

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成17年8月11日(2005.8.11)

【公表番号】特表2001-515470(P2001-515470A)

【公表日】平成13年9月18日(2001.9.18)

【出願番号】特願平10-536215

【国際特許分類第7版】

C 0 7 C 311/08

A 6 1 K 31/167

A 6 1 K 31/18

A 6 1 K 31/21

A 6 1 K 31/341

A 6 1 K 31/4035

A 6 1 K 31/425

A 6 1 K 31/44

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/472

A 6 1 K 31/495

A 6 1 K 31/505

A 6 1 K 31/5375

A 6 1 P 1/08

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 27/06

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/06

C 0 7 C 43/275

C 0 7 C 217/90

C 0 7 C 233/25

C 0 7 C 233/60

C 0 7 C 235/16

C 0 7 C 307/02

C 0 7 C 307/10

C 0 7 C 309/65

C 0 7 C 309/66

C 0 7 C 309/67

C 0 7 C 309/74

C 0 7 C 311/12

C 0 7 C 311/13

C 0 7 C 311/21

C 0 7 C 311/24  
C 0 7 C 311/32  
C 0 7 C 311/48  
C 0 7 C 313/06  
C 0 7 D 209/44  
C 0 7 D 209/48  
C 0 7 D 213/61  
C 0 7 D 213/76  
C 0 7 D 215/26  
C 0 7 D 217/02  
C 0 7 D 217/04  
C 0 7 D 239/47  
C 0 7 D 275/02  
C 0 7 D 295/08  
C 0 7 D 295/16  
C 0 7 D 307/68  
C 0 7 D 401/12  
C 0 7 F 9/44

## 【 F I 】

C 0 7 C 311/08  
A 6 1 K 31/167  
A 6 1 K 31/18  
A 6 1 K 31/21  
A 6 1 K 31/341  
A 6 1 K 31/4035  
A 6 1 K 31/425  
A 6 1 K 31/44  
A 6 1 K 31/47  
A 6 1 K 31/4709  
A 6 1 K 31/472  
A 6 1 K 31/495  
A 6 1 K 31/505  
A 6 1 K 31/5375  
A 6 1 P 1/08  
A 6 1 P 1/14  
A 6 1 P 9/10  
A 6 1 P 11/06  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 25/00  
A 6 1 P 25/04  
A 6 1 P 25/08  
A 6 1 P 25/14  
A 6 1 P 25/20  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 27/06  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 37/06  
C 0 7 C 43/275  
C 0 7 C 217/90

1 0 1

C 0 7 C	233/25	
C 0 7 C	233/60	
C 0 7 C	235/16	A
C 0 7 C	307/02	
C 0 7 C	307/10	
C 0 7 C	309/65	
C 0 7 C	309/66	
C 0 7 C	309/67	
C 0 7 C	309/74	
C 0 7 C	311/12	
C 0 7 C	311/13	
C 0 7 C	311/21	
C 0 7 C	311/24	
C 0 7 C	311/32	
C 0 7 C	311/48	
C 0 7 C	313/06	
C 0 7 D	209/44	
C 0 7 D	213/61	
C 0 7 D	213/76	
C 0 7 D	215/26	
C 0 7 D	217/02	
C 0 7 D	217/04	
C 0 7 D	239/47	Z
C 0 7 D	275/02	
C 0 7 D	295/08	A
C 0 7 D	295/08	Z
C 0 7 D	295/16	A
C 0 7 D	295/16	Z
C 0 7 D	307/68	
C 0 7 D	401/12	
C 0 7 F	9/44	
C 0 7 D	209/48	Z

**【 手続補正書 】****【 提出日 】**平成16年12月3日(2004.12.3)**【 手続補正 1 】****【 補正対象書類名 】**明細書**【 補正対象項目名 】**補正の内容のとおり**【 補正方法 】**変更**【 補正の内容 】**

## 手 続 補 正 書

平成16年12月3 日

特許庁長官 小川 洋 殿

## 1. 事件の表示

平成10年 特許願 第536215号

## 2. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

名称 バイエル・アクチエンゲゼルシャフト

## 3. 代理人

〒107-0052

住所 東京都港区赤坂1丁目9番15号  
日本自転車会館

氏名 (6078) 弁理士 小田島 平吉



電話 3585-2256

## 4. 補正命令の日付 なし(自発)

## 5. 補正の対象

「請求の範囲」

## 6. 補正の内容

別紙のとおり



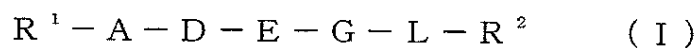
方 式 登 録



## 別紙

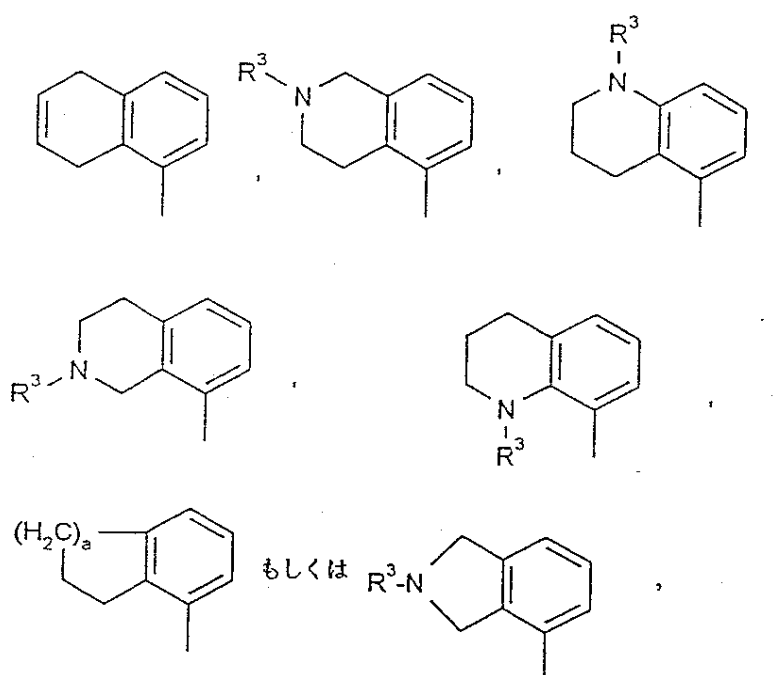
## 請 求 の 範 囲

## 1. 一般式 (I)



式中、

$R^1$ は  $(C_6 - C_{10})$  -アリール、キノリル、イソキノリルまたは式



上式中、

$a$  は数字 1 または 2 を表し、

$R^3$ は水素、 $(C_2 - C_6)$  -アルケニル、 $(C_1 - C_6)$  -アルキルまたは  $(C_1 - C_6)$  -アシルを表す、の基を表し、  
 そしてここで、全ての上記の環系及び基は、場合により、  
 ハロゲン、カルボキシル、ヒドロキシル、フェニル、 $(C_1 - C_6)$  -アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  -アルコキシカルボ

ニル、 $(C_1-C_8)$ -アルキル (ここで、アルキル基部分が  
 ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキルスルホニルオキシ、アジ  
 ド、アミノ、モノ  $(C_1-C_6)$ -アルキルアミノ、ジ  $(C_1$   
 $-C_6)$ -アルキルアミノまたはヒドロキシルで置換されてい  
 てもよい)、

式  $-(CO)_b-NR^4R^5$  [ここで、bは数字0または1を表し、 $R^4$   
 及び  $R^5$ は同一または異なり、そして相互に独立して水素、フェニル、  
 $(C_1-C_6)$ -アシル、シクロ  $(C_4-C_7)$ -アシル、ベンゾイルま  
 たは場合によりアミノ、モノ  $(C_1-C_6)$ -アルキルアミノ、ジ  $(C_1$   
 $-C_6)$ -アルキルアミノで置換されていてもよい  $(C_1-C_6)$ -アルキ  
 ルを表すか、あるいは

$R^4$ 及び  $R^5$ はそれらが結合する窒素原子と一緒になって場合により  
 S及びOよりなる群からの1個もしくはそれより多いさらなるヘテロ  
 原子及び/または1個もしくはそれより多い式  $NR^8$  (ここで、 $R^8$   
 は水素、 $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは  $(C_1-C_6)$ -アシルを表す]  
 の基を含有してもよい5または6員の飽和複素環を形成する]の基、  
 並びに

式  $NR^6-SO_2-R^7$  [ここで、 $R^6$ は水素、フェニル、 $(C_1-$   
 $C_6)$ -アルキルまたは  $(C_1-C_6)$ -アシルを表し、 $R^7$ はフェニル  
 または  $(C_1-C_6)$ -アルキルを表す]の基、

よりなる群から選択される1個またはそれより多い同一またはなる置換  
 基で適当な場合にはジェミナルに置換されていてもよく、

A及びEは同一または異なり、そして結合または  $(C_1-C_4)$ -アルキ  
 レンを表し、

Dは酸素原子または式 $-S(O)_c-$ もしくは $-N(R^9)-$ 〔ここで、

cは数字0、1または2を表し、

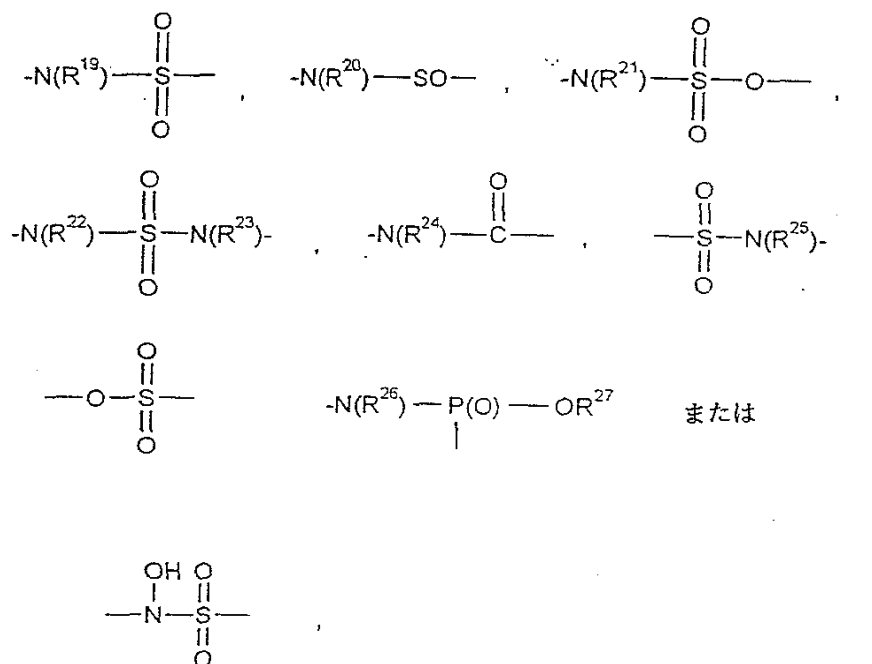
$R^9$ は水素、 $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -アシルを表す〕の基を表し、

Gは二様に結合した $(C_6-C_{10})$ -アリールまたはS、N及び/もしくはOよりなる群からの3個までのヘテロ原子を有する二様に結合した5ないし7員の芳香族複素環を表し、それらの各々が場合により、

ヒドロキシル、トリフルオロメチル、カルボキシル、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、ヒドロキシ $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシカルボニル、並びに式

$-CO-O-(CH_2)_d-NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{12}-SO_2R^{13}$ 、 $-(CH_2)_e-(CO)_f-NR^{14}R^{15}$ 及び $-OR^{16}$ 〔ここで、dは数字1、2、3または4を表し、e及びfは同一または異なり、そして数字0または1を表し、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は上に示した $R^4$ 及び $R^5$ の意味を有し、そしてこれと同一または異なり、 $R^{12}$ は上に示した $R^6$ の意味を有し、そしてこれと同一または異なり、 $R^{13}$ は上に示した $R^7$ の意味を有し、そしてこれと同一または異なり、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ は上に示した $R^4$ 及び $R^5$ の意味を有し、そしてこれと同一または異なるか、あるいは相互に独立して式 $-(CH_2)_g-NR^{17}R^{18}$ 〔式中、gは数字1、2、3または4を表し、そして $R^{17}$ 及び $R^{18}$ は上に示した $R^4$ 及び $R^5$ の意味を有し、そしてこれと同一または異なる〕の基を表し、 $R^{16}$ は $(C_6-C_{10})$ -アリールを表す〕の基、よりなる群から選択される1個またはそれより多い同一または異なる置換基で置換されていてもよく、

Lは式  $-\text{O}-$ ,  $-\text{NH}_2-$ ,



の基を表し、

ここで、Gへのこれらの基の結合は左側の結合で起こり、そして

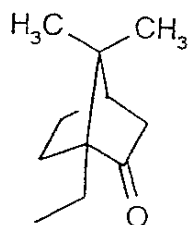
ここで、 $\text{R}^{19}$ 、 $\text{R}^{20}$ 、 $\text{R}^{21}$ 、 $\text{R}^{22}$ 、 $\text{R}^{23}$ 、 $\text{R}^{24}$ 、 $\text{R}^{25}$ 、 $\text{R}^{26}$ 及び $\text{R}^{27}$ は同一または異なり、そして水素または $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -アルキルを表すか、あるいは

$\text{R}^{19}$ は式 $-\text{SO}_2\text{R}^2$ の基を表し、

$\text{R}^2$ は $(\text{C}_6-\text{C}_{10})$ -アリーールまたはS、N及び/もしくはOよりなる群からの3個までのヘテロ原子を有する5ないし7員の飽和もしくは芳香族複素環を表し、それらの各々が場合により、ハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ及び $(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -アルキルよりなる群から選択される1個またはそれより多い同一または異なる置換基で置換されていてもよく、あるいは

式

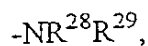
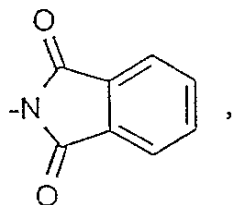




の基またはモルホリンを表すか、あるいは

C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub>–シクロアルキルを表すか、あるいは

(C<sub>1</sub>–C<sub>12</sub>)–アルキル、(C<sub>2</sub>–C<sub>12</sub>)–アルケニルまたは(C<sub>2</sub>–C<sub>12</sub>)–アルキニルを表し、それらの各々が場合により、ハロゲン、トリフルオロメチル、ヒドロキシル、シアノ、アジド、(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アルコキシ、(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–ペルフルオロアルコキシ、部分的にフッ素化された(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アルコキシ、式



(式中、R<sup>28</sup>及びR<sup>29</sup>は上に示したR<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>の意味

を有し、そしてこれと同一または異なるの基、

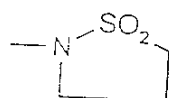
場合により、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシル、(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アルキル、(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アルコキシ及び式–NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup>〔式中、R<sup>30</sup>及びR<sup>31</sup>は同一または異なり、そして水素または(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アルキルまたは(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アシルを表す〕の基よりなる群から選択される1個またはそれより多い同一または異なる置換基で置換されていてもよいフェニル、並びに

場合により、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシル、(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アルキル、(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アルコキシ及び式–NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup>〔式中、R<sup>30</sup>

<sup>0</sup>及びR<sup>31</sup>は上に定義したとおりである)の基、よりなる群から選択される1個またはそれより多い同一または異なる置換基で置換されていてもよい、S、N及び/またはOよりなる群からの3個までのヘテロ原子を有する5ないし6員の芳香族複素環、

よりなる群から選択される1個またはそれより多い同一または異なる置換基で置換されていてもよく、あるいは

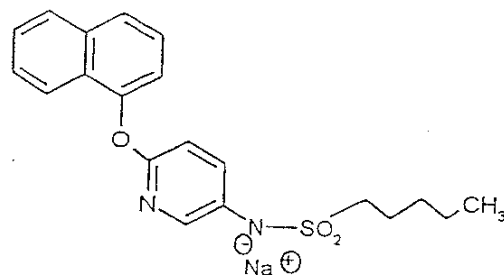
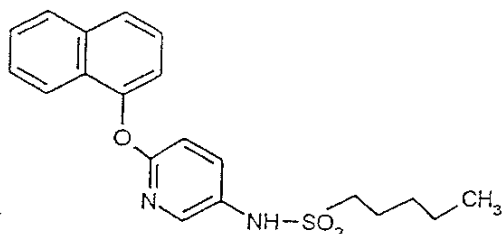
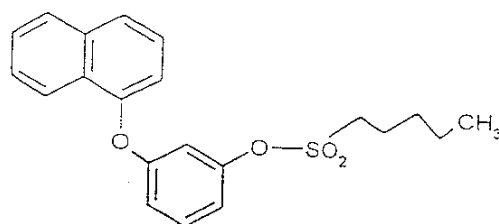
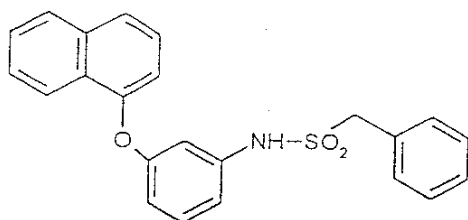
L及びR<sup>2</sup>は一緒になって式

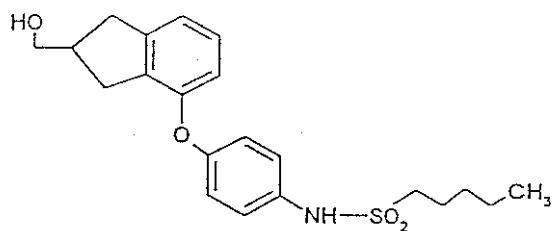
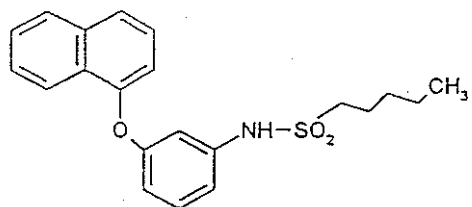


の基を表す、

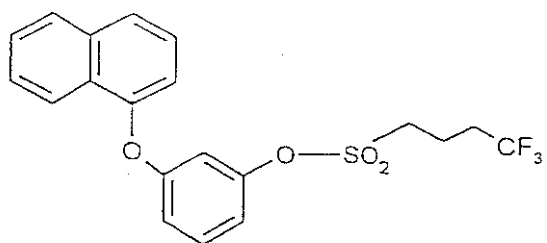
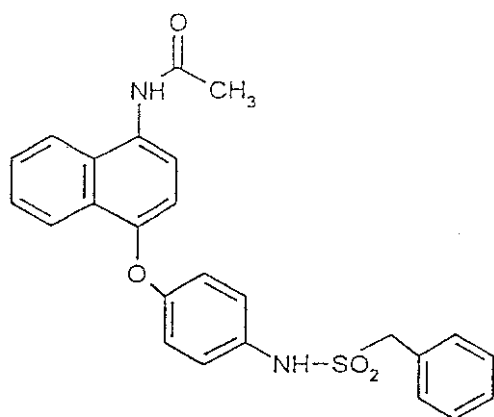
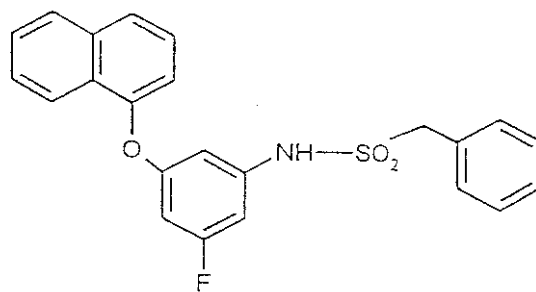
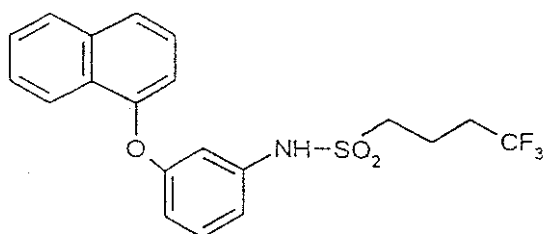
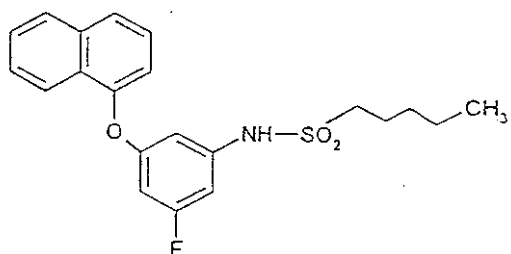
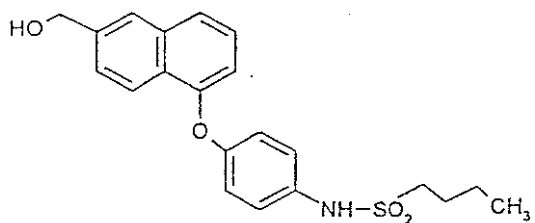
の化合物またはその塩。

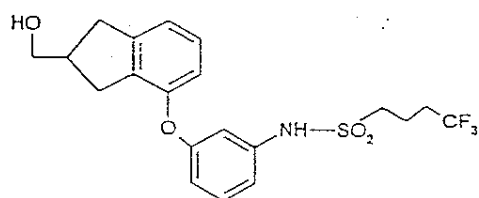
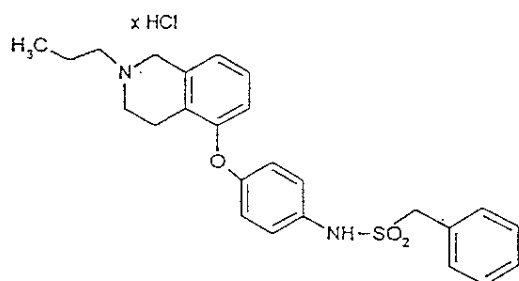
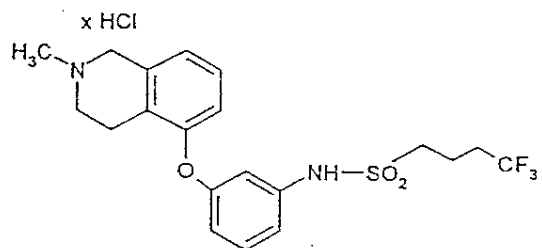
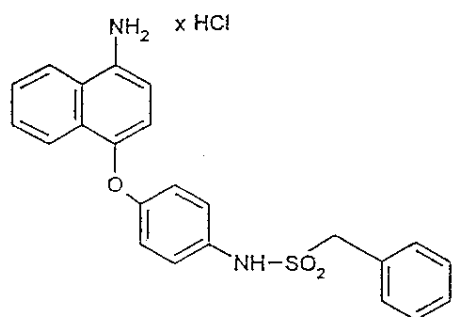
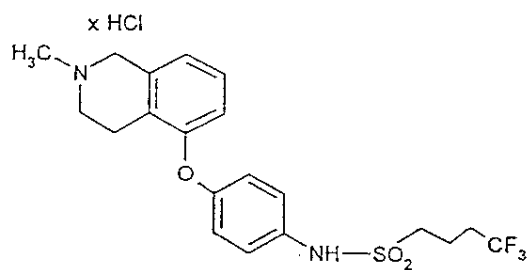
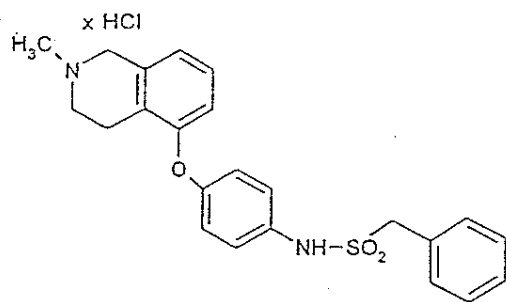
2. 以下の式:



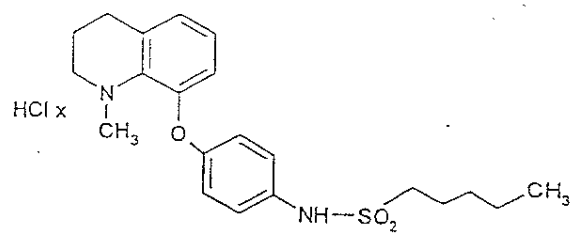
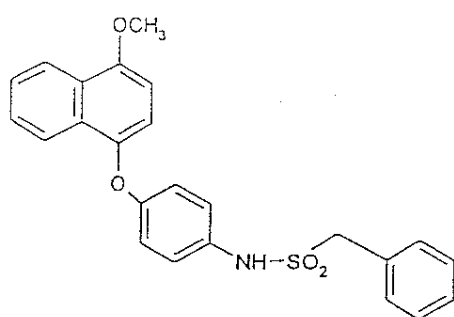


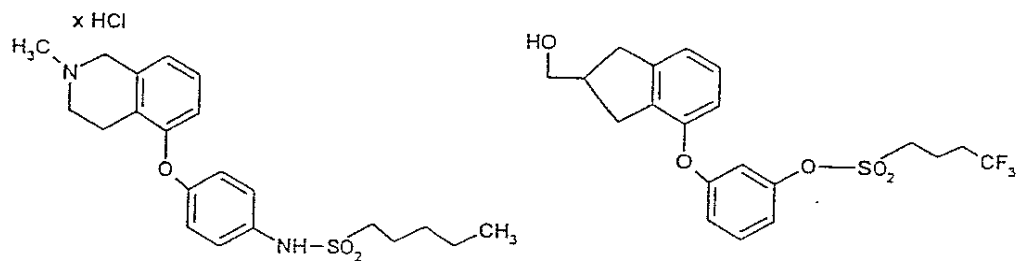
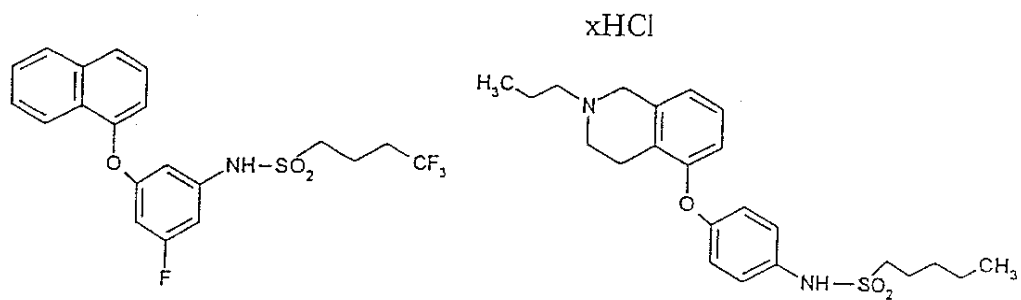
ラセミ化合物及び鏡像異性体



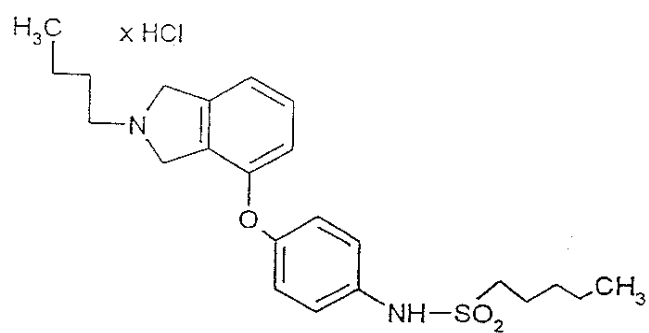
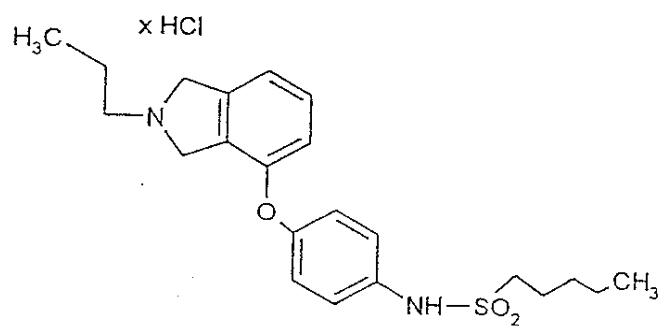


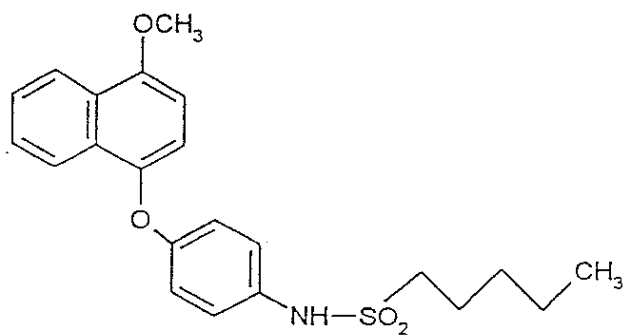
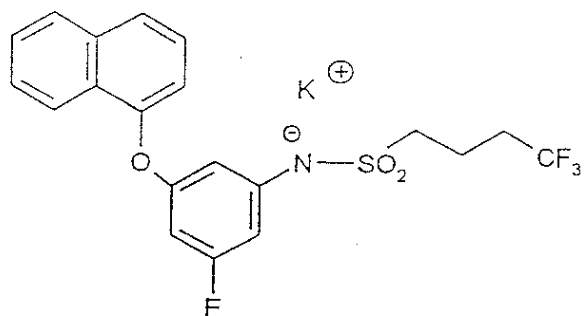
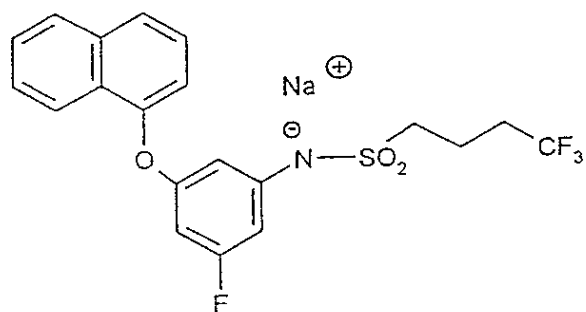
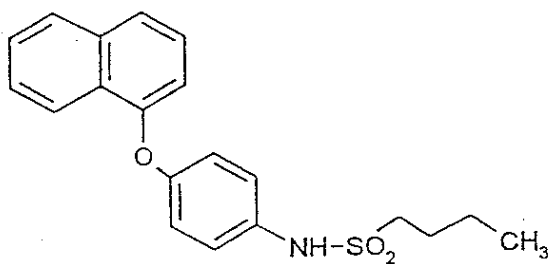
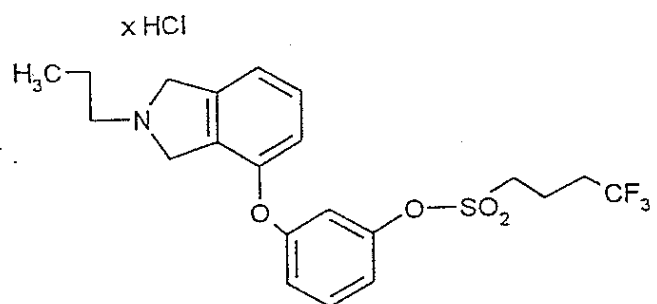
ラセミ化合物及び鏡像異性体

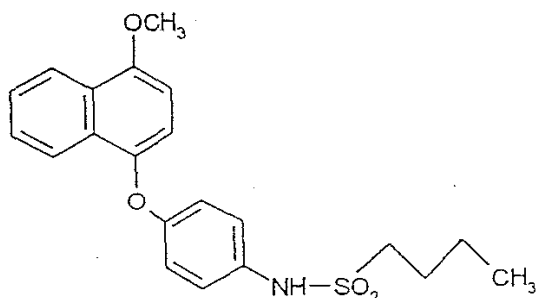
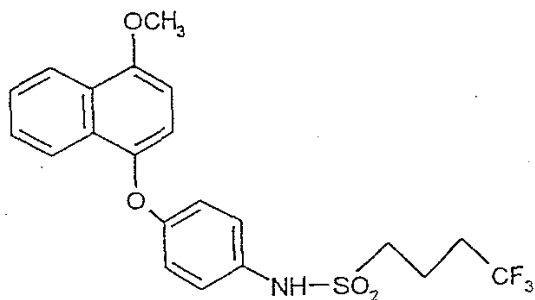




ラセミ化合物及び鏡像異性体







の請求項 1 に記載の化合物。

3. [A] 不活性溶媒中で、必要な場合、塩基の存在下で、

一般式 (II)



式中、

$R^1$ 、A、D、E 及び G は請求項 1 に示した一般式 (I) について

定義した意味を有し、そして M は酸素または  $-N(R^{32})-$  を表し、

そして  $R^{32}$  は水素または  $(C_1 - C_4)$  -アルキルである、

の化合物を一般式 (III)



式中、

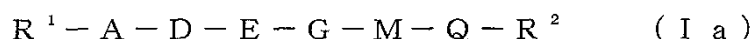
$R^2$  は請求 1 に示した一般式 (I) について定義した意味を有し、

$R^{33}$  はハロゲン、好ましくは塩素またはヨウ素を表し、

Q は式  $-SO_2-$ 、 $-SO-$ 、 $-CO-$ 、 $-P(O)(OR^{27})-$

の基または単結合を表し、

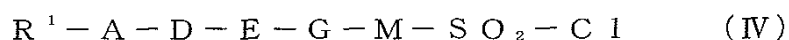
ここで  $R^{27}$  は 一般式 (I) について定義した意味を有する、  
 の化合物と反応させて一般式 (I a)



式中、

$R^1$ 、 $A$ 、 $D$ 、 $E$ 、 $G$ 、 $M$ 、 $Q$  及び  $R^2$  は上に示した意味を有する、  
 の化合物を生ぜしめるか  
 あるいは

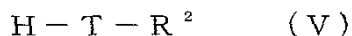
[B] 一般式 (II) の化合物をまずクロスルホン酸トリアルキルシリル、好ましくはクロスルホン酸トリメチルシリルと反応させ、酸で処理し、次に塩素化剤、好ましくは五塩化リンと反応させて、一般式 (IV)



式中、

$R^1$ 、 $A$ 、 $D$ 、 $E$  及び  $G$  は 請求項 1 に示した一般式 (I) について定義した意味を有し、そして  $M$  は酸素または  $-N(R^{32})-$  を表し、そして  $R^{32}$  は水素または  $(C_1 - C_4)$  - アルキルである、

の化合物を生ぜしめ、次に不活性溶媒中で、必要な場合、 $Bz^+Cl^-$  及び塩基の存在下で、  
 一般式 (V)

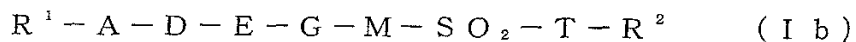


式中、

$R^2$  は 請求項 1 に示した一般式 (I) について定義した意味を有し、そして

$T$  は酸素または窒素を表す、  
 の化合物と反応させて、一般式 (I b)

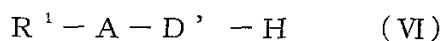




式中、

$R^1$ 、A、D、E、G、M、T及び $R^2$ は上に示した意味を有する、  
の化合物を生ぜしめるか  
あるいは

[C] 一般式 (VI)



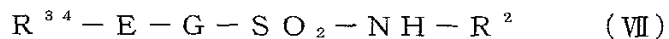
式中、

$R^1$ 及びAは請求項1に示した一般式 (I) について定義した意味  
を有し、そして

D' は酸素、硫黄または $-N(R^9)-$ を表し、そして

$R^9$ は請求項1に示した一般式 (I) について定義した意味を有す  
る、

の化合物を一般式 (VII)



式中、

E、G及び $R^2$ は上に示した意味を有し、そして

$R^{3,4}$ は脱離基、好ましくはハロゲン、特に好ましくはフッ素、塩  
素または臭素を表す、

の化合物と反応させて、一般式 (I c)

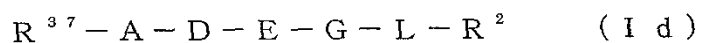


式中、

$R^1$ 、A、D'、E、G及び $R^2$ は上に示した意味を有する、  
の化合物を生ぜしめるか

あるいは

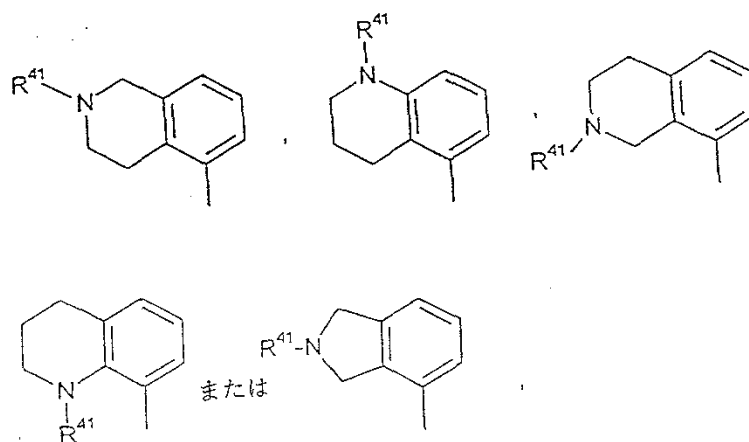
[D] 一般式 (I d)



式中、

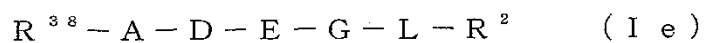
A、D、E、G、L 及び  $R^2$  は請求項 1 に示した一般式 (I) について定義した意味を有し、そして

$R^{37}$  は式



〔式中、 $R^{41}$  は  $(C_1 - C_6)$  -アルキルを表す、の基を表す〕

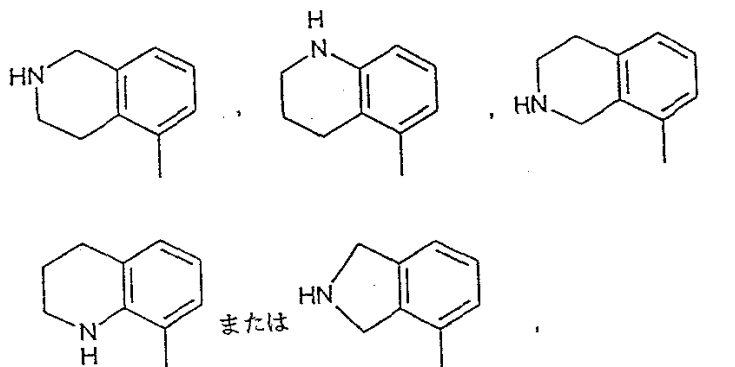
の化合物をクロロギ酸エステル、好ましくはクロロギ酸 1 - (1 - クロロ)エチルまたはクロロギ酸メチルと、そして次にアルコール、好ましくはメタノールと必要な場合、塩基の存在下で反応させて、一般式 (I e)



式中、

A、D、E、G、L 及び  $R^2$  は上に示した意味を有し、そして

$R^{38}$  は式

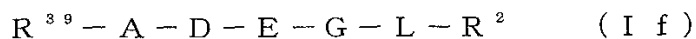


の基を表す、

の化合物を生ぜしめるか、

あるいは

[E] 還元剤、好ましくはシアノホウ水素化ナトリウムの存在下で、必要な場合、酸の存在下で、一般式 (I e) の化合物を (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ケトンまたは (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルデヒドと反応させて、一般式 (I f)



式中、

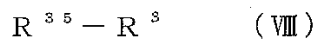
A、D、E、G、L 及び R<sup>2</sup> は 請求項 1 に示した一般式 (I) について定義した意味を有し、そして

R<sup>39</sup> は (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニルまたは (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルを表す、

の化合物を生ぜしめるか、

あるいは

[F] 不活性溶媒中で、必要な場合、塩基の存在下で、一般式 (I e) の化合物を一般式 (VIII)

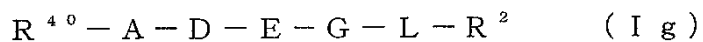


式中、

$R^3$ は請求項1に示した一般式(I)について定義した意味を有し、

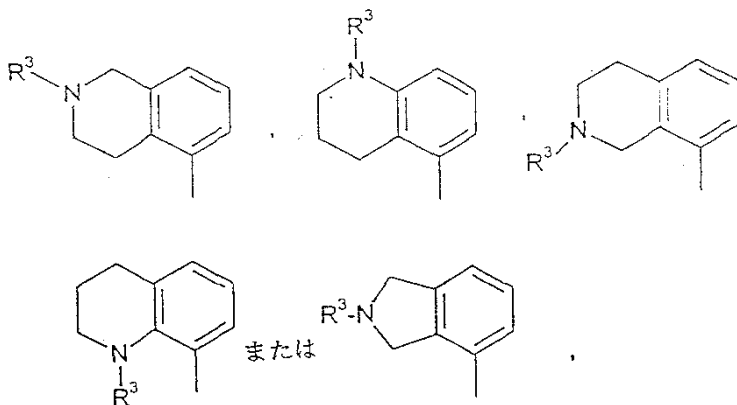
$R^{3*}$ は脱離基、好ましくはハロゲンを表す、

の化合物と反応させて、一般式(Ig)



式中、A、D、E、G、L及び $R^2$ は請求項1に示した一般式(I)について定義した意味を有し、そして

$R^{40}$ は式

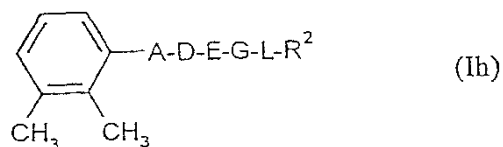


\_\_(式中、 $R^3$ は上に示した意味を有する)\_\_の基を表す、

の化合物を生ぜしめるか、

あるいは

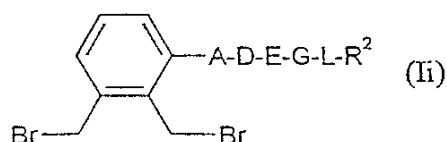
[G] 一般式(Ih)



式中、

A、D、E、G、L 及び  $R^2$  は請求項 1 に示した一般式 (I) について定義した意味を有する、

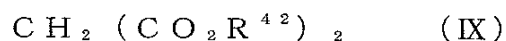
の化合物を不活性溶媒中で、例えば N-ブロモスクシンイミドで、遊離基臭素化により一般式 (I i)



式中、

A、D、E、G、L 及び  $R^2$  は上に示した意味を有する、

の化合物に転化し、そして次に、不活性溶媒中で、必要な場合、塩基の存在下で、一般式 (IX) または (X)

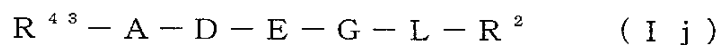


式中、

$R^{42}$  は  $(C_1-C_6)$ -アルキルを表し、そして

$R^3$  は請求項 1 に示した一般式 (I) について定義した意味を有する、

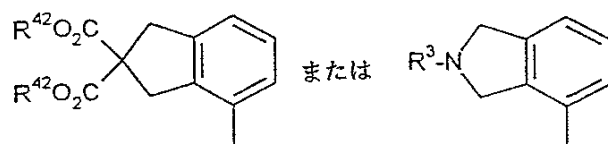
の化合物と反応させて一般式 (I j)



式中、

A、D、E、G、L 及び  $R^2$  は上記の意味を有し、そして

$R^{43}$  は



を表し、

ここで、 $R^{42}$ 及び $R^3$ は上記の意味を有する、

の化合物を生ぜしめ、

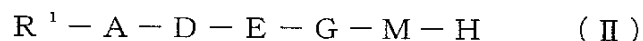
そして必要な場合、上記の置換基を常法に従って導入及び誘導化し、

そして対応するチオエーテル ( $D=S$ ) から出発する、 $D=-SO-$ または $-SO_2-$ の場合、常法に従って酸化を実施し、

そして対応するアミンから出発する、アンモニウム化合物の場合、アルキル化を実施する、

請求項1の式(I)の化合物の製造方法。

#### 4. 一般式(II)

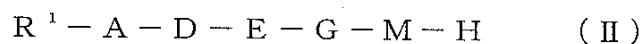


式中、

$R^1$ 、 $A$ 、 $D$ 、 $E$ 、 $G$ 及び $M$ は請求項1に示した一般式(I)について定義した意味を有し、そして  $M$ は酸素または $-N(R^{32})-$ を表し、そして $R^{32}$ は水素または $(C_1-C_4)$ -アルキルである、

の化合物。

#### 5. 一般式(II)



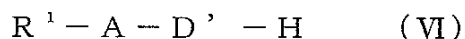
式中、

$R^1$ 、 $A$ 、 $D$ 、 $E$ 及び $G$ は請求項3に示した一般式(II)について定義した意味を有し、そして

Mは酸素または $-N(R^{32})-$ を表し、そして $R^{32}$ は水素または $(C_{1-4})$ -アルキルである、

の化合物の製造方法において、

[A] 不活性溶媒中で、必要な場合、塩基の存在下で、  
一般式 (VI)



式中、

$R^1$ 、A上記の意味を有し、そして $D'$ は請求項3に示した一般式 (II) について定義した意味を有する、

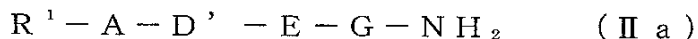
の化合物を一般式 (XI)



式中、

E及びGは請求項3に示した一般式 (II) について定義した意味を有し、そして

$R^{44}$ は脱離基、好ましくはハロゲンである、  
の化合物と反応させ、そして次に、不活性溶媒中で通例の還元剤、好ましくは $H_2/Pd/C$ とまたはヒドラジン水和物、 $Pd/C$ と反応させ、必要な場合、 $(C-C)$ 多重結合を同時に水素化して、一般式 (IIa)



式中、

$R^1$ 、A、 $D'$ 、E及びGは上に示した意味を有する、  
の化合物を生ぜしめるか、  
あるいは

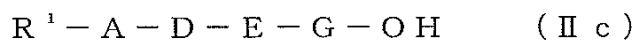
[B] 一般式 (IIb)



式中、

$R^1$ 、A、D、E 及び G は請求項 3 に示した一般式 (II) について定義した意味を有する、

の化合物をニトロソ化剤、好ましくは硫酸及び亜硝酸ナトリウムの水溶液と反応させ、続いて好ましくは 60 ないし 100° まで温めて、一般式 (II c)



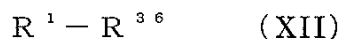
式中、

$R^1$ 、A、D、E 及び G は上記の意味を有する、

の化合物を生ぜしめるか、

あるいは

[C] 不活性溶媒、好ましくはジメチルホルムアミドまたはピリジン中で、必要な場合、塩基、好ましくは炭酸カリウムの存在下で、そして必要な場合、銅 (I / II) 塩、好ましくは酸化銅 (II) またはヨウ化銅 (I) の存在下で、0 °C から 200 °C まで、好ましくは 80 ないし 150 °C の温度範囲及び標準圧力で、  
一般式 (XII)

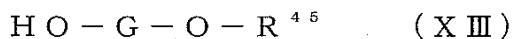


式中、

$R^1$  は請求項 3 に示した一般式 (II) について定義した意味を有し、  
そして

$R^{36}$  は脱離基、好ましくはハロゲン、特に好ましくは臭素を表す、  
の化合物を一般式 (X III)





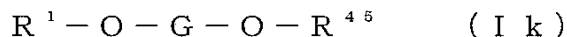
式中、

Gは請求項3に示した一般式(II)について定義した意味を有し、

そして

$\text{R}^{45}$ は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、好ましくはメチルを表す、

の化合物と反応させて、一般式(Ik)



式中、

$\text{R}^1$ 、G及び $\text{R}^{45}$ は請求項3に示した一般式(II)について定義した

意味を有する、

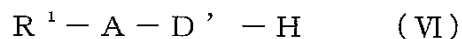
の化合物を生ぜしめ、そして次に酸、好ましくは臭化水素酸の存在下で反応させて、一般式(II d)



の化合物を生ぜしめるか、

あるいは

[D] 不活性溶媒中で、必要な場合、塩基の存在下で、  
一般式(VI)

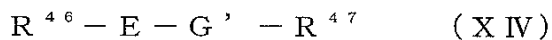


式中、

$\text{R}^1$ 、A及びD'は請求項3に示した一般式(II)について定義した

意味を有する、

の化合物を一般式(XIV)



式中、

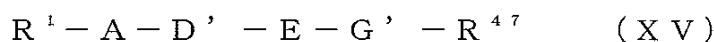
$R^{46}$ は $R^{36}$ に対して示した意味を有し、そしてこれと同一または異なり、

Eは請求項3に示した一般式(II)について定義した意味を有し、

$G'$ は硫黄、窒素及び／または酸素よりなる群からの3個までのヘテロ原子を有する二様に結合した5ないし7員の芳香族複素環を表し、それが場合により請求項1で一般式(I)においてGに対して定義したような1個またはそれより多い同一または異なる置換基で置換されていてもよく、そして

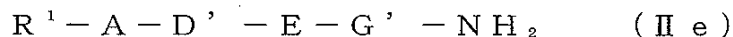
$R^{47}$ はハロゲン、好ましくは塩素または臭素を表す、

の化合物と反応させて、一般式(XV)



式中、

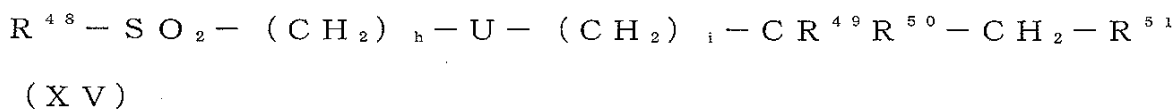
$R^1$ 、A、 $D'$ 、E、 $G'$ 及び $R^{47}$ は上記の意味を有する、  
の化合物を生ぜしめ、そして次に液体アンモニア中でカリウムアミドを用いて一般式(IIe)



式中、

$R^1$ 、A、 $D'$ 、E及び $G'$ は上記の意味を有する、  
の対応する遊離アミンに転化する、  
方法。

#### 6. 一般式(XV)



式中、

$R^{48}$ は脱離基であり、

Uは酸素または単結合であり、

$R^{49}$ 及び $R^{50}$ は同一または異なり、そしてH、F、ClまたはC

F<sub>3</sub>を表し、

$R^{51}$ はH、F、ClまたはBrであり、

hは数字1または2であり、そして

iは数字0または1である、

の化合物、但し

式中、

Uが単結合であり、

$R^{49}$ 及び $R^{50}$ が同一であり、HまたはFを表し、そして

$R^{51}$ がFを表す

化合物を除き、そして

式中、

Uが酸素であり、

$R^{49}$ または $R^{50}$ がClを表し、そして

iが0を表す

化合物を除く。

7. 少なくとも1つの製薬学的に許容しうる本質的に無毒のビヒクルまたは賦形剤と一緒に混合された請求項1または2のいずれかの少なくとも1つの化合物を有効成分として含んでなる製薬学的組成物。

8. 神経変性疾患の予防及び／または治療のための薬剤の製造のための請求項1または2のいずれかの化合物の使用。