (6 mMol) Methyliodid zugegeben und die erhaltene Mischung wurde 3 Stunden lang umgesetzt.

[0127] Nach Beendigung der Reaktion wurde die Reaktionsmischung in Eiswasser gegossen und die gewünschte Verbindung mit Ethylacetat (20 ml × 3) extrahiert. Die extrahierte Lösung wurde mit Wasser und einer gesättigten wässrigen Natriumchloridlösung gewaschen, über wasserfreiem Magnesiumsulfat getrocknet und dann unter reduziertem Druck destilliert, um das Lösungsmittel abzutrennen. Das so erhaltene Rohprodukt wurde in einer Säulenchromatografie über Silicagel gereinigt um 0,67 g der gewünschten Verbindung zu erhalten.

[0128] Physikalische Eigenschaft: Smp. 117°C.

[0129] Ausbeute: 50%.

## Beispiel 9 1-Methyl-3-(3-pyridylmethylamino)-3,4-dihydro-2(1 H)-chinazolinon (Verbindung Nr. 411)



[0130] In 10 ml einer 5 %igen methanolischen Lösung von Chlorwasserstoff wurden 0,5 g (1,8 mMol) 1-Methyl-3-(3-pyridylmethylidenamino)-3,4-dihydro-2(1H)-chinazolinon gelöst, gefolgt von der Zugabe von 0,11 g NaBH3CN, und die Reaktion wurde über 3 Stunden bei Raumtemperatur durchgeführt.

[0131] Nach Beendigung der Reaktion wurde die Reaktionsmischung in Wasser gegossen und der pH-Wert der erhaltenen Mischung wurde mit einer 10%igen wässrigen Natriumhydroxidlösung auf pH 9 eingestellt. Die gewünschte Verbindung wurde mit Ethylacetat (20 ml × 3) extrahiert, und die extrahierte Lösung wurde mit Wasser und einer gesättigten wässrigen Natriumchloridlösung gewaschen, über wasserfreiem Magnesiumsulfat getrocknet und anschließend unter reduziertem Druck destilliert, um das Lösungsmittel abzutrennen. Das so erhaltene Rohprodukt wurde aus Ethylacetat-Methanol umkristallisiert, um 0,15 g der gewünschten Verbindung zu erhalten.

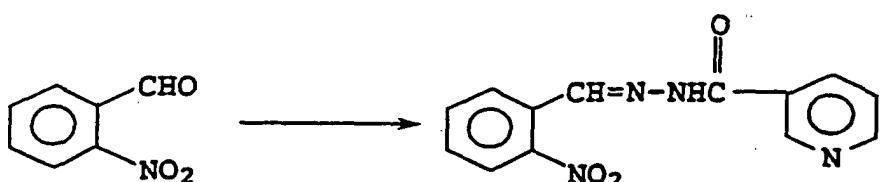
[0132] Physikalische Eigenschaft: Paste.

[0133] Ausbeute: 30%.

[0134]  $^1\text{H-NMR}$  [ $\text{CDCl}_3/\text{TMS}$ ,  $\delta$ -Werte (ppm)] 3,33 (3H, s.), 4,01 (3H, br.), 4,36 (2H, s.), 5,21 (1H, br. t.), 6,84 (1H, br.), 6,92-7,03 (2H, m.), 7,19-7,32 (2H, m.), 7,68-7,76 (1H, m.), 8,15 (1H, br.), 8,62 (1H, s.).

## Beispiel 10

10-1. Herstellung von 2-(2-Nitrophenylmethyliden)-nicotinsäure-hydrazid



[0135] Zu 20 ml Methanol wurden 3,33 g (22 mMol) 2-Nitrobenzaldehyd, 3,0 g (22 mMol) Nicotinsäurehydrazid und ein Tropfen Schwefelsäure gegeben, und die Reaktion wurde unter Erwärmen unter Rückfluss 3 Stunden lang durchgeführt.

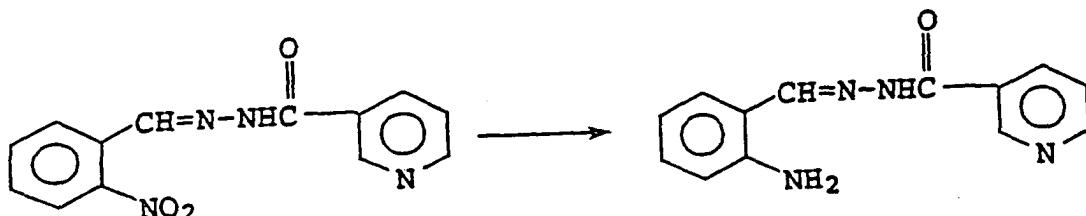
[0136] Nach Beendigung der Reaktion wurde die Reaktionslösung auf Raumtemperatur gekühlt und die aus-

gefallenen Kristalle wurden durch Filtration gesammelt, um 5,34 g der gewünschten Verbindung zu erhalten.

[0137] Physikalische Eigenschaft: Smp. 251°C.

[0138] Ausbeute: 90%.

10-2. Herstellung von 2-(2-Aminophenylmethyliden)-nicotinsäure-hydrazid



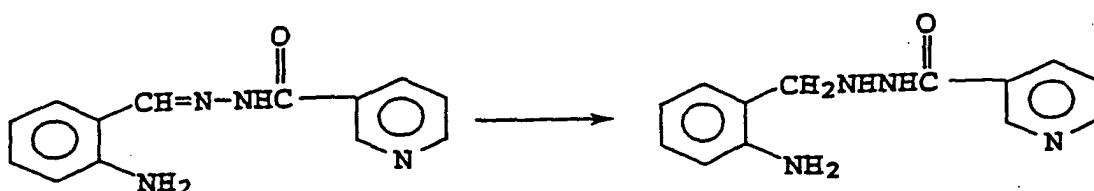
[0139] Zu 20 ml Essigsäure wurden 2,7 g (10 mMol) des in 10-1 erhaltenen 2-(2-Nitrophenylmethyliden)nicotinsäure-hydrazids und 0,27 g 5%iges Palladium-Kohlenstoff gegeben, und die Hydrierung wurde bei 29,4 bis 39,2 Pa (3 bis 4 kg/m<sup>2</sup>) durchgeführt.

[0140] Nach der Absorption einer theoretischen Menge von Wasserstoff wurde der Katalysator von der Reaktionsmischung durch Filtration abgetrennt und das Lösungsmittel unter reduziertem Druck abdestilliert, um 2,35 g der gewünschten Verbindung zu erhalten.

[0141] <sup>1</sup>H-NMR [CDCl<sub>3</sub>/TMS, δ-Werte (ppm)] 6,58 (1H, t.), 6,75 (1H, d.), 7,07 (2H, s.), 7,12 (1H, t.), 7,19 (1H, d.), 7,58 (1H, m.), 8,26 (1H, m.), 8,42 (1H, s.), 8,70 (1H, m.), 9,04 (1H, d.), 11,9 (1H, br.).

Ausbeute: quantitativ.

10-3. Herstellung von 2-(2-Aminophenylmethyl)nicotinsäure-hydrazid



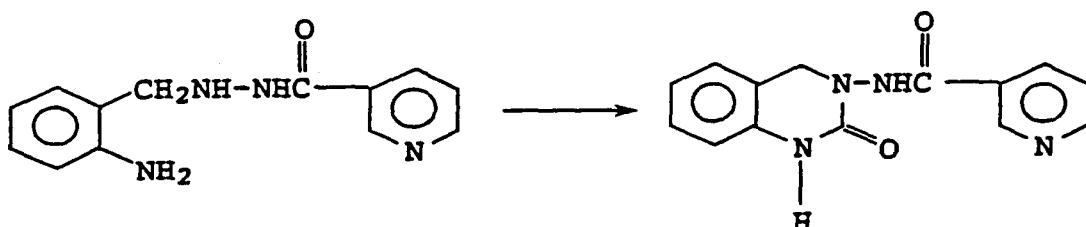
[0142] Zu 10 ml Wasser wurden 1,2 g (5 mMol) des in 10-2 erhaltenen 2-(2-Aminophenylmethyliden)nicotinsäure-hydrazids und 0,38 g (10 mMol) NaBH<sub>4</sub> gegeben und die Reaktion wurde 5 Stunden bei 60°C durchgeführt.

[0143] Nach Beendigung der Reaktion wurden 10 ml einer 10%igen wässrigen Natriumhydroxidlösung zu der Reaktionsmischung gegeben und das gewünschte Produkt wurde mit Ethylacetat extrahiert. Die extrahierte Lösung wurde mit Wasser und einer gesättigten wässrigen Natriumchloridlösung gewaschen, über wasserfreiem Magnesiumsulfat getrocknet und anschließend unter reduziertem Druck destilliert, um das Lösungsmittel abzutrennen, wodurch 0,65 g der gewünschten Verbindung erhalten wurde.

[0144] <sup>1</sup>H-NMR [CDCl<sub>3</sub>/TMS, δ-Werte (ppm)] 4,1 (2H, s.), 4,5 (2H, br. s.), 5,0 (1H, br. s.), 6,7 (2H, m.), 7,0-7,2 (2H, m.), 7,35-7,4 (1H, m.), 7,97 (1H, s.), 8,03-8,07 (1H, m.), 8,76 (1H, m.), 8,78 (1H, m.).

[0145] Ausbeute: 54,1%.

10-4. Herstellung von 3-(3-Pyridylcarbonylamino)-3,4-dihydro-2(1H)-chinazolin (Verbindung Nr. 493)



[0146] In 10 ml Tetrahydrofuran wurden 0,6 g (2,4 mMol) des in 10-3 erhaltenen 2-(2-Aminophenylmethyl)nicotinsäure-hydrazids und 0,38 g (2,4 mMol) 1,1'-Carbonylbis-1Himidazol gelöst und die Reaktion wurde 3 Stunden bei Raumtemperatur durchgeführt.

[0147] Nach Beendigung der Reaktion wurde die Reaktionslösung in 20 ml Wasser gegossen und die gewünschte Verbindung mit Ethylacetat extrahiert. Die extrahierte Lösung wurde mit Wasser und einer gesättig-

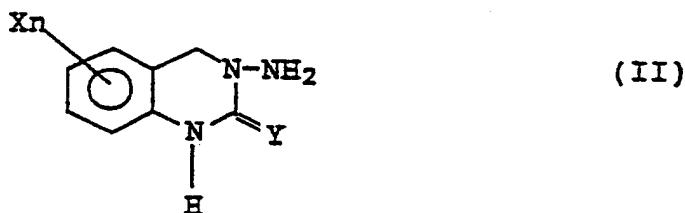
ten wässrigen Natriumchloridlösung gewaschen, über wasserfreiem Magnesiumsulfat getrocknet und anschließend unter reduziertem Druck destilliert, um das Lösungsmittel abzutrennen. Der erhaltene Rückstand wurde aus Methanol umkristallisiert, um 0,5 g der gewünschten Verbindung zu erhalten.

[0148] Physikalische Eigenschaft: Smp. 221,1–224,0°C.

[0149] Ausbeute: 78,1%.

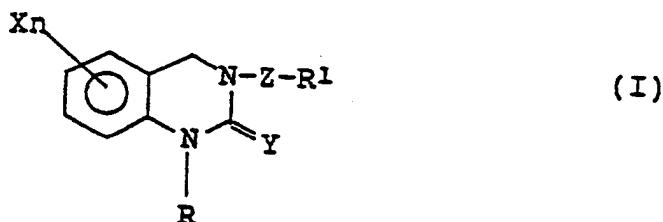
### Patentansprüche

#### 1. Verbindung der allgemeinen Formel (II)



worin die Gruppen X, die gleich oder verschieden sein können, Halogenatome; Hydroxylgruppen; Nitrogruppen; Cyanogruppen; ( $C_{1-6}$ )Alkylgruppen; Halo( $C_{1-6}$ )alkylgruppen; ( $C_{1-6}$ )Alkoxygruppen; Halo( $C_{1-6}$ )Alkoxygruppen; ( $C_{1-3}$ )Alkyldioxygruppen; Hydroxycarbonylgruppen; ( $C_{1-6}$ )Alcoxycarbonylgruppen; ( $C_{2-6}$ )Alkenyloxycarbonylgruppen; ( $C_{2-6}$ )Alkynyloxycarbonylgruppen; unsubstituierte Aminocarbonylgruppen; substituierte Aminocarbonylgruppen mit ein oder zwei Substituenten, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus ( $C_{1-6}$ )Alkylgruppen, ( $C_{2-6}$ )Alkenylgruppen und ( $C_{2-6}$ )Alkynylgruppen; unsubstituierte Aminogruppen; substituierte Aminogruppen mit ein oder zwei Substituenten, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus ( $C_{1-6}$ )Alkylgruppen, ( $C_{2-6}$ )Alkenylgruppen und ( $C_{2-6}$ )Alkynylgruppen; bedeuten, n eine ganze Zahl von 0 oder 1 bis 4 ist und Y ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom ist.

#### 2. Verwendung der wie in Anspruch 1 definierten Verbindung der allgemeinen Formel (II) zur Herstellung eines substituierten Aminochinazolinon(thion)-Derivats der allgemeinen Formel (I) oder eines Salzes davon:



worin R ein Wasserstoffatom; eine Hydroxylgruppe; eine Formylgruppe; eine ( $C_{1-12}$ )Alkylgruppe; eine Halo( $C_{1-6}$ )alkylgruppe; eine Hydroxy( $C_{1-6}$ )alkylgruppe; eine ( $C_{2-6}$ )Alkenylgruppe; eine ( $C_{2-6}$ )Alkynylgruppe; eine ( $C_{1-6}$ )Alkoxygruppe; eine Halo( $C_{1-6}$ )alkoxygruppe; eine ( $C_{1-6}$ )Alkoxy( $C_{1-3}$ )alkylgruppe; eine ( $C_{1-6}$ )Alkoxy( $C_{1-3}$ )alkylgruppe; eine ( $C_{1-6}$ )Alkylthiogruppe; eine Halo( $C_{1-6}$ )alkylthiogruppe; eine ( $C_{1-6}$ )Alkylsulfinylgruppe; eine ( $C_{1-6}$ )Alkylsulfonylgruppe; eine ( $C_{1-6}$ )Alkylthio( $C_{1-3}$ )alkylgruppe; eine Di( $C_{1-6}$ )alkoxy( $C_{1-3}$ )alkylgruppe, in der die ( $C_{1-6}$ )Alkoxygruppen gleich oder verschieden sein können; eine unsubstituierte Amino( $C_{1-6}$ )alkylgruppe; eine substituierte Amino( $C_{1-6}$ )alkylgruppe mit 1 oder 2 Substituenten, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus ( $C_{1-6}$ )Alkylgruppen, Halo( $C_{1-6}$ )alkylgruppen, ( $C_{2-6}$ )Alkenylgruppen und ( $C_{2-6}$ )Alkynylgruppen; eine Cyano( $C_{1-6}$ )alkylgruppe; eine ( $C_{1-6}$ )Alkylcarbonylgruppe; eine ( $C_{1-6}$ )Alcoxycarbonylgruppe; eine Hydroxycarbonyl( $C_{1-3}$ )alkylgruppe; eine ( $C_{1-6}$ )Alcoxycarbonyl( $C_{1-3}$ )alkylgruppe; eine unsubstituierte Aminocarbonylgruppe; eine substituierte Aminocarbonylgruppe mit 1 oder 2 Substituenten, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus ( $C_{1-6}$ )Alkylgruppen, ( $C_{2-6}$ )Alkenylgruppen und ( $C_{2-6}$ )Alkynylgruppen; eine ( $C_{3-6}$ )Cycloalkyl( $C_{1-3}$ )alkylgruppe; eine unsubstituierte Phenyl( $C_{1-3}$ )alkylgruppe; eine substituierte Phenyl( $C_{1-3}$ )alkylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen, ( $C_{1-6}$ )Alkylgruppen, Halo( $C_{1-6}$ )alkylgruppen, ( $C_{1-6}$ )Alkoxygruppen, Halo( $C_{1-6}$ )alkoxygruppen, ( $C_{1-6}$ )Alkylthiogruppen und Halo( $C_{1-6}$ )alkylthiogruppen; eine unsubstituierte Phenylcarbonylgruppe; eine substituierte Phenylcarbonylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen, ( $C_{1-6}$ )Alkylgruppen, Halo( $C_{1-6}$ )alkylgruppen, ( $C_{1-6}$ )Alkoxygruppen, Halo( $C_{1-6}$ )alkoxy-

gruppen,  $(C_{1-6})Alkylthiogruppen$  und  $Halo(C_{1-6})alkylthiogruppen$ ; eine unsubstituierte Phenylthiogruppe; eine substituierte Phenylthiogruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen,  $(C_{1-6})Alkylgruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkylgruppen$ ,  $(C_{1-6})Alkoxygruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkoxygruppen$ ,  $(C_{1-6})Alkylthiogruppen$  und  $Halo(C_{1-6})alkylthiogruppen$ ; eine unsubstituierte Phenylsulfonylgruppe; eine substituierte Phenylsulfonylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen,  $(C_{1-6})Alkylgruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkylgruppen$ ,  $(C_{1-6})Alkoxygruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkoxygruppen$ ,  $(C_{1-6})Alkylthiogruppen$  und  $Halo(C_{1-6})alkylthiogruppen$ ; eine unsubstituierte Phenyl( $C_{1-6}$ )alkylsulfonylgruppe; eine substituierte Phenyl( $C_{1-6}$ )alkylsulfonylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen,  $(C_{1-6})Alkylgruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkylgruppen$ ,  $(C_{1-6})Alkoxygruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkoxygruppen$ ,  $(C_{1-6})Alkylthiogruppen$  und  $Halo(C_{1-6})alkylthiogruppen$ ; eine unsubstituierte Phenoxy carbonylgruppe; eine substituierte Phenoxy carbonylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen,  $(C_{1-6})Alkylgruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkylgruppen$ ,  $(C_{1-6})Alkoxygruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkoxygruppen$ ,  $(C_{1-6})Alkylthiogruppen$  und  $Halo(C_{1-6})alkylthiogruppen$ ; eine unsubstituierte Phenoxy( $C_{1-3}$ )alkylgruppe; eine substituierte Phenoxy( $C_{1-3}$ )alkylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen,  $(C_{1-6})Alkylgruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkylgruppen$ ,  $(C_{1-6})Alkoxygruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkoxygruppen$ ,  $(C_{1-6})Alkylthiogruppen$  und  $Halo(C_{1-6})alkylthiogruppen$ ; eine unsubstituierte Phenyl( $C_{2-6}$ )alkenylgruppe; eine substituierte Phenyl( $C_{2-6}$ )alkenylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen,  $(C_{1-6})Alkylgruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkylgruppen$ ,  $(C_{1-6})Alkoxygruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkoxygruppen$ ,  $(C_{1-6})Alkylthiogruppen$  und  $Halo(C_{1-6})alkylthiogruppen$ ; eine unsubstituierte Phenyl( $C_{2-4}$ )alkynyl( $C_{1-3}$ )alkylgruppe mit 1 bis 5 Substituenten am Ring, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Nitrogruppen, Cyanogruppen,  $(C_{1-6})Alkylgruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkylgruppen$ ,  $(C_{1-6})Alkoxygruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkoxygruppen$ ,  $(C_{1-6})Alkylthiogruppen$  und  $Halo(C_{1-6})alkylthiogruppen$ ; eine 1,3-Dioxolan-2-yl( $C_{1-3}$ )alkylgruppe; oder eine Phthalimido( $C_{1-6}$ )alkylgruppe bedeutet;

$R^1$  ein 5- oder 6-gliedriger heterozyklischer Ring mit 1 bis 3 Heteroatomen ist, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoffatomen, Schwefelatomen und Stickstoffatomen, wobei der heterozyklische Ring 1 bis 5 Substituenten aufweisen kann, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus Halogenatomen, Cyanogruppen,  $(C_{1-6})Alkylgruppen$ ,  $Halo(C_{1-6})alkylgruppen$  und  $(C_{1-6})Alkoxygruppen$ , und das Stickstoffatom in dem heterozyklischen Ring eine N-Oxidgruppe bilden kann,  $Y$  ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom bedeutet,

Z

$-N=C(R^2)$

(worin  $R^2$  ein Wasserstoffatom, eine  $(C_{1-6})Alkylgruppe$  oder eine  $Halo(C_{1-6})alkylgruppe$  bedeutet),

$-N(R^3)-CH(R^2)$

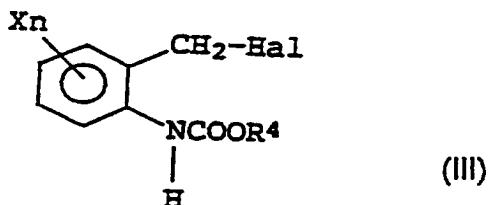
(worin  $R^2$  wie oben definiert ist und  $R^3$  ein Wasserstoffatom, eine  $(C_{1-6})Alkylgruppe$ , eine Formylgruppe, eine  $(C_{1-3})Alkylcarbonylgruppe$ , eine  $Halo(C_{1-3})alkylcarbonylgruppe$  oder eine  $(C_{1-3})Alkyldithiocarbonylgruppe$  bedeutet), oder

$-N(R^3)-CO$

(worin  $R^3$  wie oben definiert ist) bedeutet, die Gruppen X, die gleich oder verschieden sein können, Halogenatome; Hydroxylgruppen; Nitrogruppen; Cyanogruppen;  $(C_{1-6})Alkylgruppen$ ;  $Halo(C_{1-6})alkylgruppen$ ;  $(C_{1-6})Alkoxygruppen$ ;  $Halo(C_{1-6})alkoxygruppen$ ;  $(C_{1-3})Alkylendioxygruppen$ ; Hydroxycarbonylgruppen;  $(C_{1-6})Alkoxy carbonylgruppen$ ;  $(C_{2-6})Alkenyloxycarbonylgruppen$ ;  $(C_{2-6})Alkynyloxycarbonylgruppen$ ; unsubstituierte Aminocarbonylgruppen; substituierte Aminocarbonylgruppen mit 1 oder 2 Substituenten, die gleich oder verschieden

sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus ( $C_{1-6}$ )-Alkylgruppen, ( $C_{2-6}$ )-Alkenylgruppen und ( $C_{2-6}$ )-Alkynylgruppen; unsubstituierte Aminogruppen; oder substituierte Aminogruppen mit 1 oder 2 Substituenten, die gleich oder verschieden sein können und gewählt werden aus der Gruppe bestehend aus ( $C_{1-6}$ )-Alkylgruppen, ( $C_{2-6}$ )-Alkenylgruppen und ( $C_{2-6}$ )-Alkynylgruppen, sind und n eine ganze Zahl von 0 oder 1 bis 4 ist.

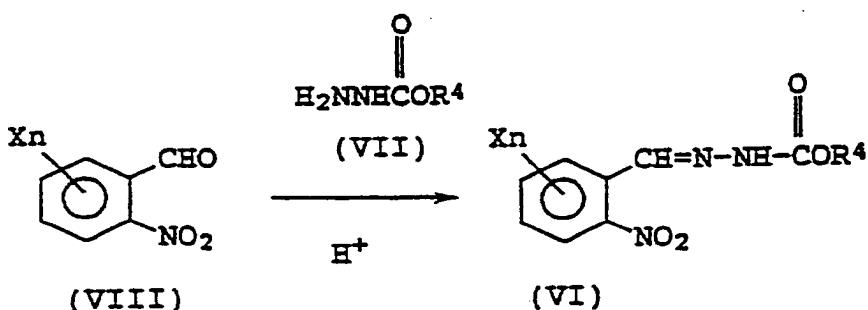
3. Verfahren zur Herstellung der Verbindung der allgemeinen Formel (II) gemäß Anspruch 1, worin Y ein Sauerstoffatom ist, umfassend das Umsetzen einer Verbindung der allgemeinen Formel (III)



worin X und n wie in Anspruch 1 mit Bezug auf die Formel (II) definiert sind, R<sup>4</sup> eine ( $C_{1-6}$ )-Alkylgruppe und Hal ein Halogenatom ist,  
mit Hydrazinhydrat in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels.

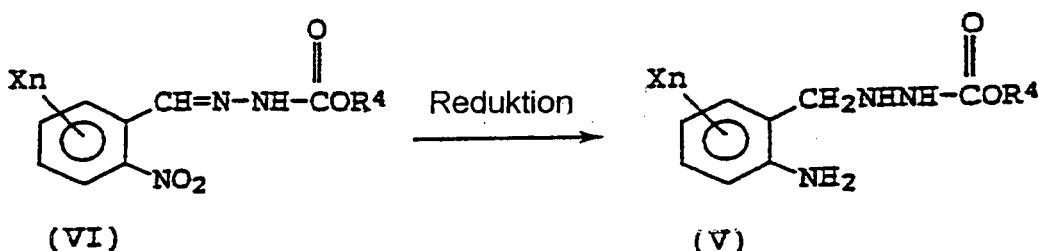
4. Verfahren zur Herstellung der Verbindung der allgemeinen Formel (II) gemäß Anspruch 1, umfassend die folgenden Schritte:

Umsetzen einer Verbindung der allgemeinen Formel (VIII) mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (VII) in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels und eines Katalysators, um eine Verbindung der Formel (VI) herzustellen



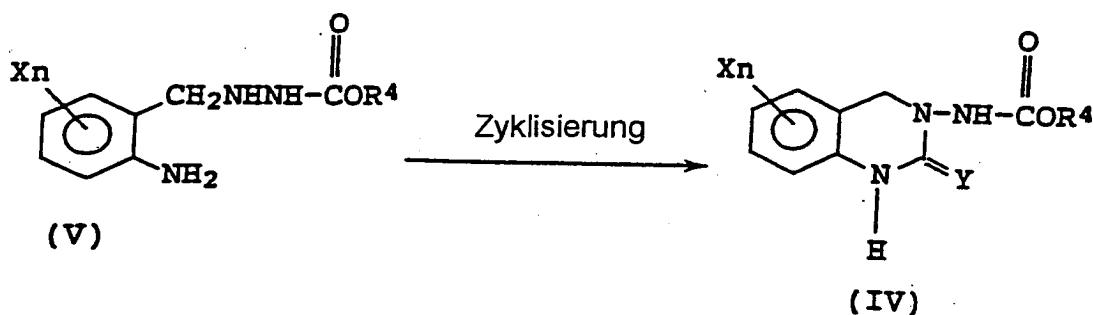
worin X und n wie in Anspruch 1 mit Bezug auf die allgemeine Formel (II) definiert sind und R<sup>4</sup> eine ( $C_{1-6}$ )-Alkylgruppe ist;

– Reduzieren der Verbindung der allgemeinen Formel (VI) mit einem Reduktionsmittel oder durch katalytische Reduktion in Anwesenheit oder Abwesenheit eines inerten Lösungsmittels, um eine Verbindung der allgemeinen Formel (V) herzustellen

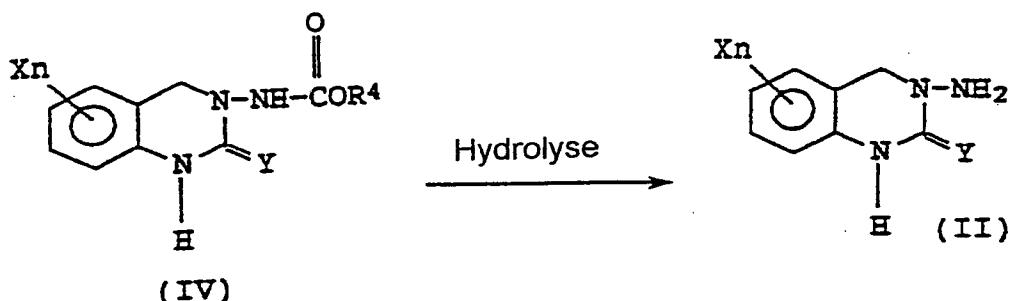


worin X, n und R<sup>4</sup> wie oben definiert sind;

– Umsetzen der Verbindung der allgemeinen Formel (V) mit 1,1'Carbonylbis-1Himidazol (CDI), einem Alkoxy-carbonylhalogenid, Phosgen oder Thiophosgen in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels und in Anwesenheit oder Abwesenheit einer Base, um eine Zyklisierung herbeizuführen und eine Verbindung der allgemeinen Formel (IV) herzustellen



worin X, n und  $\text{R}^4$  wie oben definiert sind und Y ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom ist; und  
– Hydrolysen der Verbindung der allgemeinen Formel (IV) unter Verwendung eines Alkali in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, um eine Verbindung der allgemeinen Formel (II) herzustellen



worin X, n, Y und  $\text{R}^4$  wie oben definiert sind.

Es folgt kein Blatt Zeichnungen