

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
11. Mai 2006 (11.05.2006)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2006/048209 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 233/24 (2006.01) C07D 413/12 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01) C07D 405/12 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01) C07D 417/12 (2006.01)
C07D 233/26 (2006.01) A61K 31/4164 (2006.01)
C07D 233/36 (2006.01) A61K 31/4178 (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01) A61P 29/00 (2006.01)
C07D 401/10 (2006.01) A61P 11/00 (2006.01)
C07D 403/10 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/011602

(22) Internationales Anmeldedatum:
29. Oktober 2005 (29.10.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2004 054 053.5
5. November 2004 (05.11.2004) DE
10 2005 013 967.1 26. März 2005 (26.03.2005) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von DE, US): BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH [DE/DE]; Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim (DE).

(71) Anmelder (nur für DE): BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GMBH & CO. KG [DE/DE]; Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): KAUFFMANN-HEFNER, Iris [DE/DE]; Oelbachstrasse 10/1, 88448

Attenweiler (DE). HAUEL, Norbert [DE/DE]; Marderweg 12, 88433 Schemmerhofen (DE). DOODS, Henri [NL/DE]; Freiherr-von-Koenig-Str. 6, 88447 Warthausen (DE). CECI, Angelo [IT/DE]; Obere Schüegelestrasse 20, 88441 Mittelbiberach (DE). PETERS, Stefan [DE/DE]; Ulmenweg 12, 88400 Biberach (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH; Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

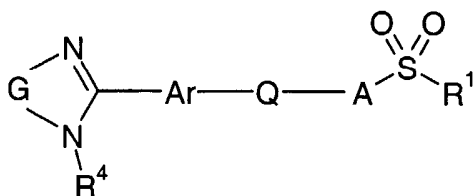
Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: NOVEL BRADYKININ B1 ANTAGONISTS, METHOD FOR PRODUCING THE SAME AND THE USE THEREOF AS DRUGS

(54) Bezeichnung: NEUE BRADYKININ-B1-ANTAGONISTEN, VERFAHREN ZU DEREN HERSTELLUNG SOWIE DEREN VERWENDUNG ALS ARZNEIMITTEL



(57) Abstract: The invention relates to the bradykinin B1 antagonists of general formula (I), wherein A, Ar, G, Q, R¹ and R⁴ are defined as in claim 1, to the enantiomers, diastereomers, mixtures and salts thereof, especially the physiologically acceptable salts thereof with organic or inorganic acids or bases. The inventive bradykinin B1 antagonists have valuable properties. The invention also relates to the production thereof, to the drugs comprising the pharmacologically effective compounds, to the production thereof and to their use.

(57) Zusammenfassung: Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Bradykinin-B1-Antagonisten der allgemeinen Formel (I) in der

A, Ar, G, Q, R¹ und R⁴ wie in Anspruch 1 definiert sind, deren Enantiomere, deren Diastereomere, deren Gemische und deren Salze, insbesondere deren physiologisch verträgliche Salze mit organischen oder anorganischen Säuren oder Basen, welche wertvolle Eigenschaften aufweisen, deren Herstellung, die die pharmakologisch wirksamen Verbindungen enthaltenden Arzneimittel, deren Herstellung und deren Verwendung.

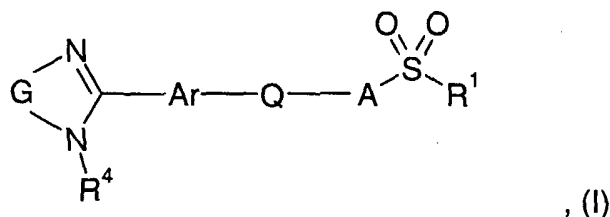
WO 2006/048209 A1



Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

Neue Bradykinin-B1-Antagonisten, Verfahren zu deren Herstellung sowie deren Verwendung als Arzneimittel

5 Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Bradykinin-B1-Antagonisten der allgemeinen Formel



10 in der A, Ar, G, Q, R¹ und R⁴ wie in Anspruch 1 definiert sind, deren Enantiomere, deren Diastereomere, deren Gemische und deren Salze, insbesondere deren physiologisch verträgliche Salze mit organischen oder anorganischen Säuren oder Basen, welche wertvolle Eigenschaften aufweisen, deren Herstellung, die die pharmakologisch wirksamen Verbindungen enthaltenden Arzneimittel, deren Herstellung und deren Verwendung.

15

In der obigen allgemeinen Formel (I) bedeuten in einer ersten Ausführungsform

R¹ eine Phenyl-, Naphthyl- oder Heteroarylgruppe, eine Phenyl-C₁₋₃-alkyl- oder C₃₋₇-Cycloalkylgruppe,

20

R⁴ ein Wasserstoffatom oder eine C₁₋₆-Alkylgruppe,

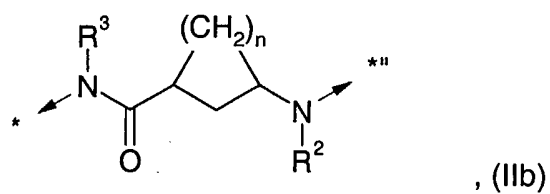
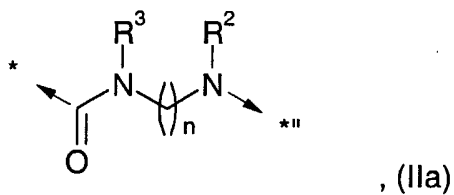
25

G die Gruppe -(CH₂)_m-, in der m die Zahl 2 oder 3 bedeutet und in der ein bis drei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch C₁₋₃-Alkylgruppen ersetzt sein können,

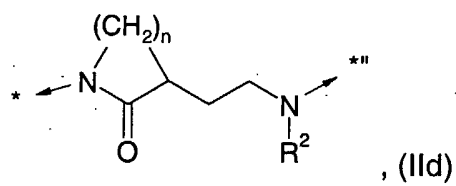
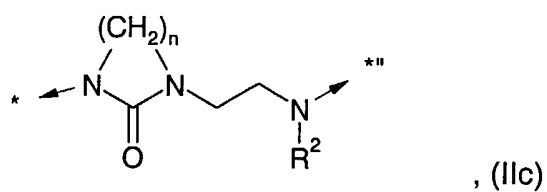
Ar eine Phenylen- oder Heteroarylengruppe,

Q die Gruppe $-(CH_2)_p-$, in der p die Zahl 2 oder 3 bedeutet und in der ein bis drei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch C_{1-3} -Alkylgruppen ersetzt sein können,

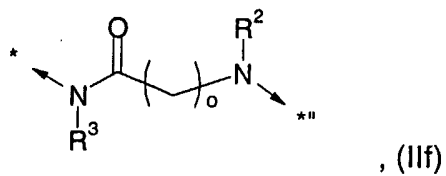
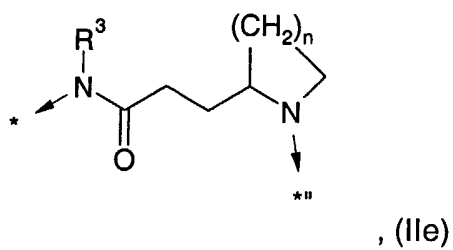
- 5 A einen über ein Stickstoffatom mit der Sulfonylgruppe in Formel (I) verknüpften Rest der allgemeinen Formel (IIa) bis (IIi)

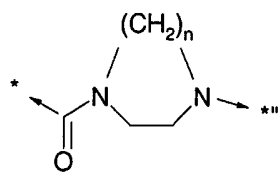


10

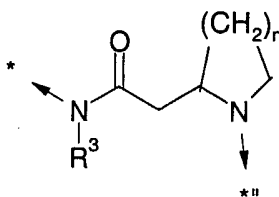


15

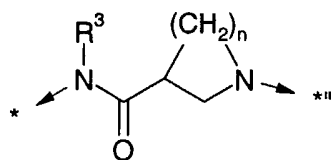




(Ilg)



(IIh)



, (Ili)

wobei die Verknüpfung der Reste (IIa) bis (Ili) mit der Sulfonylgruppe in Formel (I) bevorzugt über die mit ** gekennzeichnete Position erfolgt,

n die Zahl 2 oder 3,

o die Zahl 1, 2 oder 3,

R² ein Wasserstoffatom, eine C₁₋₆-Alkyl-, C₂₋₅-Alkenyl-methyl-, C₂₋₅-Alkinyl-methyl-, C₃₋₇-Cycloalkyl- oder eine Phenylgruppe und

R³ ein Wasserstoffatom, eine Phenyl-, C₁₋₆-Alkyl-, C₂₋₅-Alkenyl-methyl-, C₂₋₅-Alkinyl-methyl- oder C₃₋₇-Cycloalkylgruppe oder eine Gruppe -CH₂-CF₃, -CH₂-CHF₂ oder -CH₂-CH₂F sein kann,

wobei die in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen Phenyl- und Phenylengruppen durch Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome, durch C₁₋₅-Alkyl-, Trifluormethyl-, Amino-, C₁₋₃-Alkylamino-, Di-(C₁₋₃-alkyl)-amino-, Di-(C₁₋₃-alkyl)-amino-carbonylamino-, Nitro-, Cyano-, C₁₋₃-Alkylcarbonyl-, C₁₋₃-Alkylsulfonyl-,

Aminocarbonyl-, C₁₋₃-Alkylaminocarbonyl-, Di-(C₁₋₃-alkyl)-aminocarbonyl-,
Aminosulfonyl-, C₁₋₃-Alkylaminosulfonyl-, Di-(C₁₋₃-alkyl)-aminosulfonyl-, C₁₋₃-
Alkylcarbonylamino-, Carboxy-C₁₋₃-alkyl-, C₁₋₃-Alkyloxycarbonyl-C₁₋₃-alkyl-, Phenyl-,
Phenyloxy-, Hydroxy-, C₁₋₄-Alkyloxy-, Monofluormethyloxy-, Difluormethyloxy- oder
5 Trifluormethyloxygruppen oder durch N-Pyrrolidinocarbonyl-, N-Pyrrolidinosulfonyl-,
N-Piperidinocarbonyl- oder N-Piperidinosulfonyl-, wobei die in den voranstehend
genannten Piperidinringen enthaltene Methylengruppe in 4-Position durch O, S, SO,
SO₂, NH oder N(C₁₋₃-Alkyl) ersetzt sein kann, mono-, di-, tri- oder tetrasubstituiert
sein können und die Substituenten gleich oder verschieden sein können, jedoch die
10 Substitution durch zwei, drei oder vier Nitrogruppen ausgeschlossen ist,

wobei die in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen Naphthylgruppen
durch Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome, durch C₁₋₃-Alkyl-, Amino- oder Di-
(C₁₋₃-alkyl)-aminogruppen mono- oder disubstituiert sein können und die
15 Substituenten gleich oder verschieden sein können,

wobei, soweit nichts anderes erwähnt wurde, unter dem voranstehend in den Defini-
tionen erwähnten Ausdruck "Heteroarylgruppe" ein monocyclisches 5- oder
6-gliedriges oder ein bicyclisches 9- oder 10-gliedriges heterocyclisches,
20 aromatisches Ringsystem, das neben mindestens einem C-Atom ein oder mehrere
Heteroatome ausgewählt aus N, O und/oder S umfasst, zu verstehen ist,
beispielsweise

eine über ein Kohlenstoff- oder Stickstoffatom gebundene monocyclische 5-gliedrige
25 Heteroarylgruppe, die

eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl-, Phenyl- oder Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe
substituierte Iminogruppe, ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder

30 eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl-, Phenyl-, Amino-C₂₋₃-alkyl-,
C₁₋₃-Alkylamino-C₂₋₃-alkyl- oder Di-(C₁₋₃-alkyl)-amino-C₂₋₃-alkylgruppe, durch eine
4- bis 7-gliedrige Cycloalkylenimino-C₁₋₃-alkyl- oder Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe
substituierte Iminogruppe oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom und zusätzlich
ein Stickstoffatom oder

eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl- oder Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe substituierte Iminogruppe und zwei oder drei Stickstoffatome enthält, oder

5 eine monocyclische 6-gliedrige Heteroarylgruppe, die ein, zwei oder drei Stickstoffatome enthält, oder

eine bicyclische 9-gliedrige Heteroarylgruppe, bestehend aus einer der vorstehend
erwähnten 5-gliedrigen Heteroarylgruppen, die mit einem der vorstehend erwähnten
10 6-gliedrigen Heteroarylgruppen über zwei benachbarte Kohlenstoffatome oder ein
Kohlenstoff- und ein benachbartes Stickstoffatom zu einem Bicyclus kondensiert ist,
wobei die 5-gliedrige Heteroarylgruppe auch durch eine Cyclopentadienylgruppe
oder die 6-gliedrige Heteroarylgruppe auch durch einen Phenylring ersetzt sein kann,
oder

15 eine bicyclische 10-gliedrige Heteroarylgruppe, bestehend aus einem Phenylring und
einem der vorstehend erwähnten 6-gliedrigen Heteroarylgruppen oder aus zwei der
vorstehend erwähnten 6-gliedrigen Heteroarylgruppen, die jeweils über zwei
benachbarte Kohlenstoffatome zu einem Bicyclus kondensiert sind,

20 wobei die voranstehend erwähnten mono- und bicyclischen
Heteroarylgruppen zusätzlich im Kohlenstoffgerüst durch Fluor-, Chlor-, Brom-
oder Jodatome oder durch C₁₋₃-Alkylgruppen mono-, di- oder trisubstituiert und
die Substituenten gleich oder verschieden sein können, und

25 wobei unter dem voranstehend in den Definitionen erwähnten Ausdruck
"Heteroarylengruppe" die vorstehend erwähnten mono- oder bicyclischen
Heteroarylgruppen, die jedoch über zwei Kohlenstoffatome oder ein Kohlenstoff- und
30 ein Stickstoffatom mit den benachbarten Gruppen verknüpft sind, zu verstehen ist,

wobei die in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen Alkyl- und
Alkoxygruppen, die mehr als zwei Kohlenstoffatome aufweisen, soweit nichts
anderes erwähnt wurde, geradkettig oder verzweigt sein können, und

wobei die Wasserstoffatome der in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen Methyl- oder Ethylgruppen ganz oder teilweise durch Fluoratome ersetzt sein können,

5

deren Tautomere, deren Enantiomere, deren Diastereomere, deren Gemische und deren Salze.

Beispiele für monocyclische Heteroarylgruppen sind die Pyridyl-, *N*-Oxy-pyridyl-,
10 Pyrazolyl-, Pyridazinyl-, Pyrimidinyl-, Pyrazinyl-, [1,2,3]Triazinyl-, [1,3,5]Triazinyl-,
[1,2,4]Triazinyl-, Pyrrolyl-, Imidazolyl-, [1,2,4]Triazolyl-, [1,2,3]Triazolyl-, Tetrazolyl-,
Furanyl-, Isoxazolyl-, Oxazolyl-, [1,2,3]Oxadiazolyl-, [1,2,4]Oxadiazolyl-,
[1,2,5]Oxadiazolyl-, [1,3,4]Oxadiazolyl-, Thiophenyl-, Thiazolyl-, Isothiazolyl- oder
[1,2,4]Thiadiazolyl-Gruppe.

15

Beispiele für bicyclische Heteroarylgruppen sind die Benzimidazolyl, Benzofuranyl-,
Benzo[*c*]furanyl-, Benzo[*b*]thiophenyl-, Benzo[*c*]thiophenyl-, Benzothiazolyl-, Benzo-
[*c*]isothiazolyl-, Benzo[*d*]isothiazolyl-, Benzooxazolyl-, Benzo[*c*]isoxazolyl-, Benzo[*d*]-
isoxazolyl-, Benzo[1,2,5]oxadiazolyl-, Benzo[1,2,5]thiadiazolyl-, Benzo[1,2,3]thia-
20 diazolyl-, Benzo[*d*][1,2,3]triazinyl-, Benzo[1,2,4]triazinyl-, Benzotriazolyl-, Cinnolinyl-,
Chinolinyl-, *N*-Oxy-chinolinyl-, Indazolyl-, Purinyl-, Naphthyridinyl-, Pteridinyl-,
Isochinolinyl-, Chinazolinyl-, *N*-Oxy-chinazolinyl-, Chinoxalinyll-, Phthalazinyl-, Indolyl-,
Isoindolyl- oder Benzo[1,2,3]oxadiazolyl-Gruppe.

25 Beispiele für die voranstehend in den Definitionen erwähnten C₁₋₆-Alkylgruppen sind
die Methyl-, Ethyl-, 1-Propyl-, 2-Propyl-, *n*-Butyl-, *sec*-Butyl-, *tert*-Butyl-, 1-Pentyl-,
2-Pentyl-, 3-Pentyl-, *neo*-Pentyl-, 1-Hexyl-, 2-Hexyl- oder 3-Hexylgruppe.

Eine zweite Ausführungsform der vorliegenden Erfindung besteht in den
30 Verbindungen der obigen allgemeinen Formel (I), in denen

R¹ eine Phenyl-, Naphthyl-, oder Heteroarylgruppe, eine Phenyl-C₁₋₃-alkyl- oder
C₃₋₆-Cycloalkylgruppe,

R⁴ ein Wasserstoffatom oder eine C₁₋₄-Alkylgruppe,

G die Gruppe -(CH₂)_m-, in der m die Zahl 2 oder 3 bedeutet und in der ein bis drei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch C₁₋₃-Alkylgruppen, beispielsweise
5 Methylgruppen, ersetzt sein können,

Ar eine Phenylengruppe,

eine über ein Kohlenstoff- oder Stickstoffatom gebundene monocyclische 5-gliedrige
10 Heteroarylggruppe oder eine monocyclische 6-gliedrige Heteroarylggruppe,

Q die Gruppe -(CH₂)_p-, in der p die Zahl 2 oder 3 bedeutet und in der ein bis drei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch C₁₋₃-Alkylgruppen, beispielsweise Methylgruppen, ersetzt sein können,

15 A einen über ein Stickstoffatom mit der Sulfonylgruppe in Formel (I) verknüpften Rest der allgemeinen Formel (IIa), (IIb), (IIc), (IId), (IIe), (IIf), (IIg), (IIh) oder (IIi),

wobei die Verknüpfung der Reste (IIa) bis (IIi) mit der Sulfonylgruppe in Formel (I) bevorzugt über die mit "*" gekennzeichnete Position erfolgt und

20

n die Zahl 2 oder 3,

o die Zahl 1, 2 oder 3,

25 R² ein Wasserstoffatom, eine C₁₋₄-Alkyl-, C₂₋₅-Alkenyl-methyl-, C₃₋₆-Cycloalkyl- oder eine Phenylgruppe und

R³ ein Wasserstoffatom, eine C₁₋₄-Alkyl-, C₂₋₅-Alkenyl-methyl- oder C₃₋₆-Cycloalkylgruppe oder eine C₁₋₃-Alkylgruppe, in der jede Methylgruppe mit
30 bis zu drei und jede Methylengruppe mit bis zu zwei Fluoratomen substituiert sein kann darstellen,

bedeuten, wobei die in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen Phenyl- und Phenylengruppen durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome, durch

C₁₋₅-Alkyl-, Trifluormethyl-, Amino-, C₁₋₃-Alkylamino-, Di-(C₁₋₃-alkyl)-amino-, Di-(C₁₋₃-alkyl)-amino-carbonylamino-, Nitro-, Cyano-, C₁₋₃-Alkylcarbonyl-, C₁₋₃-Alkylsulfonyl-, Aminocarbonyl-, C₁₋₃-Alkylaminocarbonyl-, Di-(C₁₋₃-alkyl)-aminocarbonyl-, Aminosulfonyl-, C₁₋₃-Alkylaminosulfonyl-, Di-(C₁₋₃-alkyl)-aminosulfonyl-, C₁₋₃-Alkylcarbonylamino-, Phenyl-, Phenoxy-, Hydroxy-, C₁₋₄-Alkyloxy-, Monofluormethoxy-, Difluormethoxy- oder Trifluormethoxygruppen oder durch *N*-Pyrrolidinocarbonyl-, *N*-Pyrrolidinosulfonyl-, *N*-Piperidinocarbonyl- oder *N*-Piperidinosulfonyl-, wobei die in den voranstehend genannten Piperidinringen enthaltene Methylengruppe in 4-Position durch O, S, SO, SO₂, NH oder N(C₁₋₃-Alkyl) ersetzt sein kann, mono-, di-, tri- oder tetrasubstituiert sein können und die Substituenten gleich oder verschieden sein können, jedoch die Substitution durch zwei, drei oder vier Nitrogruppen ausgeschlossen ist,

wobei die in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen Naphthylgruppen durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome, durch C₁₋₃-Alkyl-, Amino- oder Di-(C₁₋₃-alkyl)-aminogruppen mono- oder disubstituiert sein können und die Substituenten gleich oder verschieden sein können,

wobei, soweit nichts anderes erwähnt wurde, unter einer "Heteroarylgruppe" ein monocyclisches 5- oder 6-gliedriges oder ein bicyclisches 9- oder 10-gliedriges heterocyclisches, aromatisches Ringsystem zu verstehen ist, beispielsweise

eine über ein Kohlenstoff- oder Stickstoffatom gebundene monocyclische 5-gliedrige Heteroarylgruppe, die

eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl-, Phenyl- oder Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe substituierte Iminogruppe, ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder

eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl- oder Phenylgruppe, durch eine 5- bis 7-gliedrige Cycloalkylenimino-C₁₋₃-alkyl- oder eine Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe substituierte Iminogruppe oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom und zusätzlich ein Stickstoffatom oder

eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl- oder Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe substituierte Iminogruppe und zusätzlich zwei Stickstoffatome enthält, oder

5 eine monocyclische 6-gliedrige Heteroarylgruppe, die ein oder zwei Stickstoffatome enthält, oder

eine bicyclische 9-gliedrige Heteroarylgruppe, bestehend aus einer der vorstehend erwähnten 5-gliedrigen Heteroarylgruppen, die mit einem der vorstehend erwähnten 6-gliedrigen Heteroarylgruppen über zwei benachbarte Kohlenstoffatome oder ein Kohlenstoff- und ein benachbartes Stickstoffatom zu einem Bicyclus kondensiert ist, wobei die 5-gliedrige Heteroarylgruppe auch durch eine Cyclopentadienylgruppe oder die 6-gliedrige Heteroarylgruppe auch durch einen Phenylring ersetzt sein kann, oder

15 eine bicyclische 10-gliedrige Heteroarylgruppe, bestehend aus einem Phenylring und einem der vorstehend erwähnten 6-gliedrigen Heteroarylgruppen oder aus zwei der vorstehend erwähnten 6-gliedrigen Heteroarylgruppen, die jeweils über zwei benachbarte Kohlenstoffatome zu einem Bicyclus kondensiert sind,

20 wobei die voranstehend erwähnten mono- und bicyclischen Heteroarylgruppen zusätzlich im Kohlenstoffgerüst durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome oder durch C₁₋₃-Alkylgruppen mono-, di- oder trisubstituiert und die Substituenten gleich oder verschieden sein können, und

25 wobei unter dem voranstehend in den Definitionen erwähnten Ausdruck "Heteroarylggruppe" die vorstehend erwähnten mono- oder bicyclischen Heteroarylgruppen, die jedoch über zwei Kohlenstoffatome oder ein Kohlenstoff- und ein Stickstoffatom mit den benachbarten Gruppen verknüpft sind, zu verstehen ist,

30 wobei die in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen Alkyl- und Alkoxygruppen, die mehr als zwei Kohlenstoffatome aufweisen, soweit nichts anderes erwähnt wurde, geradkettig oder verzweigt sein können, und

wobei die Wasserstoffatome der in den voranstehend erwähnten Definitionen

enthaltenen Methyl- oder Ethylgruppen ganz oder teilweise durch Fluoratome ersetzt sein können,

deren Tautomere, deren Enantiomere, deren Diastereomere, deren Gemische und
5 deren Salze.

Eine dritte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung besteht in den Verbindungen der obigen allgemeinen Formel (I), in denen

10 R¹ eine gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome, Nitro-, Cyano-, C₁₋₃-Alkylsulfonyl-, C₁₋₅-Alkyl-, Trifluormethyl-, Hydroxy-, C₁₋₅-Alkyloxy-, Trifluormethoxy-, Phenyl-, Morpholin-4-ylsulfonyl-, Phenyl-, Dimethylaminocarbonylamino-, Amino-, Methylcarbonylamino-, Dimethylamino-, Carboxy-C₁₋₃-alkyl- oder C₁₋₃-Alkyloxycarbonyl-C₁₋₃-alkylgruppen mono-, di- oder
15 trisubstituierte Phenyl- oder Phenylmethylgruppe, wobei die Substituenten gleich oder verschieden sein können und die Mehrfachsubstitution durch zwei oder drei Nitrogruppen ausgeschlossen ist,

eine gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome, Cyano-, C₁₋₃-Alkyl-,
20 Trifluormethyl-, C₁₋₃-Alkyloxy- oder Trifluormethoxygruppen tetrasubstituierte Phenylgruppe, wobei die Substituenten gleich oder verschieden sein können,

eine gegebenenfalls durch Chlor- oder Bromatome oder Methyl-, Amino-, Methylamino- oder Dimethylaminogruppen mono-, di- oder trisubstituierte
25 Benzo[b]thiophenyl-, Chinolinyl-, Naphthyl-, Benzo[1,2,5]oxadiazolyl-, Furanyl-, Thiophenyl-, Imidazolyl-, Thiazolyl-, Pyrazolyl-, Pyridinyl- oder Isoxazolylgruppe oder

eine C₃₋₆-Cycloalkylgruppe, beispielsweise die Cyclopropylgruppe,

30 R⁴ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe,

G die Gruppe $-(CH_2)_m-$, in der m die Zahl 2 oder 3 bedeutet oder

die Gruppe $-(CH_2)_m-$, in der m die Zahl 2 oder 3 bedeutet und in der ein, zwei oder drei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch Methyl- oder Ethylgruppen ersetzt sind,

5 Ar eine Phenylengruppe,

Q die Gruppe $-(CH_2)_p-$, in der p die Zahl 2 bedeutet, oder

10 die Gruppe $-(CH_2)_p-$, in der p die Zahl 2 bedeutet und in der ein oder zwei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch Methyl- oder Ethylgruppen ersetzt sind,

A einen über die mit "*" gekennzeichnete Position mit der Sulfonylgruppe in Formel (I) verknüpften Rest der allgemeinen Formel (IIa), (IIb), (IIc), (IId), (IIe), (IIf), (IIg), (IIh) oder (IIi),

worin

n die Zahl 2 oder 3,

20

o die Zahl 1, 2 oder 3,

R^2 ein Wasserstoffatom, eine C_{1-3} -Alkyl-, Cyclopropyl- oder eine Phenylgruppe und

25

R^3 ein Wasserstoffatom, eine Cyclopropylgruppe, eine geradkettige oder verzweigte C_{1-3} -Alkylgruppe, eine F_3C-CH_2- , F_2CH-CH_2- oder H_2FC-CH_2- Gruppe darstellen,

30 bedeuten, deren Tautomere, deren Enantiomere, deren Diastereomere, deren Gemische und deren Salze.

Eine vierte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung besteht in den Verbindungen der obigen allgemeinen Formel (I), in denen

R¹ eine Isopropyl-, Cyclopropyl-, Phenyl-, Phenylmethyl-, 2,4-Dichlorphenylmethyl-, 2-Chlorphenyl-, 3-Chlorphenyl-, 4-Chlorphenyl-, 2-Bromphenyl-, 3-Bromphenyl-, 4-Bromphenyl-, 3-Fluorphenyl-, 4-Fluorphenyl-, 2,3-Dichlorphenyl-, 2,4-
5 Dichlorphenyl-, 2,5-Dichlorphenyl-, 2,6-Dichlorphenyl-, 3,4-Dichlorphenyl-, 3,5-Dichlorphenyl-, 2,4,5-Trichlorphenyl-, 3,4-Difluorphenyl-, 2-Chlor-4-fluorphenyl-, 2-Chlor-4-cyanphenyl-, 5-Fluor-2-methylphenyl-, 2-Chlor-6-methylphenyl-, 2-Chlor-4-trifluormethylphenyl-, 3-Chlor-2-methylphenyl-, 4-Amino-3,5-dichlorphenyl-, 4-Amino-2,5-dichlorphenyl-, 4-Chlor-2,5-dimethylphenyl-, 2,4-Dichlor-
10 5-methylphenyl-, 3,5-Dichlor-4-hydroxyphenyl-, 4-(Morpholin-4-ylsulfonyl)-phenyl-, 4-Chlor-3-nitrophenyl-, 3-Methylsulfonylphenyl-, 4-Methylsulfonylphenyl-, 4-Cyanphenyl-, 2-Nitrophenyl-, 3-Nitrophenyl-, 4-Nitrophenyl-, 4-Nitro-3-fluorphenyl-, 4-Nitro-3-trifluormethylphenyl-, 4-Methoxy-2-nitrophenyl-, 2-Trifluormethoxyphenyl-, 2-Methylphenyl-, 3-Methylphenyl-, 4-Methylphenyl-, 2-Trifluormethylphenyl-,
15 3-Trifluormethylphenyl-, 4-Trifluormethylphenyl-, 4-Propylphenyl-, 4-Isopropylphenyl-, 4-*tert.*-Butylphenyl-, 4-Pentylphenyl-, 4-(3-Methoxycarbonylpropyl)-phenyl-, 2,4,6-Trimethylphenyl-, 2,5-Dimethylphenyl-, 3,5-Dimethylphenyl-, 2,4,6-Trimethylphenyl-, 2,3,5,6-Tetramethylphenyl-, 4-Methoxy-2,3,6-trimethylphenyl-, 4-Butoxyphenyl-, 4-Methoxyphenyl-, 4-Trifluormethoxyphenyl-, 2,5-Dimethoxyphenyl-,
20 3,4-Dimethoxyphenyl-, 4-Chlor-2-methoxyphenyl-, 5-Chlor-2-methoxyphenyl-, 4-Acetylaminophenyl-, 4-Acetylamino-3-chlorphenyl-, 4-(3,3-Dimethylureido)-phenyl-, 4-Phenoxyphenyl-, Benzyl-, 2-Chlorbenzyl-, 2,4-Dichlorbenzyl-, Biphen-4-yl-, Benzo[b]thiophen-2-yl-, Benzo[b]thiophen-3-yl-, Chinolin-8-yl-, Isochinolin-1-yl-, Isochinolin-3-yl-, Naphthalin-1-yl-, Naphthalin-2-yl-, 4-Chlornaphthalin-1-yl-,
25 5-Chlornaphthalin-1-yl-, 5-Dimethylaminonaphthalin-1-yl-, Benzo[1,2,5]oxadiazol-4-yl-, Furan-2-yl-, Furan-3-yl-, Thiophen-2-yl-, Thiophen-3-yl-, 4,5-Dichlorthiophen-2-yl-, 5-Chlorthiophen-2-yl-, 1,2-Dimethyl-1*H*-imidazol-4-yl-, 2-Methyl-1*H*-imidazol-4-yl-, 4-Brom-5-chlorthiophen-2-yl-, 3-Brom-5-chlorthiophen-2-yl-, 2,4-Dimethylthiazol-5-yl-, 5-Chlor-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-4-yl-, Pyridin-2-yl-, Pyridin-
30 3-yl-, Pyridin-4-yl-, 3,5-Dimethylisoxazol-4-yl- oder 1-Methyl-1*H*-imidazol-4-ylgruppe,

R⁴ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe,

G die Gruppe $-(CH_2)_m-$, in der m die Zahl 2 oder 3 bedeutet oder

die Gruppe $-(CH_2)_m-$, in der m die Zahl 2 oder 3 bedeutet und in der ein oder zwei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch Methylgruppen ersetzt sind,

- 5 Ar eine gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome, Cyano-, C_{1-3} -Alkyl-, Trifluormethyl-, C_{1-3} -Alkyloxy- oder Trifluormethoxygruppen unabhängig voneinander mono- oder disubstituierte, vorzugsweise jedoch unsubstituierte Phenylengruppe,

Q die Gruppe $-(CH_2)_p-$, in der p die Zahl 2 bedeutet, oder

10

die Gruppe $-(CH_2)_p-$, in der p die Zahl 2 bedeutet und in der ein oder zwei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch Methylgruppen ersetzt sind,

- 15 A einen über die mit "*" gekennzeichnete Position mit der Sulfonylgruppe in Formel (I) verknüpften Rest der allgemeinen Formel (IIa), (IIb), (IIc), (IId), (IIe), (IIf), (IIg), (IIh) oder (IIi), vorzugsweise jedoch einen Rest der Formel (IIa), (IIb), (IIc), (IIe), (IIf), (IIg), (IIh) oder (IIi),

worin

20

n die Zahl 2 oder 3,

o die Zahl 1, 2 oder 3,

- 25 R^2 ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, Ethyl-, n-Propyl-, i-Propyl-, Cyclopropyl- oder Phenylgruppe und

- R^3 ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, Ethyl-, n-Propyl-, i-Propyl-, 2-Monofluorethyl-, 2,2-Difluorethyl-, 2,2,2-Trifluorethyl- oder Cyclopropylgruppe darstellen,

30

bedeuten, wobei die vorstehend genannten Phenylgruppen oder die in den vorstehend genannten Resten enthaltene Phenylgruppen, sofern nichts anderes erwähnt wurde, unabhängig voneinander durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome,

Cyano-, C₁₋₃-Alkyl-, Trifluormethyl-, C₁₋₃-Alkyloxy- oder Trifluormethoxygruppen mono- oder disubstituiert sein können, vorzugsweise jedoch unsubstituiert sind,

deren Tautomere, deren Enantiomere, deren Diastereomere, deren Gemische und
5 deren Salze.

Als ganz besonders bevorzugte Verbindungen der obigen allgemeinen Formel (I) seien beispielsweise folgende genannt:

- 10 (1) 3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (2) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 15 (3) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-phenylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (4) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-isopropylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 20 (5) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-cyclopropylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (6) 2-(Benzolsulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylacetamid,
- 25 (7) 3-(Benzolsulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 30 (8) 3-[1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-piperidin-2-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (9) 3-[1-(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-piperidin-2-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-

1 *H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylpropionamid,

(10) 3-(1-Benzolsulfonylpiperidin-2-yl)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylpropionamid,

5

(11) 3-[1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-pyrrolidin-2(*S*)-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylpropionamid,

(12) 1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-piperidin-3-carbonsäure-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-methylamid,

10

(13) *N*-{3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-propionamid,

15

(14) *N*-{3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methylpropionamid,

(15) 3-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methyl-*N*-{3-[phenyl-(toluol-4-sulfonyl)-amino]-propyl}-propionamid,

20

(16) *N*-{2-[(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-propionamid,

(17) 2,3-Dichlor-*N*-[2-(3-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-2-oxoimidazolidin-1-yl)-ethyl]-*N*-methylbenzolsulfonamid,

25

(18) 2,3-Dichlor-*N*-[2-(3-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-2-oxotetrahydropyrimidin-1-yl)-ethyl]-*N*-methylbenzolsulfonamid,

(19) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methyl-*N*-{2-[4-(1-methyl-4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-butyramid,

30

(20) 3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-cyclohexancarbonsäure-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-methylamid,

- (21) 3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-cyclopentancarbonsäure-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-methylamid,
- 5 (22) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-ethylbutyramid,
- (23) *N*-Cyclopropyl-4-[(2,3-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-butyramid,
- 10 (24) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-butyramid,
- (25) 3-[(2,5-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 15 (26) 3-[(Benzo[*b*]thiophene-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 20 (27) 3-[(2-Chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (28) 2-[1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-pyrrolidin-2-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylacetamid,
- 25 (29) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(2,4,6-trimethylbenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,
- (30) 3-[(2-Chlor-6-methylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 30 (31) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(chinolin-8-sulfonyl)-amino]-propionamid,

- (32) 3-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methyl-*N*-{2-[methyl-(2,4,6-trimethyl-benzolsulfonyl)-amino]-ethyl}-propionamid,
- (33) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(4-trifluormethoxy-benzol-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,
- 5 (34) *N*-{2-[(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methylpropionamid,
- 10 (35) 3-[(5-Chlor-2-methoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (36) *N*-{2-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methylpropionamid,
- 15 (37) 3-(Cyclopropansulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (38) 1-[4-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-[1,4]diazepan-1-yl]-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-propan-1-on,
- 20 (39) 1-[4-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-piperazin-1-yl]-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-propan-1-on,
- (40) 2-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylacetamid,
- 25 (41) 3-[(3,5-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 30 (42) 3-(Benzolsulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (43) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-

propylbenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,

- 5
- (44) 3-[(4-Chlor-3-nitrobenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (45) 3-[(2-Chlor-6-methyl-benzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 10 (46) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(4-isopropylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,
- (47) 3-[(5-Chlornaphthalin-1-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 15 (48) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(toluol-4-sulfonyl)-amino]-propionamid,
- (49) 3-[(2-Brombenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 20 (50) 3-[(2,4-Dichlor-5-methyl-benzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (51) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-{methyl-[4-(morpholin-4-sulfonyl)-benzolsulfonyl]-amino}-propionamid,
- 25 (52) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(3-nitrobenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,
- 30 (53) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(2-trifluormethoxybenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,
- (54) 3-[(Benzo[1,2,5]oxadiazole-4-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

- (55) 3-[(2-Chlor-4-trifluormethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 5 (56) 3-[(4-Butoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (57) 3-[(3,4-Difluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 10 (58) 3-[(3,5-Dichlor-4-hydroxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (59) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-
- 15 (naphthalin-1-sulfonyl)-amino]-propionamid,
- (60) 3-[(2,4-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 20 (61) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-pentylbenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,
- (62) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(3,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,
- 25 (63) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-(methylphenylmethansulfonylamino)-propionamid,
- (64) 3-[(2-Chlor-4-fluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 30 (65) 3-[(2-Chlor-4-cyanbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

- (66) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(3-methansulfonyl-benzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,
- (67) 3-[(Biphenyl-4-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (68) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(5-fluor-2-methyl-benzol-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,
- (69) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-nitrobenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,
- (70) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[[4-(3,3-dimethyl-ureido)-benzolsulfonyl]-methylamino]-*N*-methylpropionamid,
- (71) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,
- (72) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(furan-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,
- (73) 3-[(2-Chlorphenylmethansulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (74) 3-[(2,6-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (75) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(4-methoxy-2-nitro-benzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,
- (76) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(thiophen-3-sulfonyl)-amino]-propionamid,
- (77) 3-[(Benzo[b]thiophen-3-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-

imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylpropionamid,

(78) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(5-dimethylamino-naphthalin-1-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,

5

(79) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(toluol-2-sulfonyl)-amino]-propionamid,

(80) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-phenoxy-benzolsulfonyl)-amino]-propionamid,

10

(81) 3-[(2,4-Dichlorphenylmethansulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

(82) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(4-methoxy-2,3,6-trimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,

15

(83) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-nitro-3-trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,

20

(84) 4-[(5-Chlorthiophen-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,

(85) 4-[(2-Chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,

25

(86) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,

(87) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(1,2-dimethyl-1*H*-imidazol-4-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,

30

(88) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(4-methansulfonyl-benzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,

- (89) 4-[(3-Brombenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 5 (90) 4-[(4-Brom-5-chlorthiophen-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (91) 4-[(3-Brom-5-chlorthiophen-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 10 (92) 4-[(4,5-Dichlorthiophen-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (93) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(2,4-dimethylthiazol-5-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid
- 15 (94) 4-[(5-Chlor-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-4-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (95) 4-[(4-Amino-3,5-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 20 (96) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(2,4,5-trichlorbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- 25 (97) 4-[(2,5-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (98) 4-[(3,4-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 30 (99) 4-[(4-Brombenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,

- (100) 4-[(4-Fluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (101) 4-[(3-Fluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 5 (102) 4-[(4-Chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (103) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(2-trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- (104) 4-[(5-Chlor-2-methoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 15 (105) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(toluol-3-sulfonyl)-amino]-butyramid,
- (106) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(4-methoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- 20 (107) 4-[(4-Acetylamino-3-chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (108) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(2,5-dimethoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- 25 (109) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(3,4-dimethoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- 30 (110) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(2,4,6-trimethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- (111) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-

(naphthalin-2-sulfonyl)-amino]-butyramid,

(112) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(2,3,5,6-tetramethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,

5

(113) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(2-nitromethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,

(114) 4-[(4-Cyanbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,

10

(115) 4-[(4-Amino-2,5-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,

15

(116) 4-[(4-*tert.*-Butylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,

(117) 4-[(4-Butoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,

20

(118) 4-[(2,4-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,

(119) 4-[(2-Chlor-4-fluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,

25

(120) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(5-fluor-2-methylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,

30

(121) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(4-methoxy-2-nitrobenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,

(122) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(toluol-2-sulfonyl)-amino]-butyramid,

- (123) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(4-methoxy-2,3,6-trimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- 5 (124) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-propylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- (125) 4-[(2,4-Dichlor-5-methylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 10 (126) 4-[(3,4-Difluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (127) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-pentylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- 15 (128) 4-[(2-Chlor-4-cyanbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (129) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-nitromethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- 20 (130) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(furan-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- 25 (131) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(furan-3-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- (132) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(thiophen-3-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- 30 (133) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-phenoxybenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,

- (134) 4-[(5-Chlornaphthalene-1-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (135) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-{methyl-[4-(morpholin-4-sulfonyl)-benzolsulfonyl]-amino}-butyramid,
- (136) 4-[(2-Chlor-4-trifluormethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (137) 4-[(3,5-Dichlor-4-hydroxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (138) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(3,5-dimethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- (139) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(3-methansulfonyl-benzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- (140) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[[4-(3,3-dimethylharnstoff)-benzolsulfonyl]-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- (141) 4-[(Benzo[*b*]thiophen-3-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (142) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-nitro-3-trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- (143) 4-[(4-Chlor-3-nitrobenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (144) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(toluol-4-sulfonyl)-amino]-butyramid,
- (145) 4-[(4-Acetylaminobenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-

imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

(146) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methyl-4-[methyl-(3-nitromethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,

5

(147) 4-(Benzolsulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

(148) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methyl-4-[methyl-(naphthalin-1-sulfonyl)-amino]-butyramid,

10

(149) 4-(Biphenyl-4-sulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

15

(150) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methyl-4-[methyl-(4-trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,

(151) 4-[(2,6-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

20

(152) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-4-[(5-dimethylamino naphthalin-1-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,

(153) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-4-[(thiophen-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,

25

(154) 3-(4-[[3-({2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-methylcarbamoyl]-propyl]-methylsulfamoyl]-phenyl)-propionsäuremethylester,

30

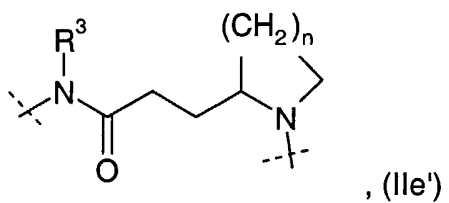
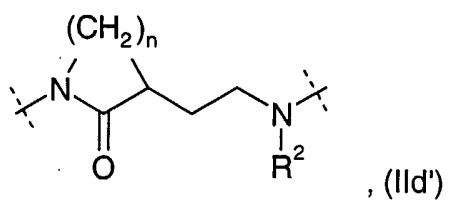
(155) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methyl-4-[methyl-(pyridin-2-sulfonyl)-amino]-butyramid,

(156) 4-[(3-Chlor-2-methylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

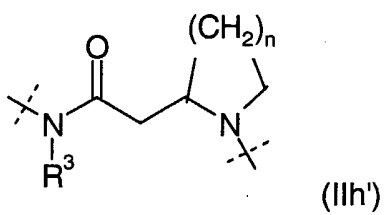
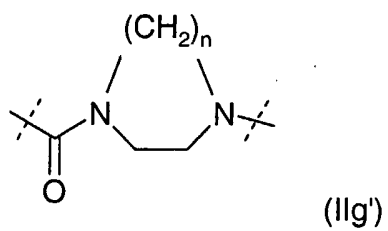
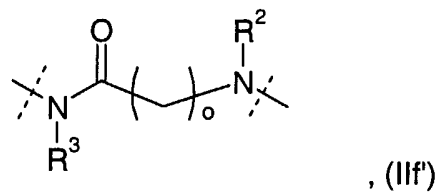
- (157) 4-[(3-Chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 5 (158) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(3-trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- (159) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(3,5-dimethylisoxazol-4-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- 10 (160) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(1-methyl-1*H*-imidazol-4-sulfonyl)-amino]-butyramid,
- (161) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-propylbutyramid,
- 15 (162) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-isopropylbutyramid,
- (163) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-(2,2,2-trifluorethyl)-butyramid,
- 20 (164) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-(2-fluorethyl)-butyramid,
- 25 (165) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-(2,2-difluorethyl)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-butyramid,
- (166) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-phenylbutyramid,
- 30

deren Tautomere, deren Enantiomere, deren Gemische und deren Salze.

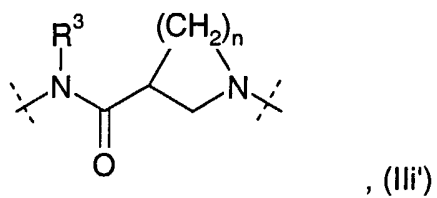
Eine weitere, besonders zu erwähnende Ausführungsform der vorliegenden



5



10



worin

15 n die Zahl 2 oder 3,

o die Zahl 1, 2 oder 3,

R² ein Wasserstoffatom, eine C₁₋₆-Alkyl-, C₂₋₃-Alkenyl-, C₂₋₃-Alkinyl-, C₃₋₇-Cycloalkyl- oder eine Phenylgruppe und

5

R³ ein Wasserstoffatom, eine C₁₋₆-Alkyl-, C₂₋₃-Alkenyl-, C₂₋₃-Alkinyl- oder C₃₋₇-Cycloalkylgruppe darstellen,

bedeuten, wobei, soweit nichts anderes erwähnt wurde, unter dem voranstehend in
10 den Definitionen erwähnten Ausdruck "Heteroarylgruppe" eine monocyclische 5- oder 6-gliedrige Heteroarylgruppe zu verstehen ist, wobei

die 6-gliedrige Heteroarylgruppe ein, zwei oder drei Stickstoffatome und

15 die 5-gliedrige Heteroarylgruppe eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl-, Phenyl- oder Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe substituierte Iminogruppe, ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder

eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl-, Phenyl-, Amino-C₂₋₃-alkyl-, C₁₋₃-Alkyl-
20 amino-C₂₋₃-alkyl-, Di-(C₁₋₃-alkyl)-amino-C₂₋₃-alkyl-, eine 4- bis 7-gliedrige Cycloalkylenimino-C₁₋₃-alkyl- oder Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe substituierte Iminogruppe oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom und zusätzlich ein Stickstoffatom oder

eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl- oder Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe substi-
25 tuierte Iminogruppe und zwei oder drei Stickstoffatome enthält,

wobei die in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen Alkyl- und Alkoxygruppen, die mehr als zwei Kohlenstoffatome aufweisen, soweit nichts
anderes erwähnt wurde, geradkettig oder verzweigt sein können,

30

wobei die Wasserstoffatome der in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen Methyl- oder Ethylgruppen ganz oder teilweise durch Fluoratome ersetzt sein können und

wobei die in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen Phenylgruppen durch Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome, C₁₋₃-Alkyl-, Trifluormethyl-, C₁₋₃-Alkyloxy- oder Trifluormethoxygruppen mono-, di- oder trisubstituiert sein können,

- 5 deren Tautomere, deren Enantiomere, deren Diastereomere, deren Gemische und deren Salze.

Eine zweite, besonders zu erwähnende Ausführungsform der vorliegenden Erfindung besteht in den Verbindungen der allgemeinen Formel (I'), in denen

10

R¹ eine gegebenenfalls durch Chloratome oder Methylgruppen mono-, di- oder trisubstituierte Phenylgruppe, wobei die Substituenten gleich oder verschieden sein können,

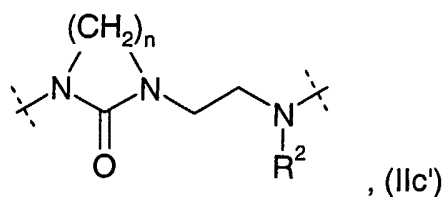
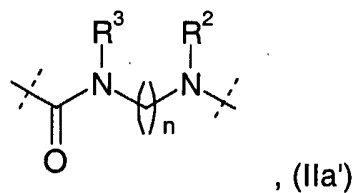
- 15 R⁴ ein Wasserstoffatom,

m die Zahl 2,

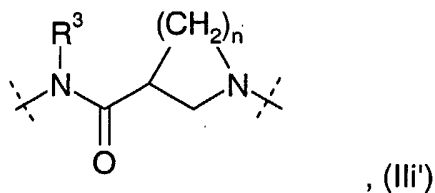
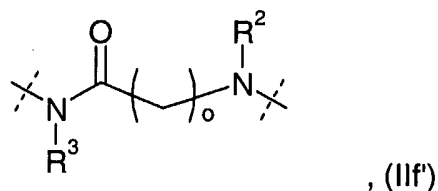
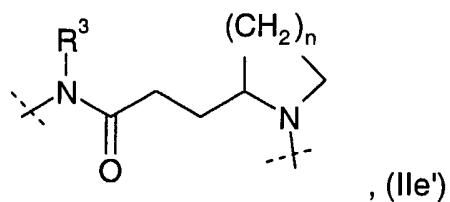
Ar eine Phenylengruppe,

20

A einen Rest der allgemeinen Formel



25



5

worin

n die Zahl 2 oder 3,

10

o die Zahl 1, 2 oder 3,

R² ein Wasserstoffatom, eine C₁₋₃-Alkyl-, Cyclopropyl- oder eine Phenylgruppe
und

15

R³ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe,

deren Tautomere, deren Enantiomere, deren Diastereomere, deren Gemische und
deren Salze.

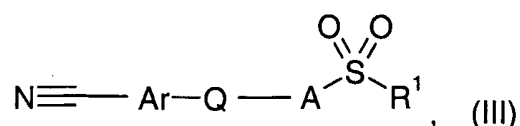
20

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) werden nach prinzipiell bekannten
Methoden hergestellt. Die folgenden Verfahren haben sich zur Herstellung der
erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) besonders bewährt:

- (a) Zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in der R^1 , R^4 , G, A, Q und Ar wie eingangs erwähnt definiert sind:

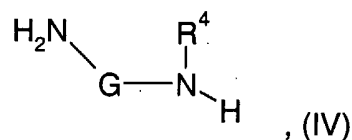
Umsetzung eines Nitrils der allgemeinen Formel

5



in der R^1 , A, Q und Ar wie eingangs erwähnt definiert sind, mit einem Diamin der allgemeinen Formel

10



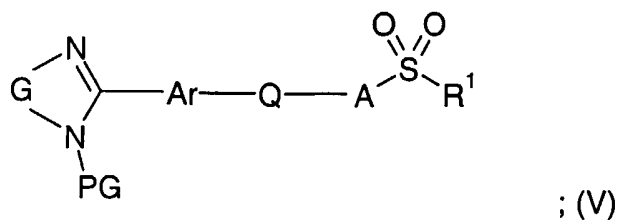
in der G und R^4 wie eingangs erwähnt definiert sind.

- 15 Die Umsetzung erfolgt bevorzugt bei einer Temperatur von 40°C bis 150°C in einem Lösungsmittel, wie z.B. Tetrahydrofuran, Dioxan, *n*-Hexan, Cyclohexan, Benzol, Toluol oder Xylol. Die Umsetzung wird unter Zusatz von P_2S_5 oder Schwefel durchgeführt.

- 20 (b) Zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in der R^1 , R^4 , G, A, Q und Ar wie eingangs erwähnt definiert sind:

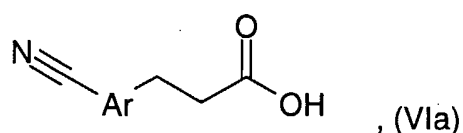
Abspaltung der Schutzgruppe PG von einer Verbindung der allgemeinen Formel

25

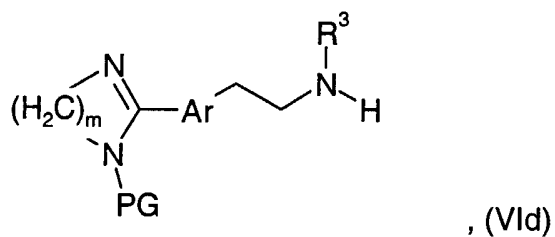
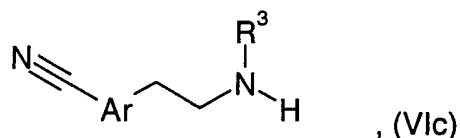
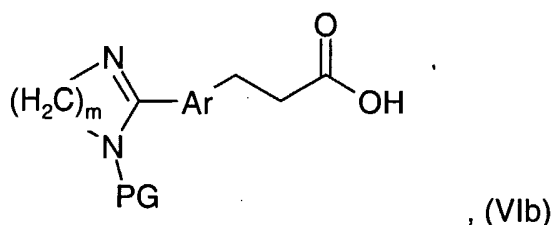


in der R¹, G, A, Q und Ar wie eingangs erwähnt definiert sind und PG eine Amin-Schutzgruppe, beispielsweise die *tert.*-Butyloxycarbonyl-Schutzgruppe, die Benzyloxycarbonyl-, Methoxycarbonyl- oder Ethoxycarbonylgruppe darstellt, nach literaturbekannten Verfahren (siehe z.B.: Protective Groups in Organic Chemistry, 2nd Edition; Ed.: T.W.Greene, P.M.G.Wuts; John Wiley & Sons, Inc.; 1991).

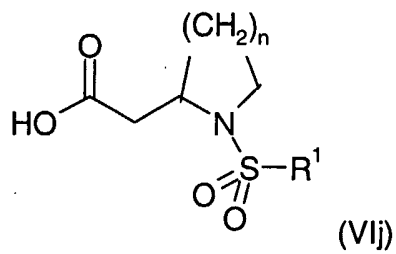
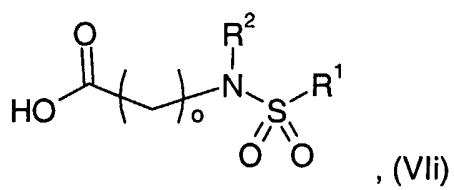
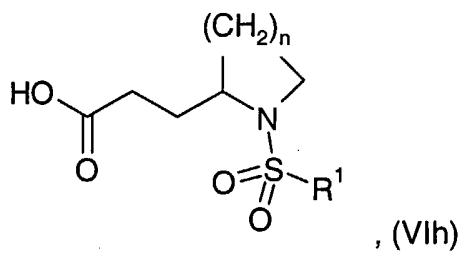
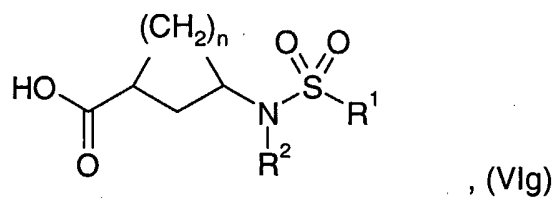
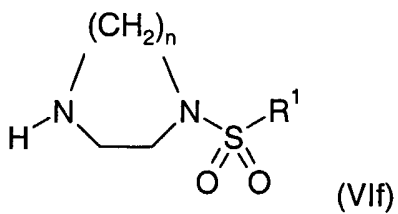
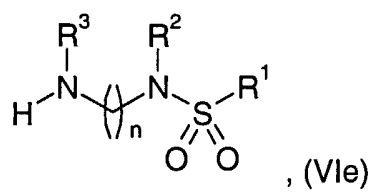
Je nach Art des Molekülteils A können die Zwischenprodukte (III) und (V) durch Bildung einer Carbonsäureamidbindung aus Carbonsäure- und Amino-Bausteinen hergestellt werden, die ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus (wobei in den nachfolgenden Formeln (VIa) bis (VI d) die mit Ar verknüpfte Ethylengruppe nur exemplarisch für die Bedeutungen der Gruppe Q in Formel (I) steht)



15

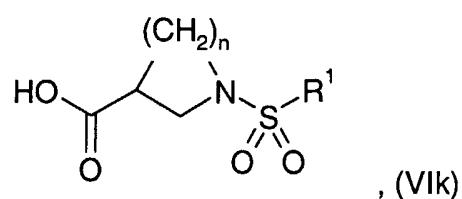


20



5

10



wobei Ar, R¹, R², R³, m, n und o wie eingangs erwähnt definiert sind und PG eine Amin-Schutzgruppe, beispielsweise die *tert*-Butyloxycarbonyl-Schutzgruppe, die Benzyloxycarbonyl-, Methoxycarbonyl- oder Ethoxycarbonylgruppe darstellt.

Möglichkeiten zur Herstellung der Carbonsäure- und Amino-Bausteine (VIa) bis (VIk) sind dem Fachmann geläufig. Die Herstellung dieser Bausteine erfolgt nach an sich literaturbekannten Verfahren.

10

Die Verknüpfung eines Carbonsäure-Bausteins der allgemeinen Formel (VIa) mit einem Amino-Baustein der allgemeinen Formel (VIe) liefert Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (III), bei denen A einem Rest der allgemeinen Formel (IIa) entspricht.

15

Die Verknüpfung eines Carbonsäure-Bausteins der allgemeinen Formel (VIa) mit einem Amino-Baustein der allgemeinen Formel (VIf) liefert Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (III), bei denen A einem Rest der allgemeinen Formel (IIg) entspricht.

20

Die Verknüpfung eines Amino-Bausteins der allgemeinen Formel (VIc) mit einem Carbonsäure-Baustein der allgemeinen Formel (VIg) liefert Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (III), bei denen A einem Rest der allgemeinen Formel (IIb) entspricht.

25

Die Verknüpfung eines Amino-Bausteins der allgemeinen Formel (VIc) mit einem Carbonsäure-Baustein der allgemeinen Formel (VIh) liefert Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (III), bei denen A einem Rest der allgemeinen Formel (IIe) entspricht.

30

Die Verknüpfung eines Amino-Bausteins der allgemeinen Formel (VIc) mit einem Carbonsäure-Baustein der allgemeinen Formel (VIi) liefert Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (III), bei denen A einem Rest der allgemeinen Formel (IIf) entspricht.

5

Die Verknüpfung eines Amino-Bausteins der allgemeinen Formel (VIc) mit einem Carbonsäure-Baustein der allgemeinen Formel (VIj) liefert Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (III), bei denen A einem Rest der allgemeinen Formel (IIh) entspricht.

10

Die Verknüpfung eines Amino-Bausteins der allgemeinen Formel (VIc) mit einem Carbonsäure-Baustein der allgemeinen Formel (VIk) liefert Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (III), bei denen A einem Rest der allgemeinen Formel (Ili) entspricht.

15

Die Verknüpfung eines Carbonsäure-Bausteins der allgemeinen Formel (VIb) mit einem Amino-Baustein der allgemeinen Formel (VIe) liefert Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (V), bei denen A einem Rest der allgemeinen Formel (IIa) entspricht.

20

Die Verknüpfung eines Carbonsäure-Bausteins der allgemeinen Formel (VIb) mit einem Amino-Baustein der allgemeinen Formel (VIf) liefert Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (V), bei denen A einem Rest der allgemeinen Formel (IIg) entspricht.

25

Die Verknüpfung eines Amino-Bausteins der allgemeinen Formel (VId) mit einem Carbonsäure-Baustein der allgemeinen Formel (VIg) liefert Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (V), bei denen A einem Rest der allgemeinen Formel (IIb) entspricht.

30

Die Verknüpfung eines Amino-Bausteins der allgemeinen Formel (VId) mit einem Carbonsäure-Baustein der allgemeinen Formel (VIh) liefert Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (V), bei denen A einem Rest der allgemeinen Formel (Ile) entspricht.

Die Verknüpfung eines Amino-Bausteins der allgemeinen Formel (VI_d) mit einem Carbonsäure-Baustein der allgemeinen Formel (VI_i) liefert Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (V), bei denen A einem Rest der allgemeinen Formel (II_f) entspricht.

Die Verknüpfung eines Amino-Bausteins der allgemeinen Formel (VI_d) mit einem Carbonsäure-Baustein der allgemeinen Formel (VI_j) liefert Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (V), bei denen A einem Rest der allgemeinen Formel (II_h) entspricht.

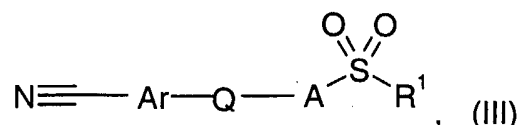
Die Verknüpfung eines Amino-Bausteins der allgemeinen Formel (VI_d) mit einem Carbonsäure-Baustein der allgemeinen Formel (VI_k) liefert Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (V), bei denen A einem Rest der allgemeinen Formel (II_i) entspricht.

Die voranstehend genannten Verknüpfungen von Carbonsäuren mit Aminen unter Bildung von Carbonsäureamiden kann mit herkömmlichen Methoden zur Amidbildung durchgeführt werden.

Die Kupplung wird bevorzugt unter Verwendung von aus der Peptidchemie bekannten Verfahren (siehe z. B. Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Bd. 15/2) durchgeführt, wobei zum Beispiel Carbodiimide, wie z.B. Dicyclohexylcarbodiimid (DCC), Diisopropylcarbodiimid (DIC) oder Ethyl-(3-dimethylamino-propyl)-carbodiimid, *O*-(1*H*-Benzotriazol-1-yl)-*N,N,N,N*-tetramethyluronium-hexafluorphosphat (HBTU) oder -tetrafluorborat (TBTU) oder 1*H*-Benzotriazol-1-yl-oxytris-(dimethylamino)-phosphoniumhexafluorphosphat (BOP) eingesetzt werden. Durch Zugabe von 1-Hydroxybenzotriazol (HOBt) oder von 3-Hydroxy-4-oxo-3,4-dihydro-1,2,3-benzotriazin (HOOBt) kann die Reaktionsgeschwindigkeit gesteigert werden. Die Kupplungen werden normalerweise mit äquimolaren Anteilen der Kupplungskomponenten sowie des Kupplungsreagenz in Lösemitteln wie Dichlormethan, Tetrahydrofuran, Acetonitril, Dimethylformamid (DMF), Dimethylacetamid (DMA), *N*-Methylpyrrolidon (NMP) oder Gemischen aus diesen und bei Temperaturen zwischen -30°C und +30°C, bevorzugt -20°C und +25°C, durchgeführt. Sofern

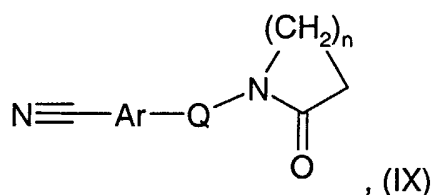
Möglichkeiten zur Herstellung der Synthese-Bausteine (VII) und (VIII) sind dem Fachmann geläufig. Die Herstellung dieser Bausteine erfolgt nach an sich literaturbekannten Verfahren.

- 5 (d) Zur Herstellung von Zwischenprodukten der allgemeinen Formel

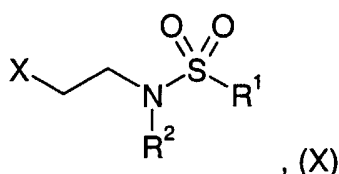


10 in der R^1 , Q und Ar wie eingangs erwähnt definiert sind und A einem Rest der eingangs erwähnten allgemeinen Formel (II d) entspricht:

Umsetzung eines Lactams der allgemeinen Formel



15 in der Ar, Q und n wie eingangs erwähnt definiert sind, mit einem elektrophilen Synthesebaustein der allgemeinen Formel



20 in der R^1 und R^2 wie eingangs erwähnt definiert sind und X die Bedeutung einer nucleofugen Gruppe, wie z.B. das Chlor-, Brom- oder Jodatome, die Methansulfonyl- oder Toluolsulfonylgruppe besitzt.

25 Die Umsetzung erfolgt unter Einwirkung einer Base, wie z.B. Butyllithium oder Lithiumdiisopropylamid, vorzugsweise in einem Lösungsmittel wie Tetrahydrofuran oder in einem Lösungsmittelgemisch aus Tetrahydrofuran mit Hexan oder Toluol.

Möglichkeiten zur Herstellung der Synthese-Bausteine (IX) und (X) sind dem Fachmann geläufig. Die Herstellung dieser Bausteine erfolgt nach an sich literaturbekannten Verfahren.

5

Die erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können, sofern sie geeignete basische Funktionen enthalten, insbesondere für pharmazeutische Anwendungen in ihre physiologisch verträglichen Salze mit anorganischen oder organischen Säuren übergeführt werden. Als Säuren kommen hierfür beispielsweise

10 Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Phosphorsäure, Salpetersäure, Schwefelsäure, Methansulfonsäure, Ethansulfonsäure, Benzolsulfonsäure, *p*-Toluolsulfonsäure, Essigsäure, Fumarsäure, Bernsteinsäure, Milchsäure, Mandelsäure, Äpfelsäure, Zitronensäure, Weinsäure oder Maleinsäure in Betracht.

15 Außerdem lassen sich die neuen Verbindungen der Formel (I), falls sie Carbonsäurefunktion enthalten, gewünschtenfalls in ihre Additionssalze mit anorganischen oder organischen Basen, insbesondere für die pharmazeutische Anwendung in ihre physiologisch verträglichen Additionssalze überführen. Als Basen kommen hierfür beispielsweise Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniak, Cyclohexylamin,

20 Dicyclohexylamin, Ethanolamin, Diethanolamin und Triethanolamin in Betracht.

Die vorliegende Erfindung betrifft Racemate, sofern die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nur ein Chiralitätselement besitzen. Die Anmeldung umfasst jedoch auch die einzelnen diastereomeren Antipodenpaare oder deren Gemische,

25 die dann vorliegen, wenn mehr als ein Chiralitätselement in den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vorhanden ist, sowie die einzelnen optisch aktiven Enantiomeren, aus denen sich die erwähnten Racemate zusammensetzen.

Ebenfalls mit vom Gegenstand dieser Erfindung umfasst sind die erfindungsgemäßen Verbindungen, einschließlich deren Salze, in denen ein oder mehrere

30 Wasserstoffatome durch Deuterium ausgetauscht sind.

Die neuen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und deren physiologisch verträgliche Salze weisen wertvolle pharmakologische Eigenschaften auf. Sie stellen

Bradykinin-B1-Antagonisten dar.

Beispielsweise wurden die Verbindungen

- 5 A = 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-isopropylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid (Beispiel 4),
- B = 3-[1-(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-piperidin-2-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid-Hydrochlorid
10 (Beispiel 9),
- C = 1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-piperidin-3-carbonsäure-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-methylamid (Beispiel 12),
- 15 D = *N*-{2-[(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-propionamid (Beispiel 16) und
- E = 2,3-Dichlor-*N*-[2-(3-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-2-oxoimidazolidin-1-yl)-ethyl]-*N*-methylbenzolsulfonamid-Hydrochlorid (Beispiel 17)

20

auf ihre biologische Wirkung wie folgt untersucht:

Methodenbeschreibung zur hBK1-Rezeptorbindung

- 25 CHO-Zellen, die den hBK1-Rezeptor exprimieren, werden in „Dulbecco's modified Medium“ kultiviert. Von konfluenten Kulturen wird das Medium entfernt, die Zellen werden mit PBS-Puffer gewaschen, abgeschabt und durch Zentrifugieren isoliert. Anschließend werden die Zellen in Suspension homogenisiert, das Homogenat zentrifugiert und resuspendiert. Nach Bestimmung des Proteingehalts wird die so
30 erhaltene Membranpräparation bei -80°C eingefroren.

Nach dem Auftauen werden 200 μ l des Homogenats (50 bis 100 μ g Protein/Assay) für 60 Minuten bei Raumtemperatur mit 0.5 bis 1.0 nM Kallidin (DesArg10,Leu9), [3,4-Prolyl-3,4,3H(N)] und ansteigenden Konzentrationen der Testsubstanz in einem

Gesamtvolumen von 250 μ l inkubiert. Die Inkubation wird durch rasche Filtration durch GF/B-Glasfaserfilter, die mit Polyethyleneimine (0.3%) vorbehandelt wurden, beendet. Die an das Protein gebundene Radioaktivität wird mit einem TopCount NXT gemessen. Als nichtspezifische Bindung wird die gebundene Radioaktivität in Gegenwart von 1.0 μ M Kallidin (DesArg10,Leu9), [3,4-Prolyl-3,4³H(N)] definiert. Die Analyse der Konzentrations-Bindungskurve erfolgt mit Hilfe einer computergestützten nichtlinearen Kurvenanpassung. Aus den so erhaltenen Daten wird für die Testsubstanz der entsprechende K_i – Wert ermittelt.

Die Substanzen A bis E zeigten im beschriebenen Test folgende K_i – Werte:

<u>Substanz</u>	<u>K_i – Wert</u>
A	62 nM
B	26 nM
C	957 nM
D	170 nM
E	1520 nM

Aufgrund ihrer pharmakologischen Eigenschaften eignen sich die neuen Verbindungen und deren physiologisch verträglichen Salze zur Behandlung von Krankheiten und Krankheitssymptomen, die wenigstens teilweise durch die Stimulierung von Bradykinin-B1-Rezeptoren hervorgerufen werden. Die erfindungsgemässen Verbindungen können in Verfahren Verwendung finden, die der Linderung oder Behandlung von Schmerzen dienen, wobei einem Patienten eine therapeutisch wirksame Menge der erfindungsgemässen Verbindung dargereicht wird. So eignen sie sich beispielsweise zur Behandlung von Patienten mit chronischen Schmerzen, neuropathischen Schmerzen oder post-operativen Schmerzen, inflammatorischen Schmerzen, perioperativen Schmerzen, Migräne, Arthralgie, Neuropathien, Nervenverletzungen, diabetischer Neuropathie, Neurodegeneration, neurotischen Hautkrankheiten, Schlaganfall, Harnblasen-Übersensitivität, Reizdarm, Atemwegserkrankungen wie Asthma oder chronischer obstruktiver Lungenerkrankung, Irritationen der Haut, Augen oder Schleimhäute, Zwölffingerdarm- und Magengeschwüren, Magenentzündung oder anderen

Entzündungserkrankungen, Schmerzen hervorgerufen durch Osteoarthritis, Rückenschmerzen, sowie Schmerzen assoziiert mit einer anderen Ätiologie.

5 Zur Behandlung von Schmerzen kann es vorteilhaft sein, die erfindungsgemässen Verbindungen mit belebenden Stoffen wie Koffein oder anderen schmerzlindernden Wirkstoffen zu kombinieren. Stehen zur Behandlung der Ursache der Schmerzen geeignete Wirkstoffe zur Verfügung, so können diese mit den erfindungsgemässen Verbindungen kombiniert werden. Sind unabhängig von der Schmerzbehandlung auch noch weitere medizinische Behandlungen angezeigt, zum Beispiel gegen
10 Bluthochdruck oder Diabetes, so können auch die dafür nötigen Wirkstoffe mit den erfindungsgemässen Verbindungen kombiniert werden.

Die zur Erzielung einer schmerzstillenden Wirkung erforderliche Dosierung beträgt bei intravenöser Gabe zweckmäßigerweise 0.01 bis 3 mg/kg Körpergewicht, vorzugsweise 0.1 bis 1 mg/kg, und bei oraler Gabe 0.1 bis 8 mg/kg Körpergewicht, vorzugsweise 0.5 bis 3 mg/kg, jeweils 1 bis 3 x täglich. Die erfindungsgemäß hergestellten Verbindungen können intravenös, subkutan, intramuskulär, intrarektal, intranasal, durch Inhalation, transdermal oder oral verabreicht werden, wobei zur Inhalation insbesondere Aerosolformulierungen geeignet sind. Sie können
20 gegebenenfalls zusammen mit einem oder mehreren inerten üblichen Trägerstoffen und/oder Verdünnungsmitteln, z.B. mit Maisstärke, Milchzucker, Rohrzucker, mikrokristalliner Zellulose, Magnesiumstearat, Polyvinylpyrrolidon, Zitronensäure, Weinsäure, Wasser, Wasser/Ethanol, Wasser/Glycerin, Wasser/Sorbit, Wasser/Polyethylenglykol, Propylenglykol, Cetylstearylalkohol,
25 Carboxymethylcellulose oder fetthaltigen Substanzen wie Hartfett oder deren geeigneten Gemischen, in übliche galenische Zubereitungen wie Tabletten, Dragées, Kapseln, Pulver, Suspensionen, Lösungen, Dosieraerosole oder Zäpfchen eingearbeitet werden.

30 **Experimenteller Teil**

Für hergestellte Verbindungen liegen in der Regel IR-, ¹H-NMR und/oder Massenspektren vor. Die bei den Fließmitteln angegebenen Verhältnisse beziehen sich auf

Volumeneinheiten der jeweiligen Lösungsmittel. Die angegebenen Volumeneinheiten bei NH₃ beziehen sich auf eine konzentrierte Lösung von NH₃ in Wasser.

Soweit nicht anders vermerkt sind die bei den Aufarbeitungen der Reaktionslösungen verwendeten Säure-, Basen- und Salzlösungen wässrige Systeme der angegebenen

5 Konzentrationen.

Zu chromatographischen Reinigungen wird Kieselgel der Firma Millipore (MATREXTM, 35-70 μm) oder Alox (E. Merck, Darmstadt, Aluminiumoxid 90 standardisiert, 63-200 μm, Artikel-Nr: 1.01097.9050) verwendet.

10 In den Versuchsbeschreibungen werden die folgenden Abkürzungen verwendet:

DMSO Dimethylsulfoxid

NMR nuclear magnetic resonance

tert. tertiär

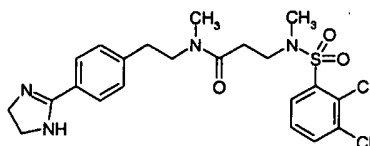
15 TBTU 2-(1*H*-Benzotriazol-1-yl)-1,1,3,3-tetramethyluronium-Tetrafluorborat

Herstellung der Endverbindungen

Beispiel 1

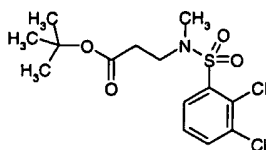
20

3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid-Hydrochlorid



25

1a) 3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propionsäure-*tert.*-butylester



Eine Lösung von 1.0 g (6.28 mMol) *N*-Methyl- β -alanin-*tert.*-butylester, 1.54 g (6.28 mMol) 2,3-Dichlorbenzolsulfonsäurechlorid und 0.70 g (6.92 mMol) Triethylamin in 30 ml Tetrahydrofuran wurde über Nacht bei Raumtemperatur gerührt und dann bis zur Trockne eingengt. Der Rückstand wurde mit ca. 50 ml Wasser versetzt und dreimal mit je 20 ml Essigsäureethylester extrahiert. Die organischen Extrakte wurden mit ca. 20 ml gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen und dann bis zur Trockne eingengt. Das so erhaltene Rohprodukt wurde durch Säulenchromatographie über Kieselgel (Elutionsmittel: Dichlormethan) gereinigt.

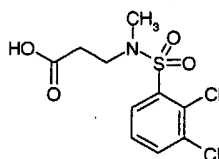
$C_{14}H_{19}Cl_2NO_4S$ (368.28)

10 Ausbeute: 19.5% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.39 (s, 9H); 2.50 (t, 2H); 2.87 (s, 3H); 3.46 (t, 2H); 7.59 (t, 1H); 7.96 (2d, 2H) ppm

1b) 3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propionsäure

15



Eine Lösung von 430 mg (1.17 mMol) 3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propionsäure-*tert.*-butylester und 2.0 ml Trifluoressigsäure in 30 ml Tetrahydrofuran wurde zwei Stunden bei Raumtemperatur gerührt und dann bis zur Trockne eingengt. Der Rückstand wurde mit ca. 30 ml Wasser versetzt und dreimal mit je 20 ml Essigsäureethylester extrahiert. Die organischen Extrakte wurden mit gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und zur Trockne eingengt. Das so erhaltene Produkt wurde ohne zusätzliche Reinigung weiter umgesetzt.

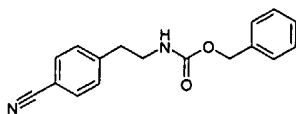
$C_{10}H_{11}Cl_2NO_4S$ (312.17)

Ausbeute: 98% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 2.54 (t, 2H); 2.89 (s, 3H); 3.47 (t, 2H); 7.58 (t, 1H); 7.96 (2d, 2H) ppm

30

1c) [2-(4-Cyanophenyl)-ethyl]-carbamatsäurebenzylester



Eine Lösung von 2.37 g (12.98 mMol) 4-(2-Aminoethyl)-benzonitril-Hydrochlorid und
5 4.34 ml (31.14 mMol) Triethylamin in 95 ml Dichlormethan wurde unter
Eisbadkühlung mit 5.82 ml (15.57 mMol) Benzylchlorformiat (45% in Toluol) versetzt.
Die Reaktionsmischung wurde über Nacht bei Raumtemperatur gerührt und dann bis
zur Trockne eingengt. Das so erhaltene Rohprodukt wurde durch Säulenchromato-
graphie über Kieselgel (Elutionsmittel: Petrolether / Essigsäureethylester 2:1 bis 1:1)
10 gereinigt.

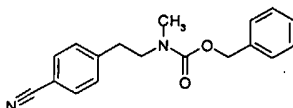
$C_9H_{10}N_2$ (146.19)

Ausbeute: 67% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 2.81 (t, 2H), 3.27 (t, 2H), 4.99 (s, 2H), 7.26-7.43 (m, 8H),
7.73 (d, 2H) ppm

15

1d) 4-(2-Methylaminoethyl)-benzonitril



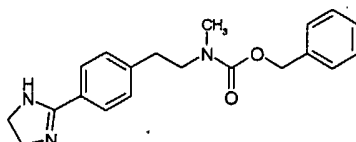
20 Eine Lösung von 3.183 g (11.36 mMol) [2-(4-Cyanophenyl)-ethyl]-carbamatsäure-
benzylester in 70 ml Tetrahydrofuran wurde unter Eisbadkühlung mit 0.43 g (17.03
mMol) Natriumhydrid (95%ig) versetzt. Es wurden weitere 5 Minuten unter Kühlung
und 10 Minuten bei Raumtemperatur gerührt. Danach wurde die Reaktionsmischung
mit 1.06 ml (17.03 mMol) Methyljodid versetzt und über Nacht bei Raumtemperatur
25 gerührt. Anschließend wurde unter Eisbadkühlung mit Wasser gequench und mit
Essigsäureethylester extrahiert. Die organischen Extrakte wurden mit gesättigter
Natriumchloridlösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und bis zur Trockne
eingengt. Das so erhaltene Produkt wurde ohne zusätzliche Reinigung weiter
umgesetzt.

30 $C_{10}H_{12}N_2$ (160.22)

Ausbeute: 97% der Theorie

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 2.77\text{-}2.93$ (m, 5H), 3.50 (t, 2H), 4.92/5.02 (2s br, 2H, Rotamere), 7.19-7.47 (m, 7H), 7.71 (s br, 2H) ppm

1e) {2-[4-(4,5-Dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-methylcarbamatsäurebenzylester



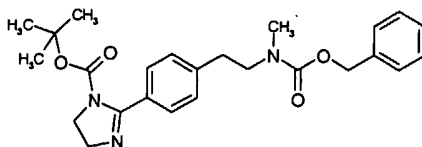
Eine Lösung von 3.33 g (11.32 mMol) 4-(2-Methylaminoethyl)-benzonnitril, 14 ml Ethylendiamin und 0.182 g (5.66 mMol) Schwefel wurde eine Stunde bei 100°C gerührt und dann bis zur Trockne eingeeengt. Der Rückstand wurde mit Wasser versetzt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organischen Extrakte wurden mit Wasser und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das so erhaltene Rohprodukt wurde mit Diethylether verrieben.

$\text{C}_{20}\text{H}_{23}\text{N}_3\text{O}_2$ (337.43)

Ausbeute: 86% der Theorie

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 2.81$ (m, 5H), 3.47 (t, 2H), 3.59 (s, 4H), 4.97/5.05 (2s br, 2H, Rotamere), 6.84 (s br, NH), 7.15-7.40 (m, 7H), 7.73 (d br, 2H) ppm

1f) 2-{4-[2-(Benzyloxycarbonylmethylamino)-ethyl]-phenyl}-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester



Eine Lösung von 3.27 g (9.69 mMol) {2-[4-(4,5-Dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-methylcarbamatsäurebenzylester in 50 ml Dichlormethan wurde nacheinander mit 1.29 g (10.57 mMol) Dimethylaminopyridin und 2.31 g (10.57 mMol) Di-*tert.*-butyldicarbonat in 50 ml Dichlormethan versetzt. Die Reaktionsmischung wurde 3.5

Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wurde mit 0.5 N Salzsäure, mit Wasser und gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das so erhaltene Rohprodukt wurde durch Säulen-

5 chromatographie über Kieselgel (Elutionsmittel: Dichlormethan / Ethanol 15:1) gereinigt.

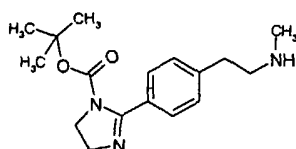
$C_{25}H_{31}N_3O_4$ (437.54)

Ausbeute: 97% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.18 (s, 9H), 2.78-2.88 (m, 5H), 3.46 (t, 2H), 3.84 (m, 4H), 5.00/5.06 (2s br, 2H, Rotamere), 7.20 (d br, 2H), 7.28-7.41 (m, 7H) ppm

10

1g) 2-[4-(2-Methylaminoethyl)-phenyl]-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-tert.-butylester



15

Eine Suspension von 4.0 g (9.14 mMol) 2-[4-[2-(Benzyloxycarbonylmethylamino)-ethyl]-phenyl]-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-tert.-butylester und 0.4 g Palladium/10% Kohle in 80 ml Methanol wurden zwei Stunden im Autoklaven hydriert. Danach wurde der Katalysator abfiltriert und das Filtrat bis zur Trockne eingeeengt.

20 Das so erhaltene Rohprodukt wurde ohne zusätzliche Reinigung sofort weiter umgesetzt.

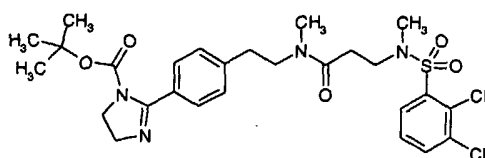
$C_{17}H_{25}N_3O_2$ (303.41)

Ausbeute: 98% der Theorie

$[M+H]^+ = 304$, $[M-Buten-CO_2+H]^+ = 204$

25

1h) 2-[4-[2-[(3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methyl-amino]-propionyl)-methyl-amino]-ethyl]-phenyl]-4,5-dihydro-imidazol-1-carbonsäure-tert.-butylester



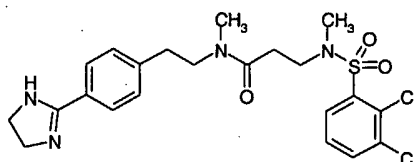
Eine Lösung von 210 mg (0.67 mMol) 3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propionsäure, 257 mg (0.80 mMol) TBTU und 1.0 ml Triethylamin in 40 ml Tetrahydrofuran wurde eine Stunde bei Raumtemperatur gerührt, dann wurden 204 mg (0,67 mMol) 2-[4-(2-Methylaminoethyl)-phenyl]-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester hinzugefügt und über Nacht weitergerührt. Das Gemisch wurde bis zur Trockne eingeeengt, der Rückstand mit ca. 40 ml Kaliumcarbonatlösung (10%) versetzt und dreimal mit je 20 ml Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wurde mit gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das so erhaltene Rohprodukt wurde durch Säulenchromatographie (Elutionsmittel: Dichlormethan / Methanol 150 : 1) gereinigt.

$C_{27}H_{34}Cl_2N_4O_5S$ (597.55)

Ausbeute: 59.7% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.19 (2s, 9H, Rotamere); 2.40-2.95 (m, 10H); 3.35-3.53 (m, 4H); 3.77-3.92 (m, 4H); 7.25 (t, 2H); 7.38 (t, 2H); 7.54-7.62 (m, 1H); 7.89-7.98 (m, 2H) ppm

1i) 3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-N-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-N-methylpropionamid-Hydrochlorid



20

Eine Lösung von 230 mg (0.385 mMol) 2-[4-[2-({3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propionyl}-methylamino)-ethyl]-phenyl]-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester und 3.0 ml Trifluoressigsäure in 30 ml Dichlormethan wurde über Nacht bei Raumtemperatur gerührt und dann bis zur Trockne eingeeengt. Der Rückstand wurde mit ca. 40 ml Kaliumcarbonatlösung (10%) versetzt und dreimal mit je 20 ml Essigsäureethylester extrahiert. Die organischen Extrakte wurden mit gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und bis auf ca. 10 ml eingeeengt. Es wurden ca. 15 ml etherische Salzsäure hinzugefügt und bis zur Trockne eingedampft. Der Rückstand wurde in ca. 10 ml Ether verrieben,

30

diese Suspension erneut eingedampft und das so erhaltene Produkt im Vakuum getrocknet.

$C_{22}H_{26}Cl_2N_4O_3S \times HCl$ (533.90)

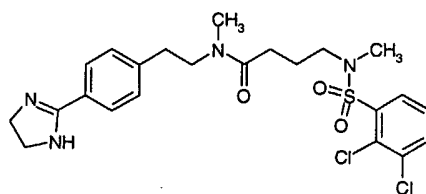
Ausbeute: 68.1% der Theorie

- 5 1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 2.38/2.60$ (2t, 2H, Rotamere); 2.78-2.98 (m, 8H); 3.27-3.44 (m, 2H); 3.49-3.60 (m, 2H); 3.99 (s, 4H); 7.47-7.62 (m, 3H); 7.88-8.04 (m, 4H); 10.70/10.72 (2s, 2H, Rotamere) ppm

Beispiel 2

10

4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid-Hydrochlorid



15

4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid-Hydrochlorid wurde analog zu 1i) aus 48 mg (0.09 mMol) 2-{4-[2-({4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-butyryl}-methylamino)-ethyl]-phenyl}-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester und 1 ml Trifluor-essigsäure in 5 ml Dichlormethan hergestellt.

20

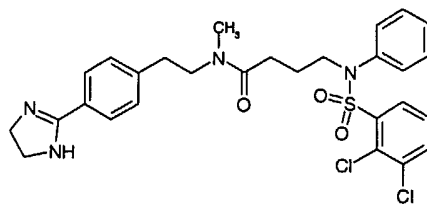
$C_{23}H_{28}Cl_2N_4O_3S \times HCl$ (511.47)

Ausbeute: 91% der Theorie

- 25 1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 1.62/1.70$ (2m, 2H, Rotamere), 2.09 (s, 2H), 2.10/2.22 (2t, 2H, Rotamere), 2.80/2.81 (2s, 3H, Rotamere), 2.85/2.88 (2s, 3H, Rotamere), 2.85/2.94 (2t, 2H, Rotamere), 3.14/3.21 (2t, 2H, Rotamere), 3.99 (s, 4H), 7.45-7.61 (m, 3H), 7.91-8.01 (m, 4H), 10.66/10.69 (2s br, NH, Rotamere) ppm

Beispiel 3

- 30 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-phenylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid
-



4-[(2,3-Dichlorobenzoylsulfonyl)-phenylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-

5 phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid wurde analog zu 1i) aus 0.252 g (0.35 mMol) 2-[4-[2-((4-[(2,3-Dichlorobenzoylsulfonyl)-phenylamino]-butyryl)-methylamino)-ethyl]-phenyl]-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester und 0.5 ml Trifluoressigsäure in 2 ml Dichlormethan hergestellt.

$C_{28}H_{30}Cl_2N_4O_3S$ (573.55)

10 Ausbeute: 94% der Theorie

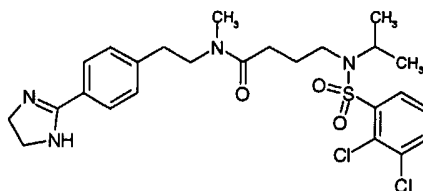
1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.51/1.59 (2m, 2H, Rotamere), 2.18/2.29 (2t, 2H, Rotamere), 2.73/2.83 (2t, 2H, Rotamere), 2.77/2.84 (2s, 3H, Rotamere), 3.46 (q, 2H), 3.59 (m, 4H), 3.74/3.82 (2t, 2H, Rotamere), 7.18-7.40 (m, 7H), 7.46 (t, 1H), 7.70-7.82 (m, 3H), 7.92 (d, 1H) ppm

15

Beispiel 4

4-[(2,3-Dichlorobenzoylsulfonyl)-isopropylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid

20



4-[(2,3-Dichlorobenzoylsulfonyl)-isopropylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid wurde analog zu 1i) aus 0.269 g (0.42 mMol) 2-[4-[2-((4-[(2,3-Dichlorobenzoylsulfonyl)-isopropylamino]-butyryl)-methylamino)-ethyl]-phenyl]-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester und 0.6 ml Trifluoressigsäure in 2 ml Dichlormethan hergestellt.

25

$C_{25}H_{32}Cl_2N_4O_3S$ (539.53)

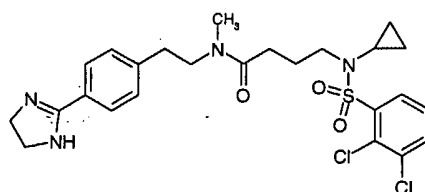
Ausbeute: 82% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.08 (d, 3H), 1.11 (d, 3H), 1.61/1.70 (2m, 2H, Rotamere),
2.08/2.23 (2t, 2H, Rotamere), 2.75/2.83 (2t, 2H, Rotamere), 2.81/2.86 (2s, 3H,
5 Rotamere), 3.15/3.26 (2t, 2H, Rotamere), 3.48 (m, 2H), 3.58 (s, 4H), 3.91 (m, 1H),
7.25/7.29 (2d, 2H, Rotamere), 7.57 (m, 1H), 7.73/7.76 (2d, 2H, Rotamere), 7.94 (m,
1H), 8.01 (m, 1H) ppm

Beispiel 5

10

4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-cyclopropylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid



15

4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-cyclopropylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid wurde analog zu 1i) aus 0.31 g (0.48 mMol) 2-[4-[2-((4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-cyclopropylamino]-butyryl)-methylamino)-ethyl]-phenyl]-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester und 0.7 ml
20 Trifluoressigsäure in 2 ml Dichlormethan hergestellt.

$C_{25}H_{30}Cl_2N_4O_3S$ (537.51)

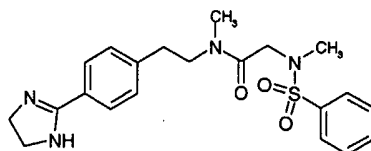
Ausbeute: 78% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 0.41 (m, 2H), 0.59 (m, 2H), 1.73/1.82 (2m, 2H, Rotamere),
2.15/2.30 (2t, 2H, Rotamere), 2.45/2.50 (2m, 2H, Rotamere), 2.77/2.86 (2t, 2H,
25 Rotamere), 2.82/2.89 (2s, 3H Rotamere), 3.28/3.39 (2t, 2H, Rotamere), 3.50 (m, 2H),
3.58 (s, 4H), 7.26/7.30 (2d, 2H, Rotamere), 7.59 (m, 1H), 7.73/7.75 (2d, 2H,
Rotamere), 7.94-8.03 (m, 2H) ppm

Beispiel 6

2-(Benzolsulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylacetamid-Hydrochlorid

5



2-(Benzolsulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-acetamid-Hydrochlorid wurde analog zu 1i) aus 0.5 g (0.97 mMol) 2-[4-(2-
10 {{2-(Benzolsulfonylmethylamino)-acetyl]-methylamino}-ethyl)-phenyl]-4,5-dihydroimi-
dazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester und 5 ml Trifluoressigsäure in 15 ml
Dichlormethan hergestellt.

$C_{21}H_{26}N_4O_3S \times HCl$ (450.98)

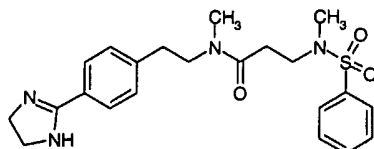
Ausbeute: 57% der Theorie

15 1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 2.55/2.64$ (2s, 3H, Rotamere), 2.77-3.03 (m, 5H), 3.55 (m, 2H), 3.68/3.99 (2s, 2H, Rotamere), 4.00 (s br, 4H), 7.52 (dd, 2H), 7.57-7.76 (m, 4H), 7.80 (d, 1H), 8.02 (m, 2H), 10.80/10.85 (2s, 2H, Rotamere) ppm

Beispiel 7

20

3-(Benzolsulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid-Hydrochlorid



25

3-(Benzolsulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid-Hydrochlorid wurde analog zu 1i) aus 0.52 g (0.98 mMol) 2-[4-(2-
2-{{3-(Benzolsulfonylmethylamino)-propionyl]-methylamino}-ethyl)-phenyl]-4,5-

dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester und 5 ml Trifluoressigsäure in 25 ml Dichlormethan hergestellt.

$C_{22}H_{28}N_4O_3S \times HCl$ (465.01)

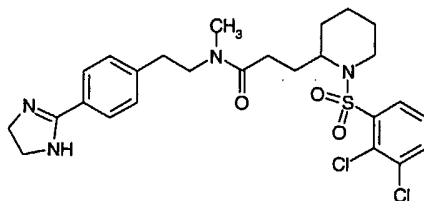
Ausbeute: 35% der Theorie

- 5 1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 2.35/2.54$ (2t, 2H, Rotamere), 2.62/2.70 (2s, 3H, Rotamere), 2.78-2.98 (m, 5H), 3.07/3.15 (2t, 2H, Rotamere), 3.54 (m, 2H), 3.99 (s, 4H), 7.51 (t, 2H), 7.60-7.80 (m, 5H), 8.02 (dd, 2H), 10.75/10.79 (2s, 2H, Rotamere) ppm

Beispiel 8

10

3-[1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-piperidin-2-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid-Hydrochlorid



15

3-[1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-piperidin-2-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid-Hydrochlorid wurde analog zu 1i) aus 0.44 g (0.68 mMol) 2-{4-[2-({3-[1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-piperidin-2-yl]-propionyl)-methylamino]-ethyl]-phenyl}-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester und 5 ml Trifluoressigsäure in 15 ml Dichlormethan hergestellt.

20

$C_{26}H_{32}Cl_2N_4O_3S \times HCl$ (587.99)

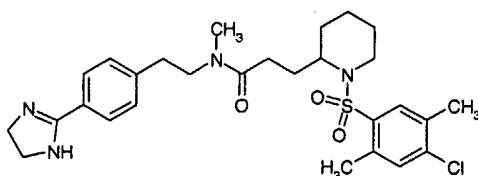
Ausbeute: 64% der Theorie

- 25 1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 1.08-1.30$ (m, 1H), 1.45-1.72 (m, 6H), 1.73-2.13 (m, 3H), 2.70/2.75 (2s, 3H, Rotamere), 2.83/2.90 (2t, 2H, Rotamere), 2.98-3.13 (m, 1H), 3.33-3.57 (m, 2H), 3.58-3.73 (m, 1H), 3.80-3.93 (m, 1H), 3.99 (s, 4H), 7.49 (t, 2H), 7.57 (m, 1H), 7.88-8.07 (m, 4H), 10.73/10.79 (2s, 2H, Rotamere) ppm

Beispiel 9

3-[1-(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-piperidin-2-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid-Hydrochlorid

5



3-[1-(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-piperidin-2-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid-Hydrochlorid wurde analog zu 1i) aus 0.39 g (0.60 mMol) 2-{4-[2-({3-[1-(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-piperidin-2-yl]-propionyl}-methylamino)-ethyl]-phenyl}-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester und 4 ml Trifluoressigsäure in 40 ml Dichlormethan hergestellt.

10

$C_{28}H_{37}ClN_4O_3S \times HCl$ (581.60)

Ausbeute: 46% der Theorie

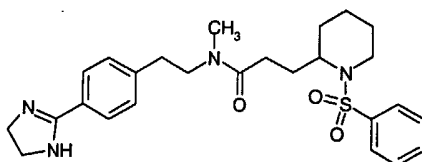
15

1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 1.08-1.25$ (m, 1H), 1.43-1.71 (m, 6H), 1.73-2.10 (m, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 2.68-3.10 (m, 6H), 3.33-3.62 (m, 3H), 3.78 (m, 1H), 3.99 (s, 4H), 7.50 (m, 3H), 7.81 (s, 1H), 7.94-8.03 (m, 2H), 10.70/10.74 (2s, 2H, Rotamere) ppm

20 Beispiel 10

3-(1-Benzolsulfonylpiperidin-2-yl)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid-Hydrochlorid

25



3-(1-Benzolsulfonylpiperidin-2-yl)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid-Hydrochlorid wurde analog zu 1i) aus 0.28 g (0.48

mMol) 2-{4-[2-((3-[1-Benzolsulfonylpiperidin-2-yl]-propionyl)-methylamino)-ethyl]-phenyl}-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester und 3 ml Trifluoressigsäure in 40 ml Dichlormethan hergestellt.

$C_{26}H_{34}N_4O_3S \times HCl$ (519.10)

5 Ausbeute: 24% der Theorie

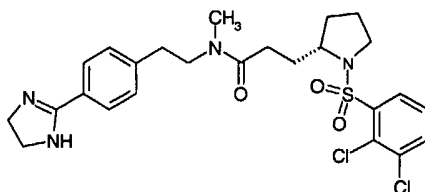
1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 1.06-1.25$ (m, 1H), 1.27-1.63 (m, 6H), 1.74-1.93 (m, 1H), 2.04-2.24 (m, 2H), 2.28-3.08 (m, 6H), 3.52 (m, 2H), 3.58-3.72 (m, 1H), 3.83-4.02 (m, 1H), 3.99 (s, 4H), 7.48-7.70 (m, 5H), 7.82 (d, 2H), 8.00 (dd, 2H), 10.68/10.71 (2s, 2H, Rotamere) ppm

10

Beispiel 11

3-[1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-pyrrolidin-2(*S*)-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid-Hydrochlorid

15



3-[1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-pyrrolidin-2(*S*)-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid-Hydrochlorid wurde analog zu 1i) aus 0.24 g (0.38 mMol) 2-{4-[2-((3-[1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-pyrrolidin-2(*S*)-yl]-propionyl)-methylamino)-ethyl]-phenyl}-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester und 2 ml Trifluoressigsäure in 30 ml Dichlormethan hergestellt.

20

$C_{25}H_{30}Cl_2N_4O_3S \times HCl$ (573.96)

Ausbeute: 37% der Theorie

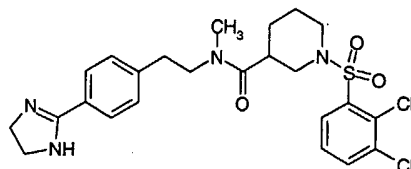
25

1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 1.45-1.93$ (m, 6H), 2.06/2.21 (2t, 2H, Rotamere), 2.80/2.88 (2s, 3H, Rotamere), 2.82-2.97 (m 2H), 3.36 (m, 2H), 3.51 (t, 2H), 3.79-3.99 (m, 1H), 4.00 (s, 4H), 7.47-7.62 (m, 3H), 7.90-8.00 (m, 4H), 10.62/10.66 (2s, 2H, Rotamere) ppm

Beispiel 12

1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-piperidin-3-carbonsäure-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-methylamid

5



1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-piperidin-3-carbonsäure-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-methylamid wurde analog zu 1i) aus 0.27 g (0.43 mMol) 2-[4-(2-
10 [[1-(2,3-Dichloro-benzolsulfonyl)-piperidine-3-carbonyl]-methyl-amino]-ethyl)-phenyl]-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester und 1 ml Trifluoressigsäure in 5 ml Dichlormethan hergestellt.

$C_{24}H_{28}Cl_2N_4O_3S$ (523.48)

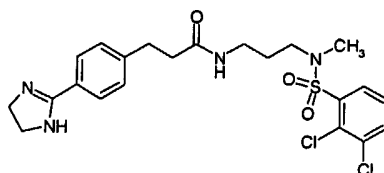
Ausbeute: 29% der Theorie

15 1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.08-1.84 (m, 4H), 2.65-2.95 (m, 8H), 3.43-3.75 (m, 4H), 3.60 (s, 4H), 7.25 (dd, 2H), 7.57 (m, 1H), 7.72 (dd, 2H), 7.96 (m, 2H), (Imidazolin-NH nicht sichtbar) ppm

Beispiel 13

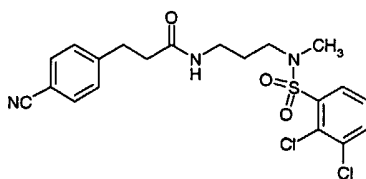
20

N-{3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-propionamid



25

13a) 3-(4-Cyanphenyl)-*N*-{3-[(2,3-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propyl}-propionamid



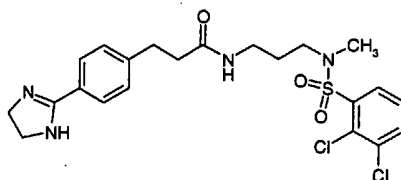
Eine Lösung von 1.47 g (8.41 mMol) 4-Cyanphenylpropionsäure, 3.1 g (9.65 mMol) TBTU und 5.0 ml Triethylamin in 150 ml Tetrahydrofuran wurde 30 Minuten bei
 5 Raumtemperatur gerührt, dann wurden 2.5 g (8.41 mMol) *N*-(3-Aminopropyl)-2,3-dichlor-*N*-methylbenzolsulfonamid hinzugefügt und über Nacht weitergerührt. Das Gemisch wurde bis zur Trockne eingeeengt, der Rückstand mit Kaliumcarbonatlösung (10%) versetzt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wurde
 10 mit Wasser und gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das so erhaltene Rohprodukt wurde durch Säulen- chromatographie (Elutionsmittel: Dichlormethan / Methanol 150 : 1 bis 100:1) gereinigt.

$C_{20}H_{21}Cl_2N_3O_3S$ (454.37)

Ausbeute: 42% der Theorie

15 1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.61 (m, 2H), 2.36 (t, 2H), 2.82 (s, 3H), 2.89 (t, 2H), 3.01 (m, 2H), 3.18 (t, 2H), 7.04 (d, 2H), 7.57 (t, 1H), 7.72 (d, 2H), 7.80 (t br, NH), 7.94 (m, 2H) ppm

20 13b) *N*-(3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propyl)-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-propionamid



Eine Lösung von 0.7 g (1.54 mMol) 3-(4-Cyanphenyl)-*N*-(3-[(2,3-dichlor-benzolsulfo-
 25 nyl)-methylamino]-propyl)-propionamid, 3 ml Ethylendiamin und 0.10 g (3.12 mMol) Schwefel wurde 15 Minuten bei 100°C gerührt. Das Gemisch wurde danach mit Wasser versetzt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organischen Extrakte wurden mit Wasser und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen, über

Natriumsulfat getrocknet und eingeengt. Das so erhaltene Rohprodukt wurde durch Säulenchromatographie über Aluminiumoxid (Elutionsmittel: Dichlormethan / Methanol 100 : 1) gereinigt und anschließend aus Essigsäureethylester/Diethylether auskristallisiert.

5 $C_{22}H_{26}Cl_2N_4O_3S$ (497.44)

Ausbeute: 47% der Theorie

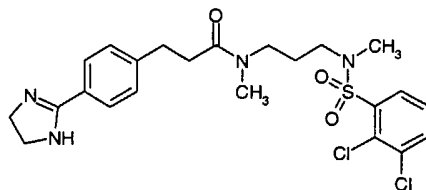
1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.62 (p, 2H), 2.37 (t, 2H), 2.82 (t, 2H), 2.83 (s, 3H), 3.02 (dt, 2H), 3.20 (t, 2H), 3.59 (s br, 4H), 6.80 (s br, 1H), 7.23 (d, 2H), 7.57 (t, 1H), 7.70 (d, 2H), 7.80 (t, 1H), 7.95 (m, 2H) ppm

10

Beispiel 14

N-{3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methylpropionamid-Hydrochlorid

15



N-{3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methylpropionamid wurde analog zu 13b) aus 0.7 g (1.49 mMol) 3-(4-Cyanphenyl)-*N*-{3-[(2,3-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propyl}-*N*-methylpropionamid, 0.1 g (3.12 mMol) Schwefel und 3 ml Ethylendiamin hergestellt.

20

$C_{23}H_{28}Cl_2N_4O_3S \times HCl$ (547.93)

Ausbeute: 51% der Theorie

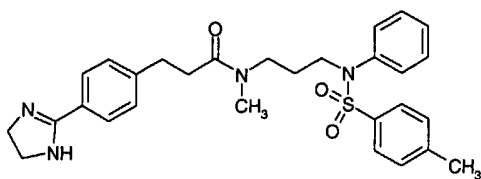
1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.71 (m, 2H), 2.60 (t, 2H), 2.75-2.93 (m, 8H), 3.15-3.85 (m, 8H), 6.80 (s br, 1H), 7.28 (d, 2H), 7.57 (m, 1H), 7.72 (d, 2H), 7.95 (dd, 2H) ppm

25

Beispiel 15

3-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methyl-*N*-{3-[phenyl-(toluol-4-sulfonyl)-amino]-propyl}-propionamid

30



3-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methyl-*N*-{3-[phenyl-(toluol-4-sulfonyl)-amino]-propyl}-propionamid wurde analog zu 13b) aus 1.82 g (3.83 mMol) 3-(4-
5 Cyanphenyl)-*N*-methyl-*N*-{3-[phenyl-(toluol-4-sulfonyl)-amino]-propyl}-propionamid, 122 mg (3.83 mMol) Schwefel und 7 ml Ethylendiamin hergestellt.

$C_{29}H_{34}N_4O_3S$ (518.67)

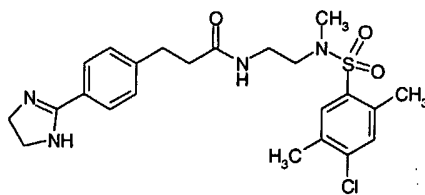
Ausbeute: 68% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.48 (p, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.46-2.59 (m, 2H), 2.69/2.83 (2s, 3H, Rotamere), 2.74-2.84 (m, 2H), 3.20-3.35 (m, 2H), 3.50/3.55 (2t, 2H, Rotamere), 3.59 (s br, 4H), 6.82 (s br, 1H), 7.00-7.09 (m, 2H), 7.18-7.47 (m, 9H), 7.72 (t, 2H) ppm

Beispiel 16

15

N-{2-[(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-propionamid



20

N-{2-[(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-propionamid wurde analog zu 13b) aus 1.15 g (2.65 mMol) *N*-{2-[(4-Chlor-2,5-dimethyl-benzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-3-(4-cyanphenyl)-propionamid, 85 mg (2.65 mMol) Schwefel und 4 ml Ethylendiamin hergestellt.

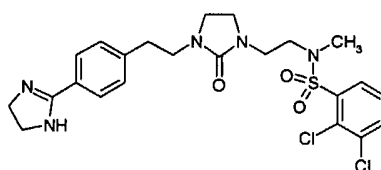
25 $C_{23}H_{29}ClN_4O_3S$ (477.02)

Ausbeute: 67% der Theorie

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO): $\delta = 2.35$ (t, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.47 (s, 3H), 2.76 (s, 3H), 2.82 (t, 2H), 3.10-3.26 (m, 4H), 3.58 (s, 4H), 7.22 (d, 2H), 7.52 (s, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.72 (d, 2H), 7.89 (t, 1H), (Imidazolin-NH nicht sichtbar) ppm

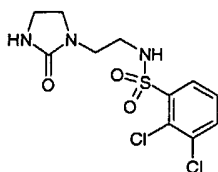
5 Beispiel 17

2,3-Dichlor-*N*-[2-(3-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-2-oxo-imidazolidin-1-yl)-ethyl]-*N*-methylbenzolsulfonamid-Hydrochlorid



10

17a) 2,3-Dichlor-*N*-[2-(2-oxo-imidazolidin-1-yl)-ethyl]-benzolsulfonamid



15

Eine Lösung von 0.5 g (2.04 mMol) 2,3-Dichlorbenzolsulfonsäurechlorid, 0.26 g (2.04 mMol) 1-(2-Aminoethyl)-2-imidazolidon und 1 ml (7.18 mMol) Triethylamin in 10 ml Tetrahydrofuran wurde über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Danach wurde die Reaktionsmischung mit 1 N HCl und gesättigter Natriumhydrogencarbonat-Lösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das so erhaltene Produkt wurde ohne zusätzliche Reinigung weiter umgesetzt.

20

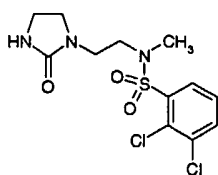
$\text{C}_{11}\text{H}_{13}\text{Cl}_2\text{N}_3\text{O}_3\text{S}$ (338.21)

Ausbeute: 87% der Theorie

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO): $\delta = 2.99$ (m, 2H), 3.07 (m, 2H), 3.15 (m, 2H), 3.27 (m, 2H), 6.27 (s br, NH), 7.56 (t, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.96 (d, 1H), 8.13 (t br, NH) ppm

25

17b) 2,3-Dichlor-*N*-methyl-*N*-[2-(2-oxo-imidazolidin-1-yl)-ethyl]-benzolsulfonamid



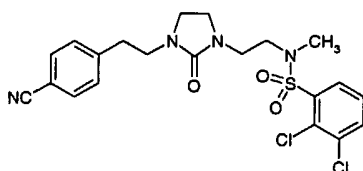
Eine Lösung von 0.57 g (1.69 mMol) 2,3-Dichlor-*N*-[2-(2-oxo-imidazolidin-1-yl)-ethyl]-benzolsulfonamid und 0.23 g (1.7 mMol) Kaliumcarbonat in 10 ml Dimethylformamid wurde 10 Minuten bei Raumtemperatur gerührt, danach mit 0.16 ml (1.69 mMol) Dimethylsulfat versetzt und über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wurde mit Wasser verdünnt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Extrakte wurden über Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das so erhaltene Produkt wurde mit Diethylether auskristallisiert.

10 $C_{12}H_{15}Cl_2N_3O_3S$ (352.24)

Ausbeute: 72% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 2.88 (s, 3H), 3.17 (t, 2H), 3.24 (t, 2H), 3.26-3.38 (m, 4H), 6.28 (s br, NH), 7.56 (t, 1H), 7.95 (m, 2H) ppm

15 17c) 2,3-Dichlor-*N*-(2-{3-[2-(4-cyanphenyl)-ethyl]-2-oxo-imidazolidin-1-yl}-ethyl)-*N*-methylbenzolsulfonamid



20 Eine Lösung von 290 mg (0.82 mMol) 2,3-Dichlor-*N*-methyl-*N*-[2-(2-oxo-imidazolidin-1-yl)-ethyl]-benzolsulfonamid in 10 ml Dimethylformamid wurde mit 34 mg (0.84 mMol) NaH 60%ig versetzt und 10 Minuten bei Raumtemperatur gerührt. Danach wurden 177 mg (0.84 mMol) 4-(2-Bromethyl)-benzonnitril hinzugegeben. Die Reaktionsmischung wurde über Nacht bei 50°C gerührt. Anschließend wurde auf Wasser gegeben, 1 N HCl zugesetzt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Extrakte wurden mit gesättigter Natriumhydrogencarbonat-Lösung und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das so erhaltene Rohprodukt wurde durch

25

Säulenchromatographie über Kieselgel (Elutionsmittel: Dichlormethan / Methanol 0-3 %) gereinigt.

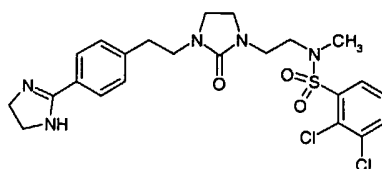
$C_{21}H_{22}Cl_2N_4O_3S$ (481.40)

Ausbeute: 38% der Theorie

- 5 1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 2.84 (m, 2H), 2.85 (s, 3H), 3.15-3.26 (m, 6H), 3.26-3.37 (m, 4H), 7.45 (d, 2H), 7.56 (t, 1H), 7.74 (d, 2H), 7.94 (d, 2H) ppm

17d) 2,3-Dichlor-N-[2-(3-[2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl]-2-oxo-imidazolidin-1-yl)-ethyl]-N-methylbenzolsulfonamid-Hydrochlorid

10



- Eine Lösung von 137 mg (0.29 mMol) 2,3-Dichlor-N-(2-{3-[2-(4-cyanphenyl)-ethyl]-2-oxo-imidazolidin-1-yl)-ethyl)-N-methylbenzolsulfonamid, 2 ml Ethylendiamin und 4.6 mg (0.14 mMol) Schwefel wurde zwei Stunden bei 100°C gerührt. Das Gemisch wurde danach mit Wasser versetzt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organischen Extrakte wurden mit gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das so erhaltene Rohprodukt wurde durch Säulenchromatographie über Kieselgel (Elutionsmittel: Dichlormethan / Methanol / NH₃ 13:1:0,1 bis 8:1:0,1) gereinigt. Das Produkt wurde danach mit etherischer Salzsäure in das Hydrochlorid überführt und gefriergetrocknet.
- 15
- 20

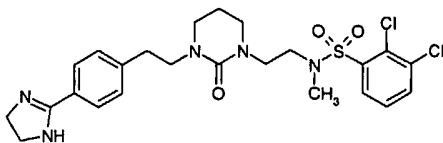
$C_{23}H_{27}Cl_2N_5O_3S$ (560.92)

Ausbeute: 31% der Theorie

- 1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 2.86 (s, 2H), 2.87 (m, 2H), 3.17-3.27 (m, 6H), 3.29-3.39 (m, 4H), 3.99 (s, 4H), 3.99 (s, 4H), 7.53 (d, 2H), 7.59 (t, 1H), 7.95 (d, 2H), 7.96 (d, 2H), 10.66 (s, NH) ppm
- 25

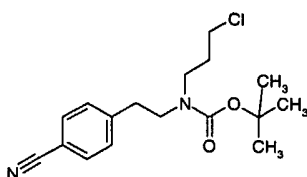
Beispiel 18

- 30 2,3-Dichlor-N-[2-(3-[2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl]-2-oxo-tetrahydropyrimidin-1-yl)-ethyl]-N-methylbenzolsulfonamid
-



18a) (3-Chlorpropyl)-[2-(4-cyanophenyl)-ethyl]-carbamatsäure-*tert.*-butylester

5



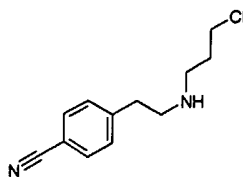
Eine Lösung von 1.482 g (6.02 mMol) [2-(4-Cyanophenyl)-ethyl]-carbamatsäure-*tert.*-butylester in 25 ml Tetrahydrofuran/25 ml Dimethylformamid wurde bei Raumtemperatur mit 0.23 g (9.03 mMol) Natriumhydrid (95%ig) versetzt. Es wurden weitere 15 Minuten gerührt. Danach wurde die Reaktionsmischung mit 1.49 ml (15.04 mMol) 1-Brom-3-chlorpropan versetzt und über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wurde unter Eisbadkühlung mit Wasser gequench und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organischen Extrakte wurden mit gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und bis zur Trockne eingengt. Das so erhaltene Rohprodukt wurde durch Säulenchromatographie über Kieselgel (Elutionsmittel: Petrolether / Essigsäureethylester 4:1) gereinigt.

$C_{17}H_{23}ClN_2O_4$ (322.83)

Ausbeute: 26% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.33 (s br, 9H), 1.88 (m, 2H), 2.86 (t, 2H), 3.22 (t, 2H), 3.39 (t, 2H), 3.58 (t, 2H), 7.41 (d, 2H), 7.76 (d, 2H) ppm

18b) 4-[2-(3-Chlorpropylamino)-ethyl]-benzonitril Trifluoracetat



25

Eine Lösung von 626 mg (1.94 mMol) (3-Chlorpropyl)-[2-(4-cyanophenyl)-ethyl]-carbamatsäure-*tert.*-butylester und 5.0 ml Trifluoressigsäure in 20 ml Dichlormethan wurde 1.5 Stunden bei Raumtemperatur gerührt und dann bis zur Trockne eingengt. Der Rückstand wurde mit Diethylether verrieben. Der entstandene Niederschlag wurde danach abfiltriert und im Vakuum über Calciumchlorid getrocknet. Das so

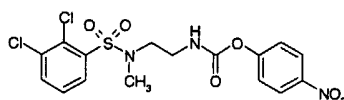
erhaltene Produkt wurde ohne zusätzliche Reinigung weiter umgesetzt.

$C_{12}H_{15}ClN_2 \times C_2HF_3O_2$ (336.74)

Ausbeute: 85% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 2.08 (m, 2H), 3.02 (t, 2H), 3.08 (t, 2H), 3.25 (t, 2H), 3.73 (t, 2H), 7.50 (d, 2H), 7.82 (d, 2H), 8.84 (s br, 1H) ppm

18c) 2-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl-carbamatsäure-4-nitrophenylester



Eine Lösung von 0.25 g (0.62 mMol) *N*-(2-Aminoethyl)-2,3-dichlor-*N*-methyl-benzolsulfonamid Trifluoracetat und 0.26 ml (1.87 mMol) Triethylamin in 5 ml Tetrahydrofuran wurde unter Eisbadkühlung mit einer Lösung von 0.13 g (0.62 mMol) Chlorameisensäure-4-nitrophenylester in 5 ml Tetrahydrofuran versetzt. Die Reaktionsmischung wurde eine Stunde bei Raumtemperatur gerührt. Dann wurde der entstandene Niederschlag abfiltriert und das Filtrat bis zur Trockne eingengt. Das so

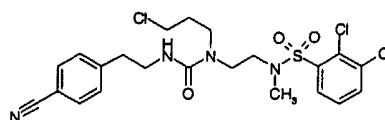
erhaltene Rohprodukt wurde ohne zusätzliche Reinigung weiter umgesetzt.

$C_{16}H_{15}Cl_2N_3O_6S$ (448.28)

Ausbeute: 100% der Theorie

R_f -Wert = 0.96 (Kieselgel, Dichlormethan/Methanol 9:1)

18d) 2,3-Dichlor-*N*-(2-{1-(3-chlorpropyl)-3-[2-(4-cyanophenyl)-ethyl]-ureido}-ethyl)-*N*-methyl-benzolsulfonamid



Eine Lösung von 0.31 g (0.62 mMol) {2-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-carbamatsäure-4-nitro-phenylester und 0.23 g (0.69 mMol) 4-[2-(3-Chlorpropylamino)-ethyl]-benzonnitril Trifluoracetat in 12 ml Tetrahydrofuran wurde mit 0.19 ml (1.37 mMol) Triethylamin versetzt und 1.5 Stunden bei 60°C gerührt. Anschließend wurde mit 1N Salzsäure, mit gesättigter Natriumhydrogensulfat- und gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das so erhaltene Rohprodukt wurde durch Säulenchromatographie über Kieselgel (Elutionsmittel: Dichlormethan / Ethanol 40:1) gereinigt.

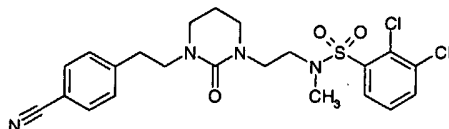
10 $C_{22}H_{25}Cl_3N_4O_3S$ (531.88)

Ausbeute: 48% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.86 (m, 2H), 2.85 (t, 2H), 2.89 (s, 3H), 3.17 (t, 2H), 3.20-3.32 (m, 4H), 3.38 (t, 2H), 3.57 (t, 2H), 6.39 (t br, 1H), 7.46 (d, 2H), 7.56 (t, 1H) 7.75 (d, 2H), 7.93 (d, 2H) ppm

15

18e) 2,3-Dichlor-N-(2-{3-[2-(4-cyanophenyl)-ethyl]-2-oxotetrahydropyrimidin-1-yl}-ethyl)-N-methylbenzolsulfonamid



20

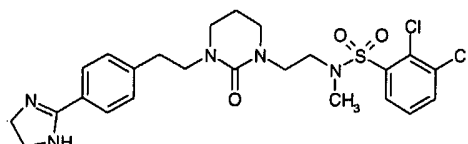
Eine Lösung von 0.147 g (0.28 mMol) 2,3-Dichlor-N-(2-{1-(3-chlorpropyl)-3-[2-(4-cyanophenyl)-ethyl]-ureido}-ethyl)-N-methyl-benzolsulfonamid in 8 ml Dimethylformamid wurde mit 31 mg (0.28 mMol) Kalium-*tert.*-butylat versetzt und 24 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Danach wurde bis zur Trockne eingeeengt. Der Rückstand wurde mit Wasser versetzt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organischen Extrakte wurden mit Wasser, gesättigter Natriumhydrogensulfat- und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das so erhaltene Rohprodukt wurde durch Säulenchromatographie über Kieselgel (Elutionsmittel: Dichlormethan / Ethanol 40:1) gereinigt.

30 $C_{22}H_{24}Cl_2N_4O_3S$ (495.42)

Ausbeute: 88% der Theorie

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 1.77$ (m, 2H), 2.84 (t, 2H), 2.87 (s, 3H), 3.10 (t, 2H), 3.20 (t, 2H), 3.31-3.46 (m, 6H), 7.43 (d, 2H), 7.56 (t, 1H), 7.73 (d, 2H), 7.94 (d, 2H) ppm

18f) 2,3-Dichlor-N-[2-(3-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-2-oxo-tetrahydropyrimidin-1-yl)-ethyl]-N-methylbenzolsulfonamid



Eine Lösung von 0.135 g (0.27 mMol) 2,3-Dichlor-N-(2-{3-[2-(4-cyanophenyl)-ethyl]-2-oxotetrahydropyrimidin-1-yl}-ethyl)-N-methylbenzolsulfonamid, 2 ml Ethylendiamin und 17 mg (0.545 mMol) Schwefel wurde eine Stunde bei 100°C gerührt. Die Reaktionsmischung wurde danach mit Wasser versetzt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organischen Extrakte wurden mit Wasser und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das so erhaltene Rohprodukt wurde durch Säulenchromatographie über Kieselgel (Elutionsmittel: Dichlormethan / Ethanol / wässrige Ammoniak-Lösung 12:1:0.1 bis 8:1:0.1) gereinigt.

$\text{C}_{24}\text{H}_{29}\text{Cl}_2\text{N}_5\text{O}_3\text{S}$ (538.49)

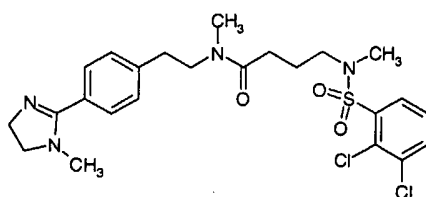
Ausbeute: 26% der Theorie

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 1.76$ (m, 2H), 2.78 (t, 2H), 2.88 (s, 3H), 3.09 (t, 2H), 3.20 (t, 2H), 3.23-3.45 (m, 6H), 3.59 (s, 4H), 7.27 (d, 2H), 7.56 (t, 1H), 7.73 (d, 2H), 7.94 (d, 2H), (Imidazolin-NH nicht sichtbar) ppm

Beispiel 19

25

4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-N-methyl-N-[2-[4-(1-methyl-4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl]-butyramid



4-[(2,3-Dichlorobenzolsulfonyl)-methylamino]-N-methyl-N-{2-[4-(1-methyl-4,5-dihydro-
1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-butyramid wurde analog zu 13b) aus 0.62 g (1.32
5 mMol) N-[2-(4-Cyanphenyl)-ethyl]-4-[(2,3-dichlorobenzolsulfonyl)-methylamino]-N-
methylbutyramid, 48 mg (1.49 mMol) Schwefel und 3 ml N-Methylethylendiamin
hergestellt.

$C_{24}H_{30}Cl_2N_4O_3S$ (525.49)

Ausbeute: 62% der Theorie

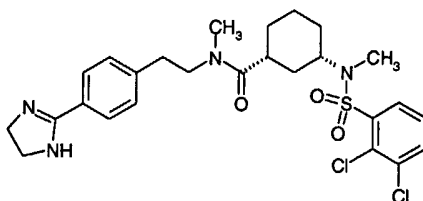
10 1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.61/1.72 (2m, 2H, Rotamere), 2.07/2.22 (2t, 2H,
Rotamere), 2.69 (s, 3H), 2.75/2.81 (2t, 2H, Rotamere), 2.81 (s, 3H), 2.86 (s, 3H),
3.13/3.22 (2t, 2H, Rotamere), 3.29/3.34 (2t, 2H, Rotamere), 3.47 (t, 2H), 3.67 (t, 2H),
7.28 (m, 2H), 7.43 (m, 2H), 7.57 (t, 1H), 7.93 (m, 2H) (Imidazolin-NH nicht sichtbar)
ppm

15

Beispiel 20

3-[(2,3-Dichlorobenzolsulfonyl)-methylamino]-cyclohexancarbonsäure-2-[4-(4,5-di-
hydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-methylamid-Trifluoracetat

20



3-[(2,3-Dichlorobenzolsulfonyl)-methylamino]-cyclohexancarbonsäure-2-[4-(4,5-di-
hydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-methylamid wurde analog zu 13b) aus 0.215 g
25 (0.423 mMol) 3-[(2,3-Dichlorobenzolsulfonyl)-methylamino]-cyclohexancarbonsäure-
[2-(4-cyanphenyl)-ethyl]-methylamid, 6.8 mg (0.211 mMol) Schwefel und 1.2 ml
Ethylendiamin hergestellt.

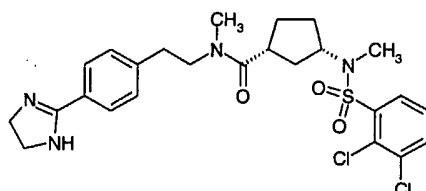
$C_{26}H_{32}Cl_2N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (665.55)

Ausbeute: 30% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 1.01$ - 1.59 (m, 7H), $1.64/1.73$ (2m, 1H, Rotamere), $2.33/2.65$ (2m, 1H, Rotamere), 2.70 - 2.94 (m, 3H), $2.73/2.77$ (2s, 3H, Rotamere), $2.80/2.86$ (2s, 3H, Rotamere), 3.36 - 3.75 (m, 2H), 4.00 (s, 4H), $7.47/7.53$ (2d, 2H, Rotamere), 7.58 (t, 1H), $7.85/7.90$ (2d, 2H, Rotamere), 7.87 - 8.07 (m, 2H), 10.47 (s br, 1H) ppm

Beispiel 21

10 3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-cyclopentancarbonsäure-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-methylamid-Trifluoracetat



15 3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-cyclopentancarbonsäure-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-methylamid wurde analog zu 13b) aus 0.185 g (0.374 mMol) 3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-cyclopentancarbonsäure-[2-(4-cyanphenyl)-ethyl]-methylamid, 6.0 mg (0.187 mMol) Schwefel und 1 ml Ethylendiamin hergestellt.

20 $C_{25}H_{30}Cl_2N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (651.53)

Ausbeute: 59% der Theorie

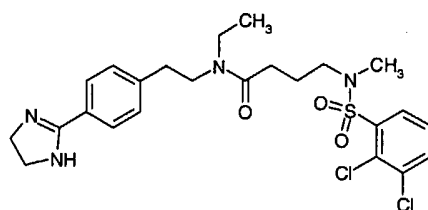
1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 1.45$ - 1.78 (m, 6H), 2.73 - 3.02 (m, 3H), 2.79 (s, 3H), 2.91 (s, 3H), 2.48 - 3.62 (m, 2H), 4.01 (s, 4H), 4.17 (m, 1H), 7.52 (m, 2H), 7.58 (t, 1H), 7.87 (m, 2H), 7.98 (m, 2H), $10.47/10.49$ (2s br, 1H) ppm

25

Beispiel 22

4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-ethylbutyramid

30



4-[(2,3-Dichlorobenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-ethylbutyramid wurde analog zu 13b) aus 0.74 g (1.53 mMol) *N*-[2-(4-Cyanphenyl)-ethyl]-4-[(2,3-dichlorobenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-ethylbutyramid, einer Spatelspitze Schwefel und 5 ml Ethylendiamin hergestellt.

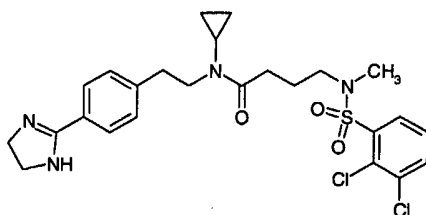
$C_{24}H_{30}Cl_2N_4O_3S$ (525.49)

Ausbeute: 37% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.00/1.04 (2t, 3H, Rotamere), 1.66/1.75 (2m, 2H, Rotamere), 2.16/2.26 (2t, 2H, Rotamere), 2.76/2.83 (2t, 2H, Rotamere), 2.82/2.86 (2s, 3H, Rotamere), 3.17 (m, 2H), 3.25 (m, 2H), 3.32 (m, 2H), 3.41 (m, 2H), 3.58 (s br, 2H), 7.25/7.30 (2d, 2H, Rotamere), 7.57 (t, 1H), 7.73/7.75 (2d, 2H, Rotamere), 7.94 (m, 2H), (Imidazolin-NH nicht sichtbar) ppm

15 Beispiel 23

N-Cyclopropyl-4-[(2,3-dichlorobenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-butyramid



20

N-Cyclopropyl-4-[(2,3-dichlorobenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-butyramid wurde analog zu 13b) aus 0.84 g (1.70 mMol) *N*-[2-(4-Cyanphenyl)-ethyl]-*N*-cyclopropyl-4-[(2,3-dichlorobenzolsulfonyl)-methylamino]-butyramid, 0.143 g (4.46 mMol) Schwefel und 3 ml Ethylendiamin hergestellt.

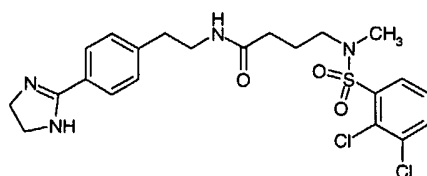
$C_{25}H_{30}Cl_2N_4O_3S$ (537.50)

Ausbeute: 54% der Theorie

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 0.63$ (m, 2H), 0.76 (m, 2H), 1.75 (m, 2H), 2.44 (t, 2H), 2.52 (m, 1H), 2.79 (t, 2H), 2.85 (s, 3H), 3.25 (t, 2H), 3.48 (t, 2H), 3.59 (s, 4H), 7.25 (d, 2H), 7.57 (t, 1H), 7.74 (d, 2H), 7.94 (d, 2H), (Imidazolin-NH nicht sichtbar) ppm

5 Beispiel 24

4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-butyramid Trifluoracetat



10

4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-butyramid wurde analog zu 13b) aus 0.297 g (0.654 mMol) *N*-[2-(4-Cyanphenyl)-ethyl]-4-[(2,3-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-butyramid, 42 mg (1.31 mMol) Schwefel und 1.8 ml Ethylendiamin hergestellt.

15

$\text{C}_{22}\text{H}_{26}\text{Cl}_2\text{N}_4\text{O}_3\text{S} \times \text{C}_2\text{HF}_3\text{O}_2$ (611.46)

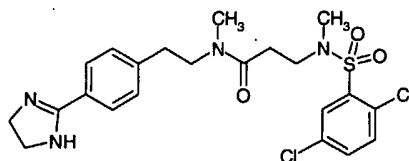
Ausbeute: 46% der Theorie

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 1.71$ (m, 2H), 2.05 (m, 2H), 2.82 (s, 3H), 2.83 (t, 2H), 3.19 (t, 2H), 3.33 (m, 2H), 4.00 (s, 4H), 7.50 (d, 2H), 7.57 (t, 1H), 7.86 (d, 2H), 7.89-7.97 (m, 2H), 10.45 (s br, 1H) ppm

20

Beispiel 25

3-[(2,5-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid



25

Hergestellt analog Beispiel 13b aus *N*-[2-(4-Cyanophenyl)-ethyl]-3-[(2,5-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid.

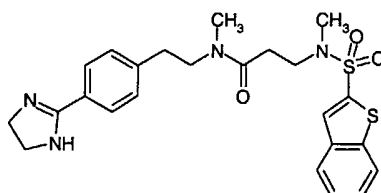
$C_{22}H_{26}Cl_2N_4O_3S$ (497.44)

Ausbeute: 39% der Theorie.

- 5 1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 2.40/2.60$ (2t, 2H, Rotamere), 2.74-2.93 (m, 8H), 3.28-3.55 (m, 4H), 3.61 (s, 4H), 7.20 (s br, 1H), 7.28 (dd, 2H), 7.75 (m, 4H), 7.91 (dd, 1H) ppm

Beispiel 26

- 10 3-[(Benzo[b]thiophene-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Hydrochlorid



- 15 Hergestellt analog Beispiel 13b aus 3-[(Benzo[b]thiophene-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-[2-(4-cyanophenyl)-ethyl]-*N*-methylpropionamid.

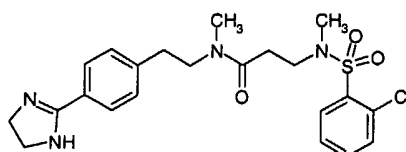
$C_{24}H_{28}N_4O_3S_2 \times HCl$ (484.64)

Ausbeute: 49% der Theorie.

- 20 1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 2.42/2.62$ (2t, 2H, Rotamere), 2.75-2.97 (m, 8H), 3.16-3.33 (m, 2H), 3.54 (m, 2H), 3.99 (s, 4H), 7.47-7.62 (m, 4H), 7.96 (dd, 2H), 8.03-8.17 (m 3H), 10.76 (d, 2H) ppm

Beispiel 27

- 25 3-[(2-Chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Hydrochlorid



Hergestellt analog Beispiel 13b aus 3-[(2-Chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-[2-(4-cyanophenyl)-ethyl]-*N*-methylpropionamid.

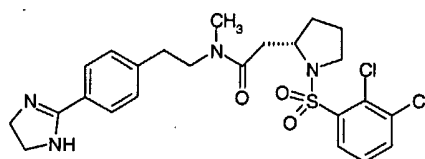
$C_{22}H_{27}ClN_4O_3S \times HCl$ (462.99)

5 Ausbeute: 23% der Theorie.

1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 2.37/2.60$ (2t, 2H, Rotamere), 2.76-2.98 (m, 8H), 3.25-3.43 (m, 2H), 3.53 (m, 2H), 4.00 (s, 4H), 7.47-7.60 (m, 3H), 7.68 (m, 2H), 7.95 (m, 3H), 10.63 (d, 2H) ppm

10 Beispiel 28

2-[1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-pyrrolidin-2-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylacetamid Hydrochlorid



15

Hergestellt analog Beispiel 13b aus *N*-[2-(4-Cyanophenyl)-ethyl]-2-[1-(2,3-dichlorbenzolsulfonyl)-pyrrolidin-2-yl]-*N*-methylacetamid.

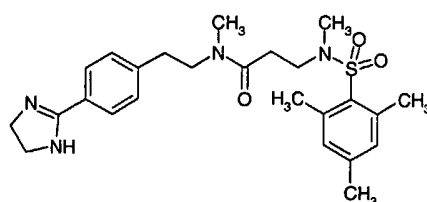
$C_{24}H_{28}Cl_2N_4O_3S \times HCl$ (523.48)

20 Ausbeute: 44% der Theorie.

1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 1.40-1.97$ (m, 4H), 2.22-2.68 (m, 2H), 2.76-3.00 (m, 5H), 3.23-3.43 (m, 2H), 3.52 (m, 2H), 3.99 (s, 4H), 4.15 (m, 1H), 7.49 (m, 2H), 7.60 (m, 1H), 7.87-8.04 (m, 4H), 10.72 (d, 2H) ppm

25 Beispiel 29

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(2,4,6-trimethylbenzolsulfonyl)-amino]-propionamid Hydrochlorid



Hergestellt analog Beispiel 13b aus *N*-[2-(4-Cyanophenyl)-ethyl]-*N*-methyl-3-[methyl-(2,4,6-trimethylbenzoyl)-amino]-propionamid.

5 $C_{25}H_{34}N_4O_3S \times HCl$ (470.63)

Ausbeute: 42% der Theorie.

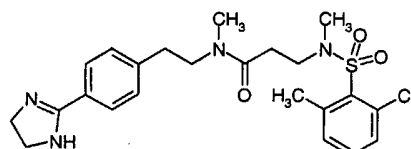
1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 2.22$ - 2.35 (m, 4H), 2.44 - 2.57 (m, 7H), $2.61/2.68$ (2s, 3H, Rotamere), 2.76 - 2.95 (m, 5H), $3.18/3.25$ (2t, 2H, Rotamere), 3.51 (t, 2H), 4.00 (s, 4H), 7.07 (d, 2H), 5.50 (m, 2H), 7.97 (m, 2H), 10.65 (d, 2H) ppm

10

Beispiel 30

3-[(2-Chlor-6-methylbenzoyl)-methylamino]-*N*-[2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl]-*N*-methylpropionamid Hydrochlorid

15



Hergestellt analog Beispiel 13b aus 3-[(2-Chlor-6-methylbenzoyl)-methylamino]-*N*-[2-(4-cyanphenyl)-ethyl]-*N*-methylpropionamid.

20 $C_{23}H_{29}ClN_4O_3S \times HCl$ (477.02)

Ausbeute: 33% der Theorie.

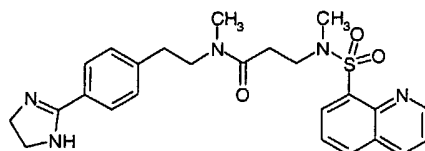
1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 2.33/2.56$ (2t, 2H, Rotamere), $2.61/2.63$ (2s, 3H, Rotamere), 2.72 - 2.98 (m, 8H), 3.23 - 3.40 (m, 2H), 3.54 (m, 2H), 4.00 (s, 4H), 7.40 (m, 1H), 7.50 (m, 4H), 7.95 (m, 2H), 10.62 (d, 2H) ppm

25

Beispiel 31

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(chinolin-8-sulfonyl)-amino]-propionamid Hydrochlorid

5



Hergestellt analog Beispiel 13b aus *N*-[2-(4-Cyanophenyl)-ethyl]-*N*-methyl-3-[methyl-(chinolin-8-sulfonyl)-amino]-propionamid.

10 $C_{25}H_{29}N_5O_3S \times HCl$ (479.60)

Ausbeute: 43% der Theorie.

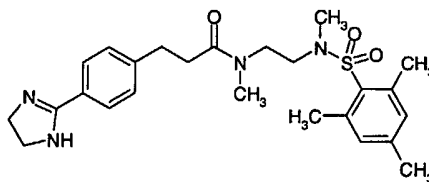
1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 2.32/2.53$ (2t, 2H, Rotamere), 2.76-2.95 (m, 8H), 3.35-3.55 (m, 4H), 3.99 (s, 4H), 7.49 (d, 2H), 7.67-7.80 (m, 2H), 7.96 (m, 2H), 8.28-8.40 (m, 2H), 8.53 (m, 1H), 9.06 (d, 1H), 10.66 (d, 2H) ppm

15

Beispiel 32

3-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methyl-*N*-{2-[methyl-(2,4,6-trimethylbenzolsulfonyl)-amino]-ethyl}-propionamid Hydrochlorid

20



Hergestellt analog Beispiel 13b aus 3-(4-Cyanophenyl)-*N*-methyl-*N*-{2-[methyl-(2,4,6-trimethylbenzolsulfonyl)-amino]-ethyl}-propionamid.

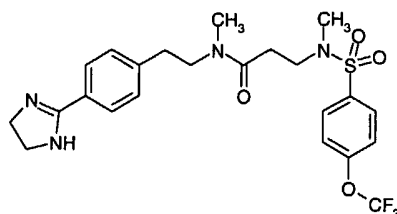
25 $C_{25}H_{34}N_4O_3S \times HCl$ (470.63)

Ausbeute: 70% der Theorie.

1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 2.24/2.25$ (2s, 3H, Rotamere), 2.46-2.78 (m, 14 H), 2.89 (m, 2H), 3.13-3.26 (m, 2H), 3.45 (t, 2H), 3.99 (s, 4H), 7.05 (s, 2H), 7.50 (m, 2H), 8.02 (d, 2H), 10.83 (s, 2H) ppm

Beispiel 33

5 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(4-trifluormethoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid Hydrochlorid



10 Hergestellt analog Beispiel 13b aus *N*-[2-(4-Cyanophenyl)-ethyl]-3-[(4-trifluoromethoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid.

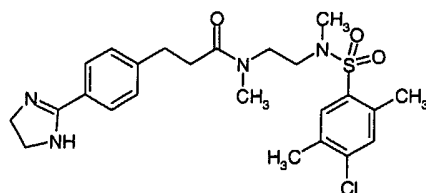
$C_{23}H_{27}F_3N_4O_4S \times HCl$ (512.55)

Ausbeute: 41% der Theorie.

1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 2.38/2.56$ (2t, 2H, Rotamere), 2.65-2.98 (m, 8H), 3.10/3.20 (2t, 2H, Rotamere), 3.53 (m, 2H), 3.99 (s, 4H), 7.51 (m, 2H), 7.62 (m, 2H), 7.93 (m, 4H), 10.61 (d, 2H) ppm

Beispiel 34

20 *N*-{2-[(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methylpropionamid Hydrochlorid



25 Hergestellt analog Beispiel 13b aus *N*-{2-[(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-3-(4-cyanophenyl)-*N*-methylpropionamid.

$C_{24}H_{31}ClN_4O_3S \times HCl$ (491.05)

Ausbeute: 63% der Theorie.

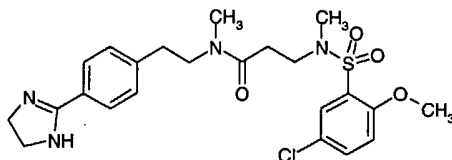
$^1\text{H-NMR}$ ($d_6\text{-DMSO}$): $\delta = 2.36/2.37$ (2s, 3H, Rotamere), 2.46/2.47 (2s, 3H, Rotamere), 2.56-2.74 (m, 2H), 2.77-2.99 (m, 8H), 3.23-3.35 (m, 2H), 3.42-3.54 (m, 2H), 3.98 (s, 4H), 7.52 (m, 3H), 7.70/7.72 (2s, 1H, Rotamere), 7.98 (d, 2H), 10.75 (s, 2H) ppm

5

Beispiel 35

3-[(5-Chlor-2-methoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Hydrochlorid

10



Hergestellt analog Beispiel 13b aus 3-[(5-Chlor-2-methoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-[2-(4-cyanophenyl)-ethyl]-*N*-methylpropionamid.

15 $\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{ClN}_4\text{O}_4\text{S} \times \text{HCl}$ (493.02)

Ausbeute: 47% der Theorie.

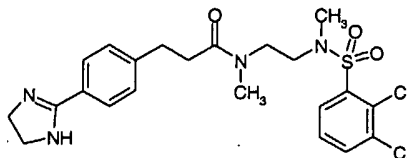
$^1\text{H-NMR}$ ($d_6\text{-DMSO}$): $\delta = 2.32/2.54$ (2t, 2H, Rotamere), 2.70-2.98 (m, 8H), 3.21/3.31 (2t, 2H, Rotamere), 3.53 (m, 2H), 3.89/3.90 (2s, 3H, Rotamere), 4.00 (s, 4H), 7.30 (m, 1H), 7.52 (m, 2H), 7.69 (m, 2H), 7.96 (m, 2H), 10.64 (d, 2H) ppm

20

Beispiel 36

N-{2-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methylpropionamid Hydrochlorid

25



Hergestellt analog Beispiel 13b aus 3-(4-Cyanophenyl)-*N*-{2-[(2,3-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-*N*-methylpropionamid.

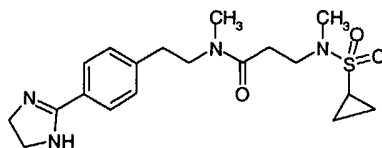
$C_{22}H_{26}Cl_2N_4O_3S \times HCl$ (497.44)

Ausbeute: 48% der Theorie.

1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 2.62/2.72$ (2t, 2H, Rotamere), 2.80-2.99 (m, 8H), 3.40 (m, 2H), 3.51 (m, 2H), 3.99 (s, 4H), 7.49-7.62 (m, 3H), 7.95 (m, 2H), 8.00 (d, 2H), 10.80 (s, 2H) ppm

Beispiel 37

3-(Cyclopropansulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Hydrochlorid



Hergestellt analog Beispiel 13b aus *N*-[2-(4-Cyanophenyl)-ethyl]-3-(cyclopropansulfonylmethylamino)-*N*-methylpropionamid.

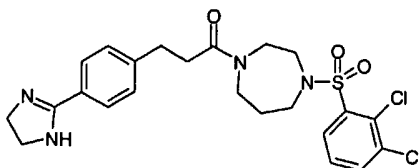
$C_{19}H_{26}Cl_2N_4O_3S \times HCl$ (392.52)

Ausbeute: 23% der Theorie.

1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 0.81-1.02$ (m, 4H), 2.38/2.59 (2t, 2H, Rotamere), 2.55-3.00 (m, 9H), 3.22-3.36 (m, 1H), 3.41-3.63 (m, 3H), 4.00 (s, 4H), 7.53 (dd, 2H), 7.94 (dd, 2H), 9.60 (s br, 2H) ppm

Beispiel 38

1-[4-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-[1,4]diazepan-1-yl]-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-propan-1-on Hydrochlorid



Hergestellt analog Beispiel 13b aus 4-{3-[4-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-[1,4]diazepan-1-yl]-3-oxopropyl}-benzonnitril.

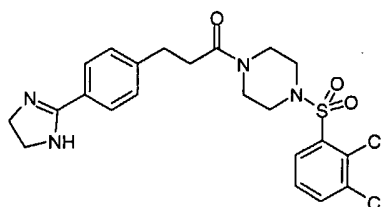
$C_{23}H_{26}Cl_2N_4O_3S \times HCl$ (509.45)

Ausbeute: 37% der Theorie.

- 5 1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 1.77$ (m, 2H), 2.71 (q, 2H), 2.95 (t, 2H), 3.30-3.66 (m, 8H), 3.92 (s, 4H), 7.49 (d, 2H), 7.57 (t, 1H), 7.86-7.98 (m, 4H), 10.25 (s br, 2H) ppm

Beispiel 39

- 10 1-[4-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-piperazin-1-yl]-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-propan-1-on Hydrochlorid



- 15 Hergestellt analog Beispiel 13b aus 4-{3-[4-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-piperazin-1-yl]-3-oxopropyl}-benzonnitril.

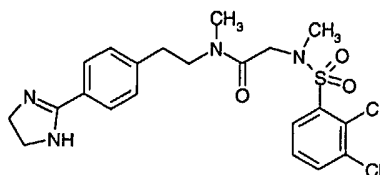
$C_{22}H_{24}Cl_2N_4O_3S \times HCl$ (495.42)

Ausbeute: 40% der Theorie.

- 20 1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 2.66$ (t, 2H), 2.85 (t, 2H), 3.20 (s br, 4H), 3.51 (s br, 4H), 3.74 (s, 4H), 7.36 (d, 2H), 7.59 (t, 1H), 7.78 (d, 2H), 7.97 (dt, 2H), (Imidazolin-NH nicht sichtbar) ppm

Beispiel 40

- 25 2-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylacetamid Hydrochlorid



Hergestellt analog Beispiel 13b aus *N*-[2-(4-Cyanophenyl)-ethyl]-2-[(2,3-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylacetamid.

$C_{21}H_{24}Cl_2N_4O_3S \times HCl$ (483.41)

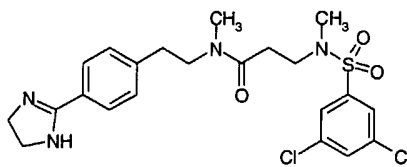
5 Ausbeute: 22% der Theorie.

1H -NMR (d_6 -DMSO): $\delta = 2.70$ - 3.00 (m, 8H), 3.54 (m, 2H), 4.00 (s, 4H), 4.01/4.24 (2s, 2H, Rotamere), 7.52 (m, 3H), 7.98 (m, 4H), 10.65/10.67 (2 s br, 1H, Rotamere) ppm

Beispiel 41

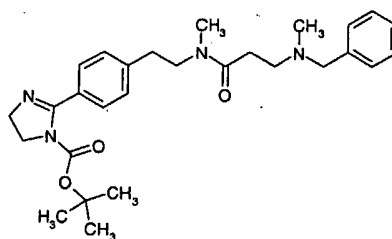
10

3-[(3,5-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat



15

41a) 2-[4-(2-[[3-(Benzylmethylamino)-propionyl]-methylamino]-ethyl)-phenyl]-4,5-dihydro-imidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester



20

Eine Lösung von 2.08 g (9.06 mMol) 3-(Benzylmethylamino)-propionsäure, 2.72 g (8.96 mMol) 2-[4-(2-Methylaminoethyl)-phenyl]-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester (siehe Vorschrift 1g), 5.05 ml (36.24 mMol) Triethylamin und 2.91 g (9.06 mMol) TBTU in 350 ml Tetrahydrofuran wurde über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Danach wurde das Gemisch bis zur Trockne eingeengt, der Rückstand durch Säulenchromatographie (Elutionsmittel: Dichlormethan / Methanol / wässrige Ammoniak-Lösung 9:1:0.1) gereinigt.

25

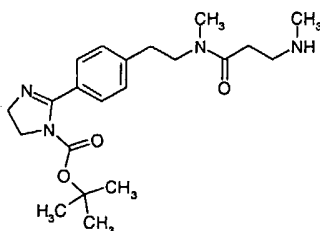
$C_{28}H_{38}N_4O_3$ (478.63)

Ausbeute: 84% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.19/1.20 (2s, 9H), 2.05-2.95 (m, 8H), 2.07/2.13 (2s, 3H), 2.81/2.92 (2s, 3H), 3.47 (m, 2H), 3.83 (m, 4H), 7.18-7.32 (m, 7H), 7.38 (t, 2H) ppm

5

41b) 2-(4-{2-[Methyl-(3-methylaminopropionyl)-amino]-ethyl}-phenyl)-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester



10

Eine Suspension von 3.59 g (7.50 mMol) 2-[4-(2-{[3-(Benzylmethylamino)-propionyl]-methylamino}-ethyl)-phenyl]-4,5-dihydroimidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester und 0.36 g Palladiumhydroxid in 40 ml Methanol wurden zehn Stunden im Autoklaven hydriert. Danach wurde der Katalysator abfiltriert und das Filtrat bis zur Trockne eingeeengt. Das so erhaltene Rohprodukt wurde durch Säulenchromatographie über Kieselgel (Elutionsmittel: Dichlormethan / Methanol / wässrige Ammoniak-Lösung 9:1:0.1 bis 4:1:0.1) gereinigt.

15

$C_{21}H_{32}N_4O_3$ (388.50)

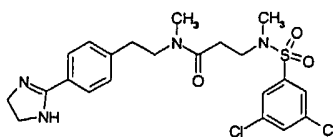
Ausbeute: 32% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.19/1.22 (2s, 9H), 2.18-2.94 (m, 6H), 2.23/2.27 (2s, 3H), 2.82/2.93 (2s, 3H), 3.49 (m, 2H), 3.84 (m, 4H), 7.23/7.27 (2d, 2H), 7.38/7.40 (2d, 2H) ppm

20

41c) 3-[(3,5-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-(2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat

25



Eine Lösung von 7.3 mg (13.15 μMol) 2-(4-{2-[Methyl-(3-methylaminopropionyl)-amino]-ethyl}-phenyl)-4,5-dihydro-imidazol-1-carbonsäure-*tert.*-butylester in 100 μl Acetonitril wurde mit 6.88 μl (65.77 μMol) Diisopropylethylamin und einer Lösung von 3.26 mg (13.15 μMol) 3,5-Dichlorbenzolsulfonsäurechlorid in 150 μl Acetonitril
5 versetzt. Die Reaktionsmischung wurde 1.5 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Dann wurde mit 500 μl Trifluoressigsäure-Wasser-Lösung (95/5) versetzt und weitere 30 min bei Raumtemperatur gerührt. Die Reaktionsmischung wurde danach in einer Christ-Speedvac bis zur Trockne eingengt und das so erhaltene Rohprodukt über HPLC gereinigt.

10 $\text{C}_{22}\text{H}_{26}\text{Cl}_2\text{N}_4\text{O}_3\text{S} \times \text{C}_2\text{HF}_3\text{O}_2$ (611.46)

Ausbeute: 66% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.87 min

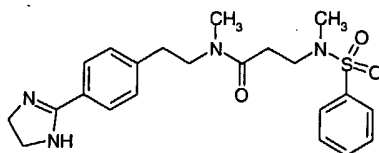
Analog zu Beispiel 41 wurden folgende Verbindungen hergestellt:

15

Beispiel 42

3-(Benzolsulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat

20



$\text{C}_{22}\text{H}_{28}\text{N}_4\text{O}_3\text{S} \times \text{C}_2\text{HF}_3\text{O}_2$ (542.57)

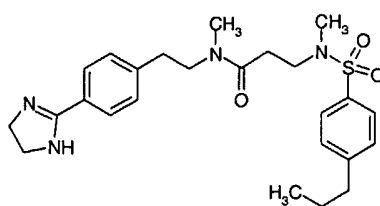
Ausbeute: 51% der Theorie

25 Retentionszeit (HPLC): 3.11 min

Beispiel 43

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-propyl-benzolsulfonyl)-amino]-propionamid Trifluoracetat

30



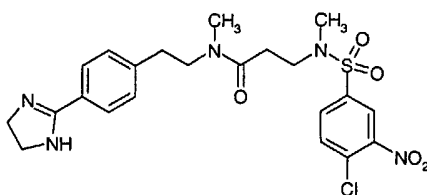
$C_{25}H_{34}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (584.66)

Ausbeute: 50% der Theorie

5 Retentionszeit (HPLC): 3.55 min

Beispiel 44

10 3-[(4-Chlor-3-nitrobenzoyl)-methylamino]-N-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-N-methylpropionamid Trifluoroacetat



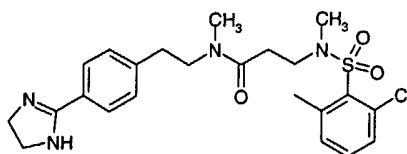
$C_{22}H_{26}ClN_5O_5S \times C_2HF_3O_2$ (622.02)

15 Ausbeute: 43% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.41 min

Beispiel 45

20 3-[(2-Chlor-6-methyl-benzoyl)-methylamino]-N-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-N-methylpropionamid Trifluoroacetat



25 $C_{23}H_{29}ClN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (591.05)

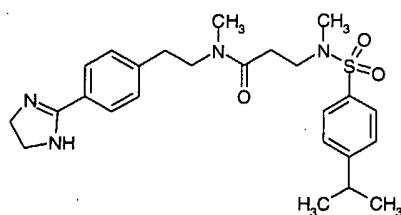
Ausbeute: 51% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.31 min

Beispiel 46

5

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(4-isopropylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat



10

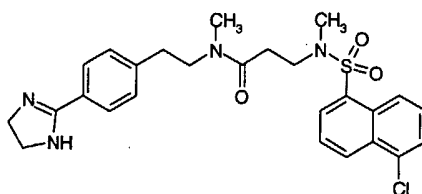
$C_{25}H_{34}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (584.66)

Ausbeute: 65% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.51 min

15 Beispiel 47

3-[(5-Chlornaphthalin-1-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat



20

$C_{26}H_{29}ClN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (627.08)

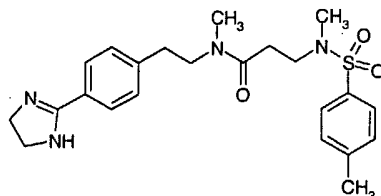
Ausbeute: 56% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.96 min

25

Beispiel 48

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(toluol-4-sulfonyl)-amino]-propionamid Trifluoracetat



5

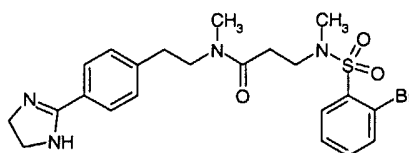
$C_{23}H_{30}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (556.60)

Ausbeute: 58% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.25 min

10 Beispiel 49

3-[(2-Brombenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat



15

$C_{22}H_{27}BrN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (621.47)

Ausbeute: 52% der Theorie

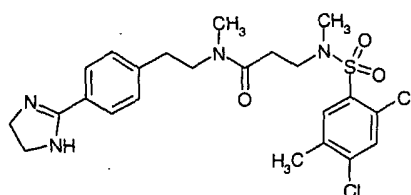
Retentionszeit (HPLC): 3.24 min

20

Beispiel 50

3-[(2,4-Dichlor-5-methyl-benzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat

25



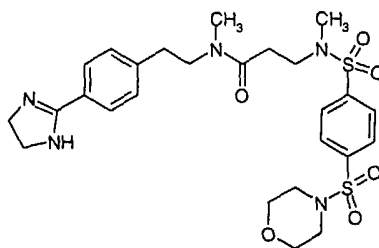
$C_{23}H_{28}Cl_2N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (625.49)

Ausbeute: 70% der Theorie

5 Retentionszeit (HPLC): 3.56 min

Beispiel 51

10 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-[4-(morpholin-4-sulfonyl)-benzolsulfonyl]-amino]-propionamid Trifluoracetat



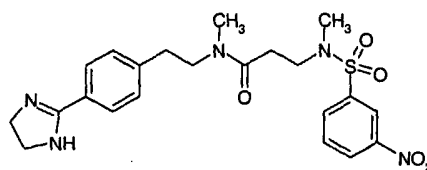
$C_{26}H_{35}N_5O_6S_2 \times C_2HF_3O_2$ (691.74)

15 Ausbeute: 51% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.20 min

Beispiel 52

20 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(3-nitrobenzoyl)sulfonyl]-amino]-propionamid Trifluoracetat



$C_{22}H_{27}N_5O_5S \times C_2HF_3O_2$ (587.57)

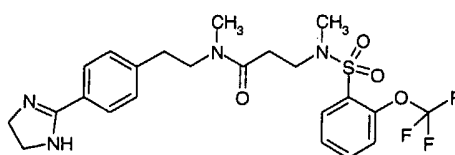
Ausbeute: 45% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.23 min

5 Beispiel 53

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(2-trifluoromethoxybenzolsulfonyl)-amino]-propionamid Trifluoracetat

10



$C_{23}H_{27}F_3N_4O_4S \times C_2HF_3O_2$ (626.57)

Ausbeute: 74% der Theorie

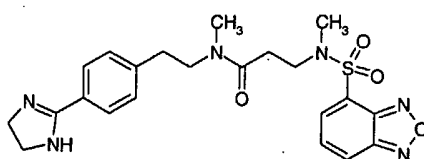
Retentionszeit (HPLC): 3.39 min

15

Beispiel 54

3-[(Benzo[1,2,5]oxadiazole-4-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat

20



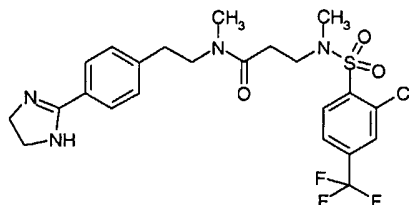
$C_{22}H_{26}N_6O_4S \times C_2HF_3O_2$ (584.57)

Ausbeute: 24% der Theorie

25 Retentionszeit (HPLC): 3.15 min

Beispiel 55

3-[(2-Chlor-4-trifluormethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat



5

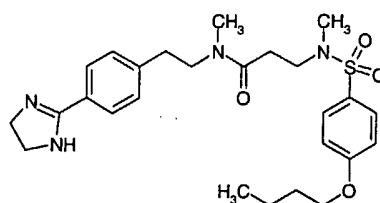
$C_{23}H_{26}ClF_3N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (645.02)

Ausbeute: 50% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.55 min

10 Beispiel 56

3-[(4-Butoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat



15

$C_{26}H_{36}N_4O_4S \times C_2HF_3O_2$ (614.68)

Ausbeute: 61% der Theorie

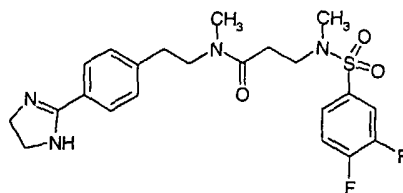
Retentionszeit (HPLC): 3.64 min

20

Beispiel 57

3-[(3,4-Difluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat

25



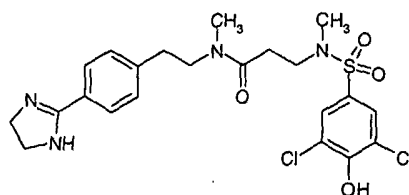
$C_{22}H_{26}F_2N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (578.55)

Ausbeute: 62% der Theorie

5 Retentionszeit (HPLC): 3.28 min

Beispiel 58

10 3-[(3,5-Dichlor-4-hydroxybenzoyl)-methylamino]-N-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-N-methylpropionamid Trifluoroacetat



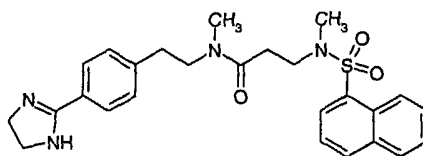
$C_{22}H_{26}Cl_2N_4O_4S \times C_2HF_3O_2$ (627.46)

15 Ausbeute: 53% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.22 min

Beispiel 59

20 N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-N-methyl-3-[methyl-(naphthalin-1-sulfonyl)-amino]-propionamid Trifluoroacetat



25 $C_{26}H_{30}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (592.63)

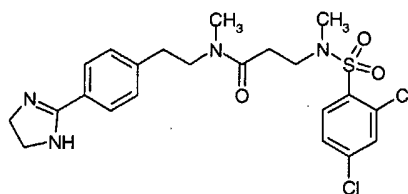
Ausbeute: 56% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.37 min

Beispiel 60

5

3-[(2,4-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat



10

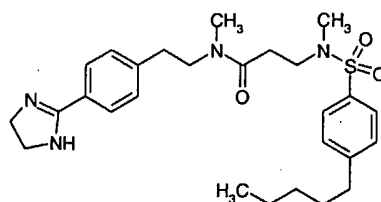
$C_{22}H_{26}Cl_2N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (611.46)

Ausbeute: 72% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.42 min

15 Beispiel 61

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-pentyl-benzolsulfonyl)-amino]-propionamid Trifluoracetat



20

$C_{27}H_{38}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (612.71)

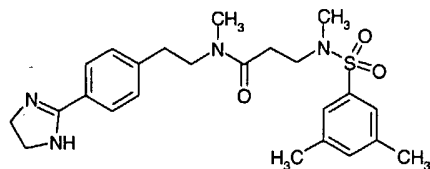
Ausbeute: 62% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.84 min

25

Beispiel 62

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(3,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat



5

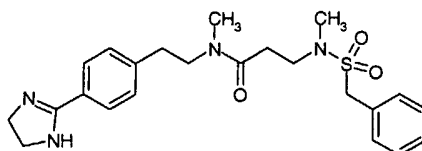
$C_{24}H_{32}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (570.63)

Ausbeute: 52% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.39 min

10 Beispiel 63

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-(methylphenyl-methansulfonylamino)-propionamid Trifluoracetat



15

$C_{23}H_{30}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (556.60)

Ausbeute: 40% der Theorie

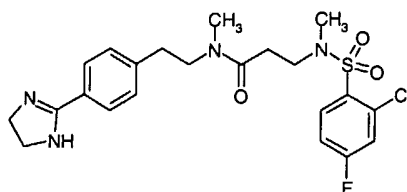
Retentionszeit (HPLC): 3.14 min

20

Beispiel 64

3-[(2-Chlor-4-fluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat

25



$C_{22}H_{26}ClFN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (595.01)

Ausbeute: 63% der Theorie

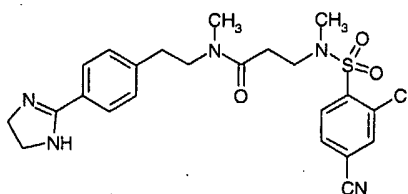
Retentionszeit (HPLC): 3.29 min

5

Beispiel 65

3-[(2-Chlor-4-cyanbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoacetat

10



$C_{23}H_{26}ClN_5O_3S \times C_2HF_3O_2$ (602.03)

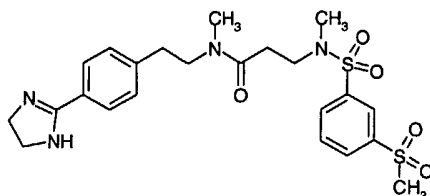
Ausbeute: 59% der Theorie

15 Retentionszeit (HPLC): 3.25 min

Beispiel 66

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(3-methansulfonyl-benzol-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid Trifluoacetat

20



$C_{23}H_{30}N_4O_5S_2 \times C_2HF_3O_2$ (620.67)

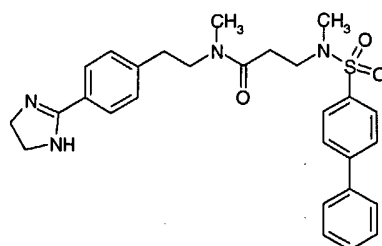
25 Ausbeute: 72% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.01 min

Beispiel 67

3-[(Biphenyl-4-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat

5



$C_{28}H_{32}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (618.67)

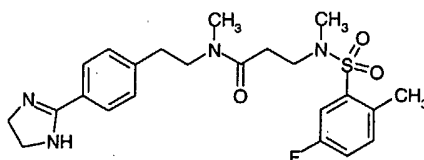
Ausbeute: 39% der Theorie

10 Retentionszeit (HPLC): 3.58 min

Beispiel 68

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(5-fluor-2-methylbenzol-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat

15



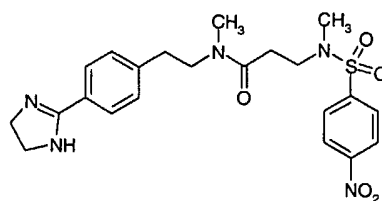
$C_{23}H_{29}FN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (574.59)

20 Ausbeute: 61% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.28 min

Beispiel 69

25 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-nitrobenzolsulfonyl)-amino]-propionamid Trifluoracetat



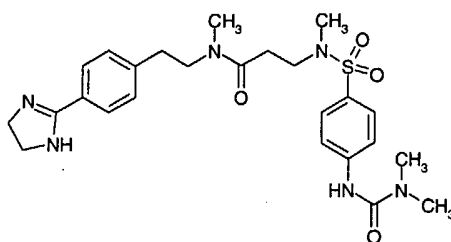
$C_{22}H_{27}N_5O_5S \times C_2HF_3O_2$ (587.57)

Ausbeute: 53% der Theorie

5 Retentionszeit (HPLC): 3.22 min

Beispiel 70

10 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[[4-(3,3-dimethylureido)-benzoyl]-methylamino]-*N*-methylpropionamid Trifluoroacetat



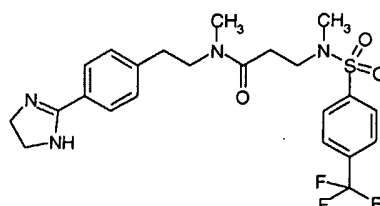
$C_{25}H_{34}N_6O_4S \times C_2HF_3O_2$ (628.67)

15 Ausbeute: 59% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 2.98 min

Beispiel 71

20 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-trifluoromethylbenzoyl)-amino]-propionamid Trifluoroacetat



$C_{23}H_{27}F_3N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (610.57)

Ausbeute: 61% der Theorie

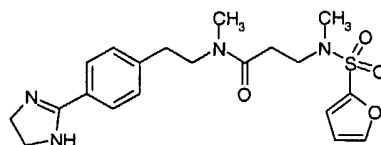
Retentionszeit (HPLC): 3.46 min

5

Beispiel 72

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(furan-2-sulfonyl)-methyl-amino]-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat

10



$C_{20}H_{26}N_4O_4S \times C_2HF_3O_2$ (532.54)

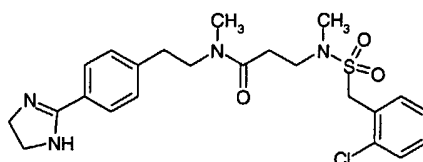
Ausbeute: 84% der Theorie

15 Retentionszeit (HPLC): 3.01 min

Beispiel 73

3-[(2-Chlorphenylmethansulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat

20



$C_{23}H_{29}ClN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (591.05)

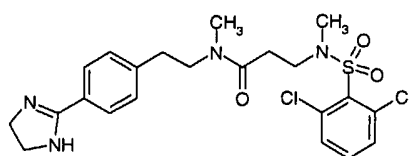
25 Ausbeute: 22% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.27 min

Beispiel 74

3-[(2,6-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat

5



$C_{22}H_{26}Cl_2N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (611.46)

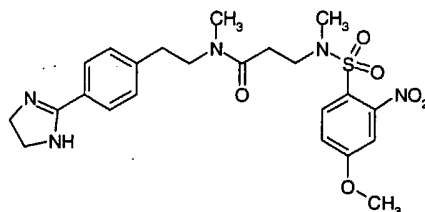
Ausbeute: 63% der Theorie

10 Retentionszeit (HPLC): 3.30 min

Beispiel 75

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(4-methoxy-2-nitrobenzol-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat

15



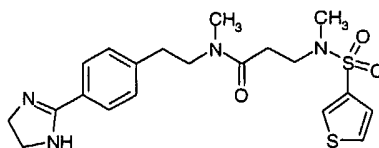
$C_{23}H_{29}N_5O_6S \times C_2HF_3O_2$ (617.60)

20 Ausbeute: 48% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.26 min

Beispiel 76

25 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(thiophen-3-sulfonyl)-amino]-propionamid Trifluoracetat



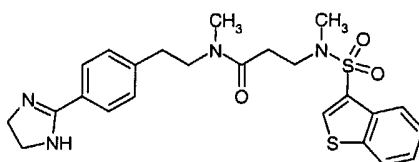
$C_{20}H_{26}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (548.60)

Ausbeute: 70% der Theorie

5 Retentionszeit (HPLC): 3.03 min

Beispiel 77

10 3-[(Benzo[b]thiophen-3-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoroacetat



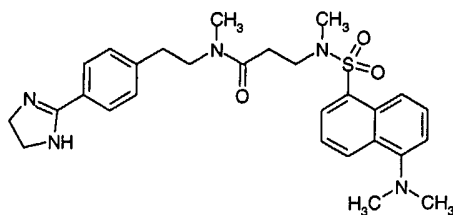
$C_{24}H_{28}N_4O_3S_2 \times C_2HF_3O_2$ (598.66)

15 Ausbeute: 52% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.36 min

Beispiel 78

20 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(5-dimethylaminonaphthalin-1-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid Trifluoroacetat



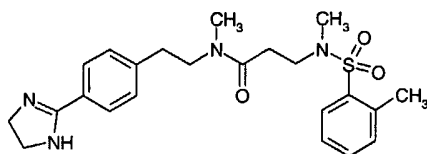
25 $C_{28}H_{35}N_5O_3S \times C_2HF_3O_2$ (635.70)

Ausbeute: 79% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.09 min

Beispiel 79

- 5 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(toluol-2-sulfonyl)-amino]-propionamid Trifluoracetat
-



- 10 $C_{23}H_{30}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (556.60)

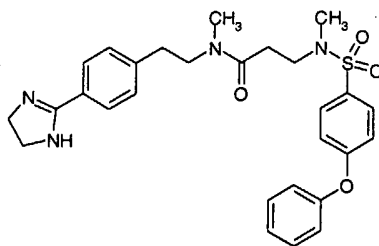
Ausbeute: 53% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.22 min

Beispiel 80

15

- N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-phenoxybenzolsulfonyl)-amino]-propionamid Trifluoracetat
-



20

- $C_{28}H_{32}N_4O_4S \times C_2HF_3O_2$ (634.67)

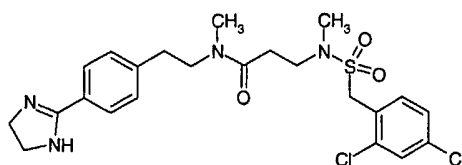
Ausbeute: 60% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.61 min

Beispiel 81

3-[(2,4-Dichlorphenylmethansulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat

5



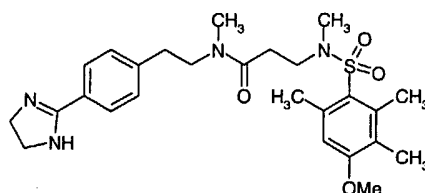
$C_{23}H_{28}Cl_2N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (625.49)

Ausbeute: 25% der Theorie

10 Retentionszeit (HPLC): 3.46 min

Beispiel 82

15 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(4-methoxy-2,3,6-trimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid Trifluoracetat



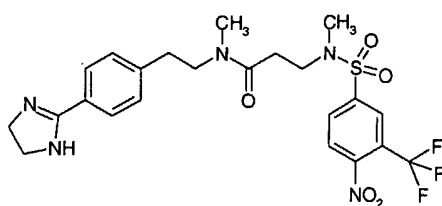
$C_{26}H_{36}N_4O_4S \times C_2HF_3O_2$ (614.68)

20 Ausbeute: 53% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.46 min

Beispiel 83

25 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-nitro-3-trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-propionamid Trifluoracetat



$C_{23}H_{26}F_3N_5O_5S \times C_2HF_3O_2$ (655.57)

Ausbeute: 60% der Theorie

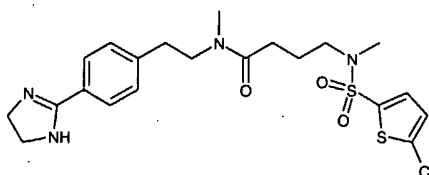
5 Retentionszeit (HPLC): 3.53 min

Ebenso analog zu Beispiel 41 wurden folgende Verbindungen hergestellt:

Beispiel 84

10

4-[(5-Chlorthiophen-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



15

$C_{21}H_{27}ClN_4O_3S_2 \times C_2HF_3O_2$ (597.07)

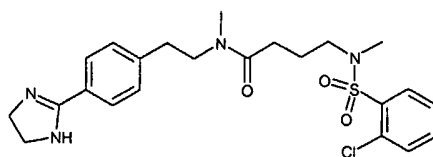
Ausbeute: 22% der Theorie

1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.60/1.69 (2m, 2H, Rotamere), 2.11/2.28 (2t, 2H, Rotamere), 2.67/2.71 (2s, 3H, Rotamere), 2.81/2.91 (2s, 3H, Rotamere), 2.83-3.02 (m, 4H), 3.54 (m, 2H), 4.00 (s, 4H), 7.35 (d, 1H), 7.50-7.58 (m, 3H), 7.85/7.88 (2d, 2H, Rotamere), 10.42 (s br, 1H) ppm

20

Beispiel 85

25 4-[(2-Chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



$C_{23}H_{29}ClN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (591.04)

Ausbeute: 31% der Theorie

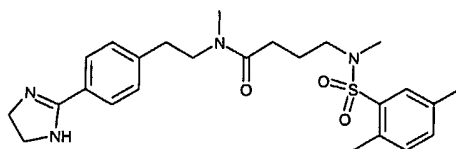
- 5 1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.60/1.69 (2m, 2H, Rotamere), 2.08/2.22 (2t, 2H, Rotamere), 2.77/2.81 (2s, 3H, Rotamere), 2.80/2.88 (2s, 3H, Rotamere), 2.83/2.94 (2t, 2H, Rotamere), 3.10/3.18 (2t, 2H, Rotamere), 3.52 (t, 2H), 4.00 (s, 4H), 7.50-7.58 (m, 3H), 7.67 (m, 2H), 7.85/7.87 (2d, 2H, Rotamere), 7.94 (m, 1H), 10.42 (s br, 1H) ppm

10

Beispiel 86

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoroacetat

15



$C_{25}H_{34}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (584.65)

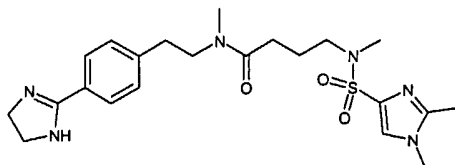
Ausbeute: 30% der Theorie

- 20 1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.60/1.68 (2m, 2H, Rotamere), 2.08/2.22 (2t, 2H, Rotamere), 2.34 (s, 3H), 2.46/2.47 (2s, 3H, Rotamere), 2.69/2.73 (2s, 3H, Rotamere), 2.80/2.88 (2s, 3H, Rotamere), 2.85/2.94 (2t, 2H, Rotamere), 3.03/3.10 (2t, 2H, Rotamere), 3.52 (t, 2H), 4.00 (s, 4H), 7.31/7.36 (2d, 2H, Rotamere), 7.49-7.58 (m, 3H), 7.85/7.88 (2d, 2H, Rotamere), 10.42/10.43 (2s, 1H, Rotamere) ppm

25

Beispiel 87

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(1,2-dimethyl-1*H*-imidazol-4-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoroacetat



$C_{22}H_{32}N_6O_3S \times C_2HF_3O_2$ (574.62)

5 Ausbeute: 22% der Theorie

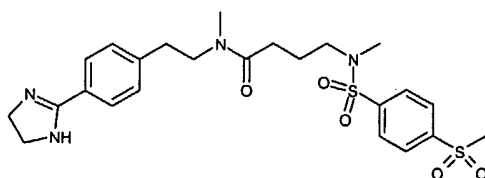
1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.57/1.67 (2m, 2H, Rotamere), 2.09/2.27 (2t, 2H, Rotamere), 2.30 (s, 3H), 2.61/2.65 (2s, 3H, Rotamere), 2.81/2.91 (2s, 3H, Rotamere), 2.83-3.00 (m, 4H), 3.60 (s, 3H), 4.00 (s, 4H), 7.53/7.58 (2d, 2H, Rotamere), 7.68 (s, 1H), 7.85/7.88 (2d, 2H, Rotamere), 10.41/10.44 (2s, 1H,

10 Rotamere) ppm

Beispiel 88

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(4-methansulfonyl)-benzolsulfonyl]-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

15



$C_{24}H_{32}N_4O_5S_2 \times C_2HF_3O_2$ (634.69)

20 Ausbeute: 32% der Theorie

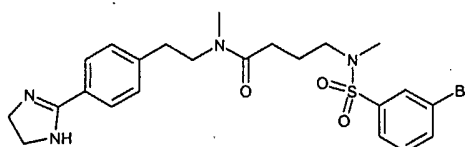
1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.58/1.67 (2m, 2H, Rotamere), 2.12/2.27 (2t, 2H, Rotamere), 2.68/2.72 (2s, 3H, Rotamere), 2.81/2.90 (2s, 3H, Rotamere), 2.83-3.04 (m, 4H), 3.33 (s, 3H), 3.54 (m, 2H), 4.00 (s, 4H), 7.53/7.56 (2d, 2H, Rotamere), 7.85/7.89 (2d, 2H, Rotamere), 8.00/8.02 (2d, 2H, Rotamere), 8.17 (d, 2H),

25 10.42/10.44 (2s, 1H, Rotamere) ppm

Beispiel 89

4-[(3-Brombenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-(2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

5



$C_{23}H_{29}BrN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (635.50)

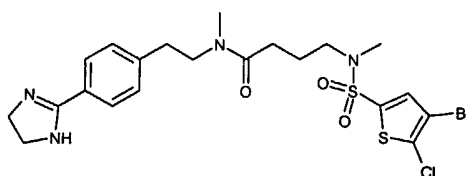
Ausbeute: 23% der Theorie

- 10 1H -NMR (d_6 -DMSO): δ = 1.57/1.66 (2m, 2H, Rotamere), 2.11/2.26 (2t, 2H, Rotamere), 2.65/2.68 (2s, 3H, Rotamere), 2.81/2.91 (2s, 3H, Rotamere), 2.83-3.01 (m, 4H), 3.54 (m, 2H), 4.00 (s, 4H), 7.50-7.63 (m, 3H), 7.76 (t, 1H), 7.83-7.95 (m, 4H), 10.41/10.43 (2s, 1H, Rotamere) ppm

15 Beispiel 90

4-[(4-Brom-5-chlorthiophen-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-(2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

20



$C_{21}H_{26}BrClN_4O_3S_2 \times C_2HF_3O_2$ (675.97)

Ausbeute: 27% der Theorie

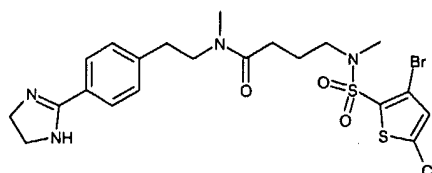
Retentionszeit (HPLC): 3.51 min

25

Beispiel 91

4-[(3-Brom-5-chlorthiophen-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-(2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

5



$C_{21}H_{26}BrClN_4O_3S_2 \times C_2HF_3O_2$ (675.97)

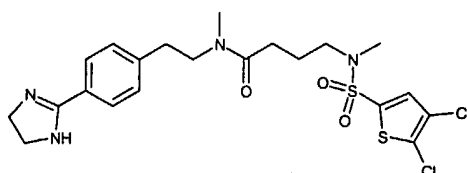
Ausbeute: 32% der Theorie

10 Retentionszeit (HPLC): 3.41 min

Beispiel 92

4-[(4,5-Dichlorthiophen-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-(2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

15



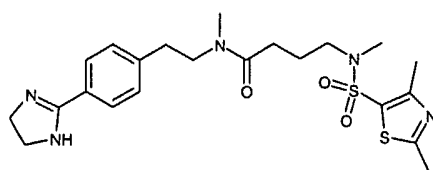
$C_{21}H_{26}Cl_2N_4O_3S_2 \times C_2HF_3O_2$ (631.52)

20 Ausbeute: 23% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.50 min

Beispiel 93

25 *N*-(2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-4-[(2,4-dimethylthiazol-5-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



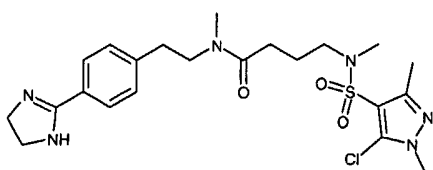
$C_{22}H_{31}N_5O_3S_2 \times C_2HF_3O_2$ (591.67)

Ausbeute: 19% der Theorie

5 Retentionszeit (HPLC): 2.97 min

Beispiel 94

10 4-[(5-Chlor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-sulfonyl)-methylamino]-N-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-N-methylbutyramid Trifluoroacetat



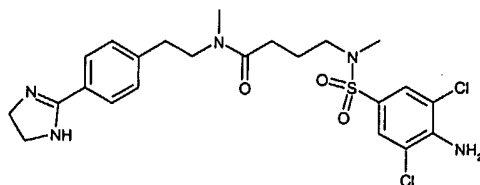
$C_{22}H_{31}ClN_6O_3S \times C_2HF_3O_2$ (609.07)

15 Ausbeute: 40% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 2.97 min

Beispiel 95

20 4-[(4-Amino-3,5-dichlorobenzylsulfonyl)-methylamino]-N-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-N-methylbutyramid Trifluoroacetat



25 $C_{23}H_{29}Cl_2N_5O_3S \times C_2HF_3O_2$ (640.51)

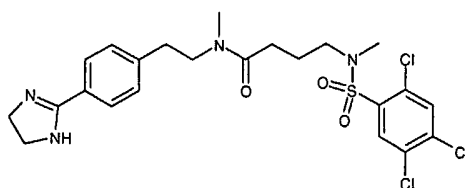
Ausbeute: 38% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.21 min

Beispiel 96

5

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(2,4,5-trichlorbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat



10

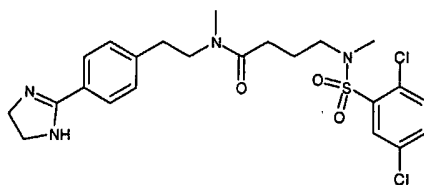
$C_{23}H_{27}Cl_3N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (659.94)

Ausbeute: 25% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.51 min

15 Beispiel 97

4-[(2,5-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



20

$C_{23}H_{28}Cl_2N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (625.49)

Ausbeute: 32% der Theorie

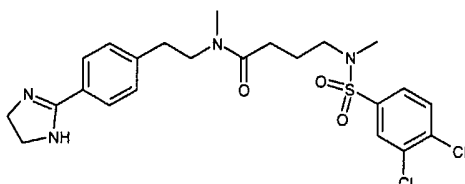
Retentionszeit (HPLC): 3.32 min

25

Beispiel 98

4-[(3,4-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

5



$C_{23}H_{28}Cl_2N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (625.49)

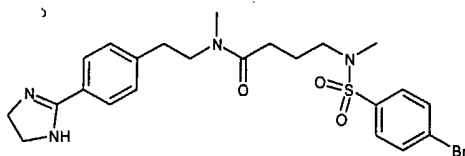
Ausbeute: 26% der Theorie

10 Retentionszeit (HPLC): 3.42 min

Beispiel 99

4-[(4-Brombenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

15



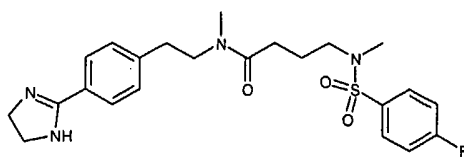
$C_{23}H_{29}BrN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (635.50)

20 Ausbeute: 34% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.29 min

Beispiel 100

25 4-[(4-Fluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



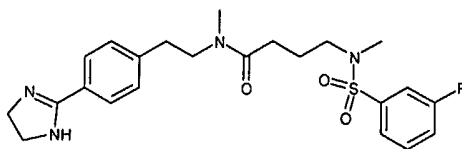
$C_{23}H_{29}FN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (574.59)

Ausbeute: 30% der Theorie

5 Retentionszeit (HPLC): 3.11 min

Beispiel 101

10 4-[(3-Fluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-N-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-N-methylbutyramid Trifluoracetat



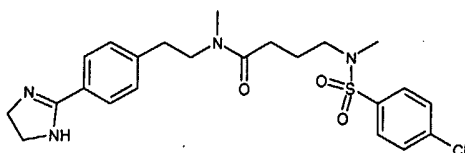
$C_{23}H_{29}ClN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (574.59)

15 Ausbeute: 33% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.14 min

Beispiel 102

20 4-[(4-Chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-N-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-N-methylbutyramid Trifluoracetat



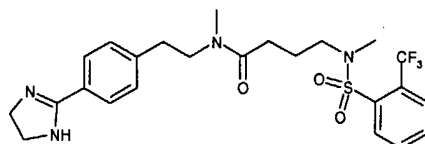
25 $C_{23}H_{29}ClN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (591.05)

Ausbeute: 28% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.24 min

Beispiel 103

- 5 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(2-trifluoromethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat
-

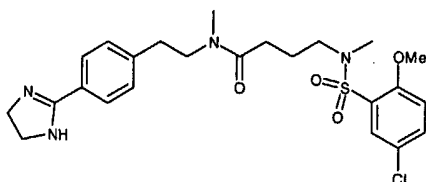


$C_{24}H_{29}F_3N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (624.60)

- 10 Ausbeute: 36% der Theorie
Retentionszeit (HPLC): 3.24 min

Beispiel 104

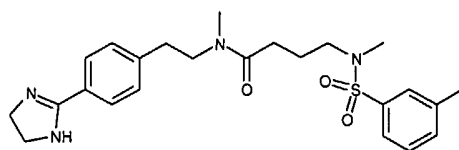
- 15 4-[(5-Chlor-2-methoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat
-



- 20 $C_{24}H_{31}ClN_4O_4S \times C_2HF_3O_2$ (621.07)
Ausbeute: 31% der Theorie
Retentionszeit (HPLC): 3.25 min

Beispiel 105

- 25 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(toluol-3-sulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat
-



$C_{24}H_{32}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (570.63)

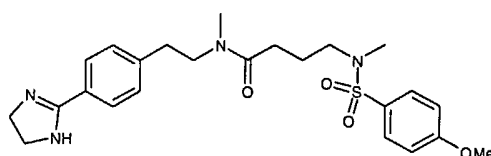
Ausbeute: 21% der Theorie

5 Retentionszeit (HPLC): 3.19 min

Beispiel 106

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(4-methoxybenzoyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

10



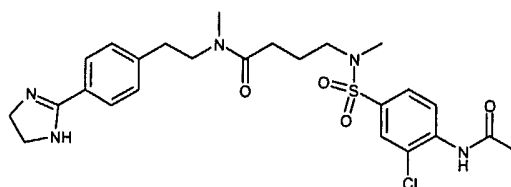
$C_{24}H_{32}FN_4O_4S \times C_2HF_3O_2$ (586.63)

15 Ausbeute: 32% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.10 min

Beispiel 107

20 4-[(4-Acetylamino-3-chlorbenzoyl)sulfonyl]-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



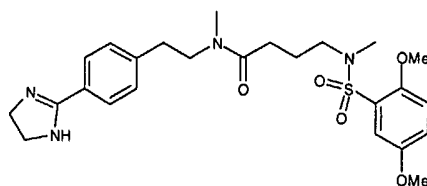
25 $C_{25}H_{32}ClN_5O_4S \times C_2HF_3O_2$ (648.10)

Ausbeute: 34% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 2.98 min

Beispiel 108

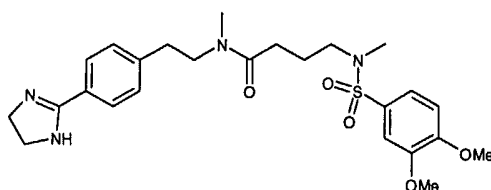
- 5 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(2,5-dimethoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat
-



- 10 $C_{25}H_{34}N_4O_5S \times C_2HF_3O_2$ (616.65)
Ausbeute: 33% der Theorie
Retentionszeit (HPLC): 3.09 min

Beispiel 109

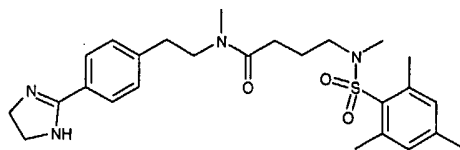
- 15 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(3,4-dimethoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat
-



- 20 $C_{25}H_{34}N_4O_5S \times C_2HF_3O_2$ (616.65)
Ausbeute: 37% der Theorie
Retentionszeit (HPLC): 3.02 min

25 Beispiel 110

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(2,4,6-trimethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat



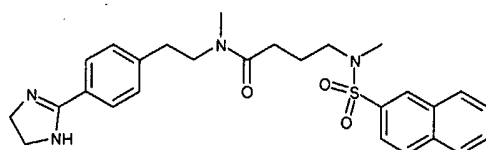
$C_{26}H_{36}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (598.68)

5 Ausbeute: 32% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.37 min

Beispiel 111

10 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(naphthalin-2-sulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat



15 $C_{27}H_{32}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (606.66)

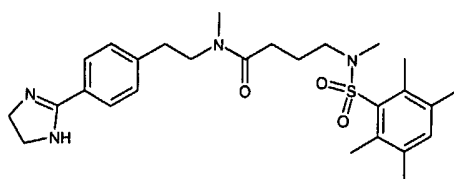
Ausbeute: 28% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.35 min

Beispiel 112

20

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(2,3,5,6-tetramethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat



25

$C_{27}H_{38}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (612.71)

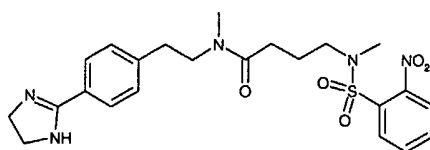
Ausbeute: 29% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.46 min

Beispiel 113

5

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(2-nitro-methylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat



10

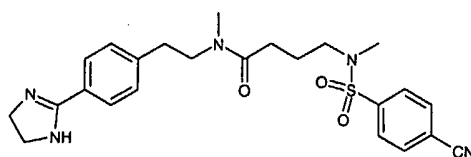
$C_{23}H_{29}N_5O_5S \times C_2HF_3O_2$ (601.60)

Ausbeute: 2% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.11 min

15 Beispiel 114

4-[(4-Cyanbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



20

$C_{24}H_{29}N_5O_3S \times C_2HF_3O_2$ (581.61)

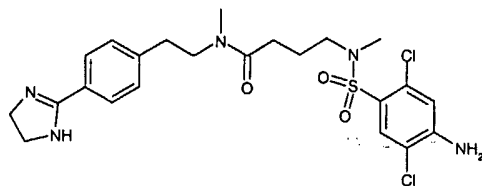
Ausbeute: 2% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.06 min

25

Beispiel 115

4-[(4-Amino-2,5-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



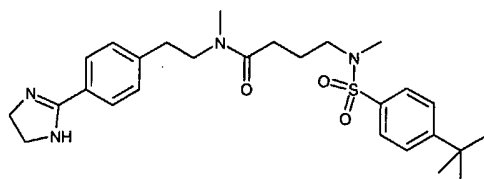
$C_{23}H_{29}Cl_2N_5O_3S \times C_2HF_3O_2$ (640.51)

5 Ausbeute: 2% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.15 min

Beispiel 116

10 4-[(4-*tert.*-Butylbenzoylsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoroacetat



15 $C_{27}H_{38}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (612.71)

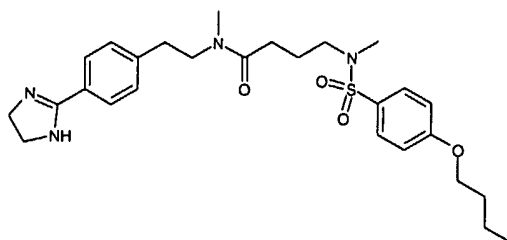
Ausbeute: 18% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.53 min

Beispiel 117

20

4-[(4-Butoxybenzoylsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoroacetat



$C_{27}H_{38}N_4O_4S \times C_2HF_3O_2$ (628.71)

Ausbeute: 30% der Theorie

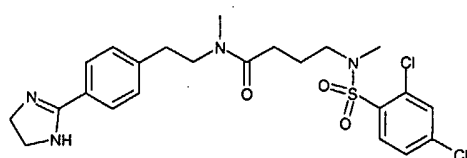
Retentionszeit (HPLC): 3.58 min

5

Beispiel 118

4-[(2,4-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

10



$C_{23}H_{28}Cl_2N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (625.49)

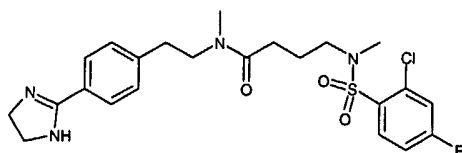
Ausbeute: 27% der Theorie

15 Retentionszeit (HPLC): 3.37 min

Beispiel 119

4-[(2-Chlor-4-fluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

20



$C_{23}H_{28}ClFN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (609.04)

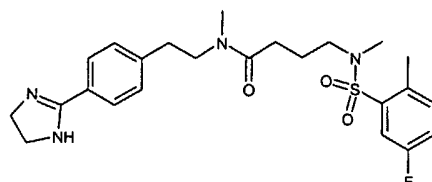
25 Ausbeute: 21% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.22 min

Beispiel 120

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(5-fluor-2-methylbenzol-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

5



$C_{24}H_{31}FN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (588.62)

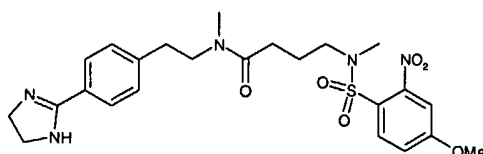
Ausbeute: 25% der Theorie

10 Retentionszeit (HPLC): 3.22 min

Beispiel 121

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(4-methoxy-2-nitrobenzol-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

15



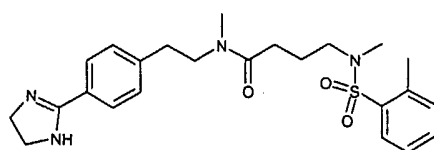
$C_{24}H_{31}N_5O_6S \times C_2HF_3O_2$ (631.62)

20 Ausbeute: 42% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.20 min

Beispiel 122

25 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(toluol-2-sulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat



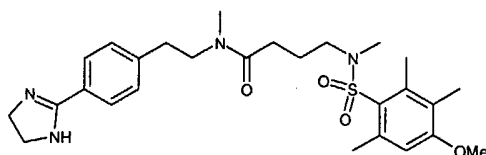
$C_{24}H_{32}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (570.63)

Ausbeute: 24% der Theorie

5 Retentionszeit (HPLC): 3.16 min

Beispiel 123

10 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(4-methoxy-2,3,6-trimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoroacetat



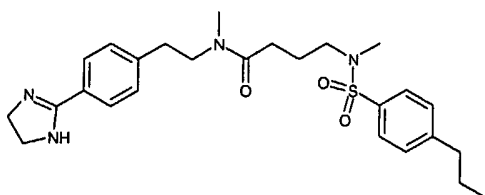
$C_{27}H_{38}N_4O_4S \times C_2HF_3O_2$ (628.71)

15 Ausbeute: 37% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.37 min

Beispiel 124

20 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-propylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoroacetat



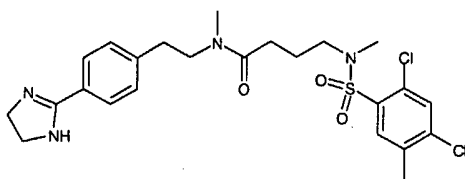
25 $C_{26}H_{36}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (598.68)

Ausbeute: 16% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.48 min

Beispiel 125

- 5 4-[(2,4-Dichlor-5-methylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat
-



- 10 $C_{24}H_{30}Cl_2N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (639.52)

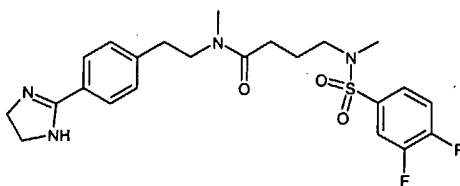
Ausbeute: 37% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.45 min

Beispiel 126

15

- 4-[(3,4-Difluorbenzoyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat
-



20

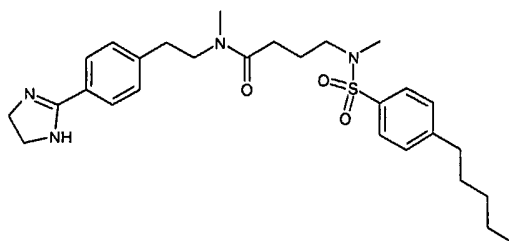
- $C_{23}H_{28}F_2N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (592.58)

Ausbeute: 19% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.21 min

- 25 Beispiel 127

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-pentylbenzoyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat



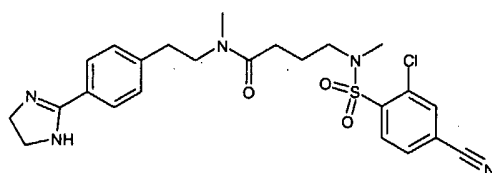
$C_{28}H_{40}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (626.74)

5 Ausbeute: 32% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.77 min

Beispiel 128

10 4-[(2-Chlor-4-cyanbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



15 $C_{24}H_{28}ClN_5O_3S \times C_2HF_3O_2$ (616.06)

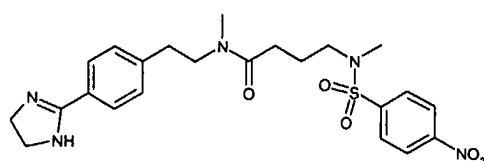
Ausbeute: 26% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.19 min

Beispiel 129

20

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-nitro-methylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat



$C_{23}H_{29}N_5O_5S \times C_2HF_3O_2$ (601.60)

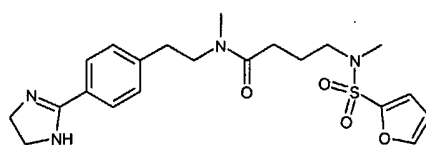
Ausbeute: 18% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.16 min

5 Beispiel 130

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(furan-2-sulfonyl)-methyl-amino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

10



$C_{21}H_{28}N_4O_4S \times C_2HF_3O_2$ (546.56)

Ausbeute: 47% der Theorie

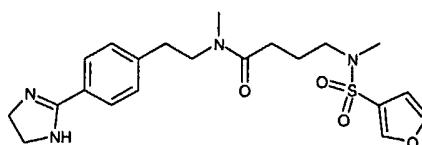
Retentionszeit (HPLC): 2.93 min

15

Beispiel 131

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(furan-3-sulfonyl)-methyl-amino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

20



$C_{21}H_{28}N_4O_4S \times C_2HF_3O_2$ (546.56)

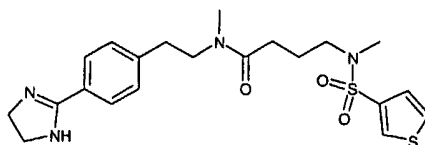
Ausbeute: 42% der Theorie

25 Retentionszeit (HPLC): 2.89 min

Beispiel 132

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(thiophen-3-sulfonyl)-methyl-amino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

5



$C_{21}H_{28}N_4O_3S_2 \times C_2HF_3O_2$ (562.63)

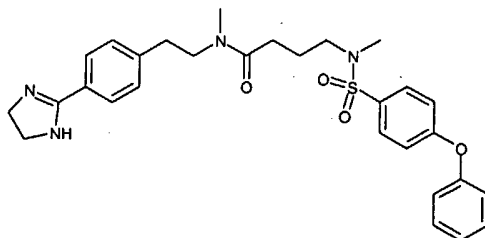
Ausbeute: 23% der Theorie

10 Retentionszeit (HPLC): 2.95 min

Beispiel 133

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-phenoxy-benzolsulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat

15



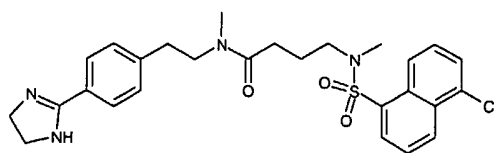
$C_{29}H_{34}N_4O_4S \times C_2HF_3O_2$ (648.70)

20 Ausbeute: 33% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.50 min

Beispiel 134

25 4-[(5-Chlornaphthalene-1-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



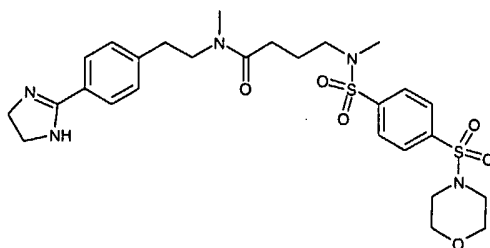
$C_{27}H_{31}ClN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (641.11)

Ausbeute: 21% der Theorie

5 Retentionszeit (HPLC): 3.49 min

Beispiel 135

10 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[(methyl-[4-(morpholin-4-sulfonyl)-benzolsulfonyl]-amino)-butyramid] Trifluoroacetat



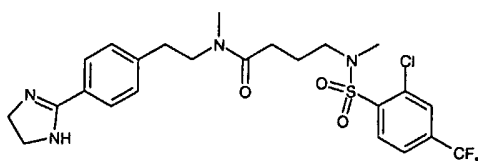
$C_{27}H_{37}N_5O_6S_2 \times C_2HF_3O_2$ (705.77)

15 Ausbeute: 45% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.09 min

Beispiel 136

20 4-[(2-Chlor-4-trifluormethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoroacetat



25 $C_{24}H_{28}ClF_3N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (659.04)

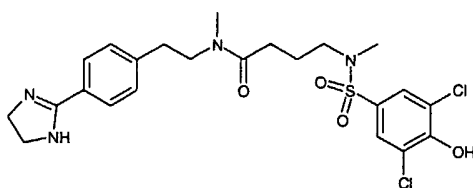
Ausbeute: 31% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.45 min

Beispiel 137

5

4-[(3,5-Dichlor-4-hydroxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



10

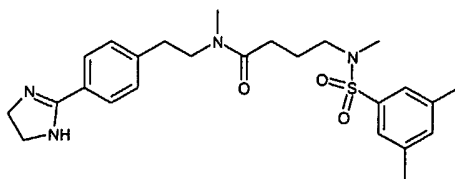
$C_{23}H_{28}Cl_2N_4O_4S \times C_2HF_3O_2$ (641.49)

Ausbeute: 28% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.11 min

15 Beispiel 138

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(3,5-dimethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat



20

$C_{25}H_{34}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (584.66)

Ausbeute: 28% der Theorie

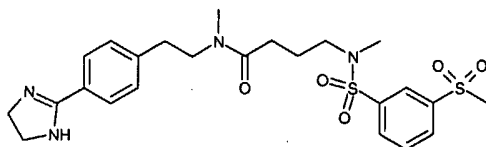
Retentionszeit (HPLC): 3.31 min

25

Beispiel 139

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(3-methansulfonylbenzol-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

5



$C_{24}H_{32}N_4O_5S_2 \times C_2HF_3O_2$ (634.69)

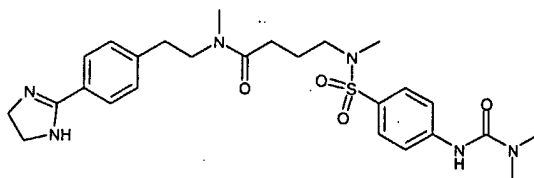
Ausbeute: 22% der Theorie

10 Retentionszeit (HPLC): 2.91 min

Beispiel 140

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[[4-(3,3-dimethylharnstoff)-benzolsulfonyl]-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat

15



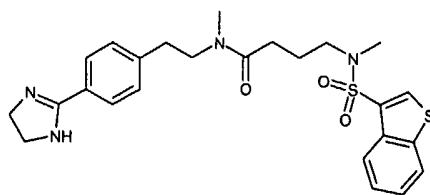
$C_{26}H_{36}N_6O_4S \times C_2HF_3O_2$ (642.69)

20 Ausbeute: 57% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 2.91 min

Beispiel 141

25 4-[(Benzo[b]thiophen-3-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



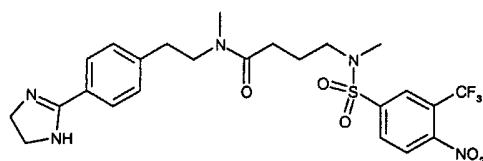
$C_{25}H_{30}N_4O_3S_2 \times C_2HF_3O_2$ (612.69)

Ausbeute: 35% der Theorie

5 Retentionszeit (HPLC): 3.31 min

Beispiel 142

10 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-nitro-3-trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat



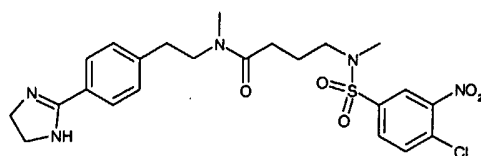
$C_{24}H_{28}F_3N_5O_5S \times C_2HF_3O_2$ (669.60)

15 Ausbeute: 23% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.41 min

Beispiel 143

20 4-[(4-Chlor-3-nitrobenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



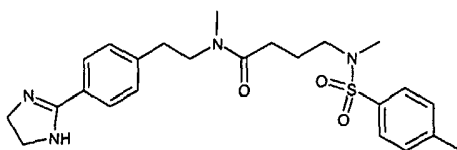
25 $C_{23}H_{28}ClN_5O_5S \times C_2HF_3O_2$ (636.04)

Ausbeute: 34% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.29 min

Beispiel 144

- 5 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(toluol-4-sulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat
-



- 10 $C_{24}H_{32}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (570.63)

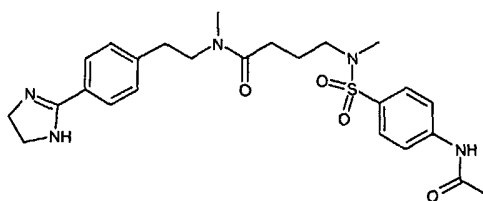
Ausbeute: 25% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.18 min

Beispiel 145

15

- 4-[4-Acetylaminobenzolsulfonyl]-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat
-



20

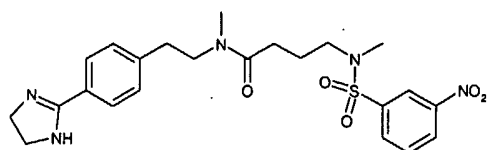
- $C_{25}H_{33}N_5O_4S \times C_2HF_3O_2$ (613.65)

Ausbeute: 58% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 2.86 min

25 Beispiel 146

- N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(3-nitro-methylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat
-



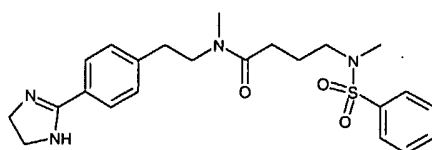
$C_{23}H_{29}N_5O_5S \times C_2HF_3O_2$ (601.60)

5 Ausbeute: 32% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.12 min

Beispiel 147

- 10 4-(Benzolsulfonylmethylamino)-*N*-[2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl]-*N*-methylbutyramid Trifluoroacetat
-



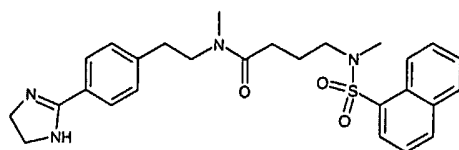
15 $C_{23}H_{30}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (556.60)

Ausbeute: 21% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.04 min

Beispiel 148

- 20 *N*-[2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl]-*N*-methyl-4-[methyl-(naphthalin-1-sulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoroacetat
-



25

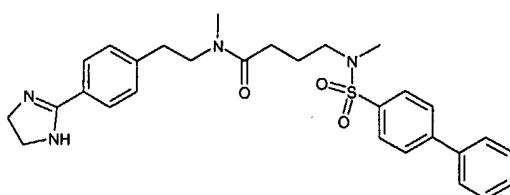
$C_{27}H_{32}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (606.66)

Ausbeute: 16% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.27 min

Beispiel 149

- 5 4-(Biphenyl-4-sulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat
-



- 10 $C_{29}H_{34}N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (632.70)

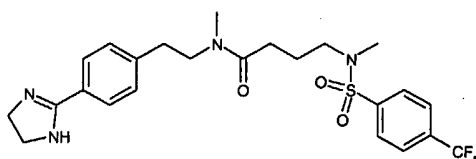
Ausbeute: 17% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.50 min

Beispiel 150

15

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat



20

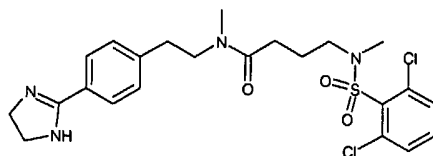
- $C_{24}H_{29}F_3N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (624.60)

Ausbeute: 27% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.35 min

25 Beispiel 151

4-[(2,6-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



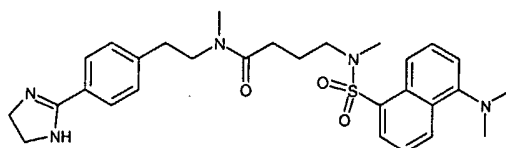
$C_{23}H_{28}Cl_2N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (625.49)

5 Ausbeute: 28% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.21 min

Beispiel 152

10 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(5-dimethylaminonaphthalin-1-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



15 $C_{29}H_{37}N_5O_3S \times C_2HF_3O_2$ (649.73)

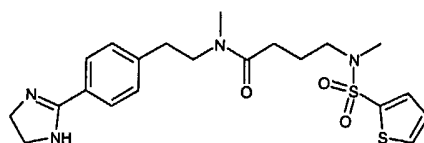
Ausbeute: 36% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.00 min.

Beispiel 153

20

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(thiophen-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat



25

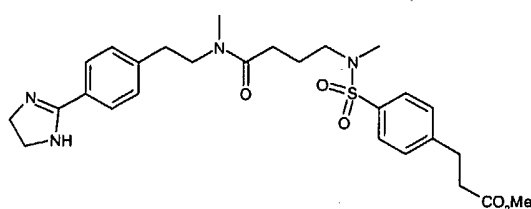
$C_{21}H_{28}N_4O_3S_2 \times C_2HF_3O_2$ (562.63)

Ausbeute: 39% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.01 min

Beispiel 154

- 5 3-(4-[[3-({2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-methylcarbamoyl]-propyl]-methylsulfamoyl]-phenyl)-propionsäuremethylester Trifluoracetat
-



- 10 $C_{27}H_{36}N_4O_5S \times C_2HF_3O_2$ (642.69)

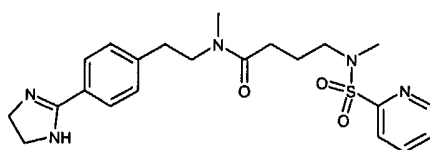
Ausbeute: 22% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.16 min

Beispiel 155

15

- N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(pyridin-2-sulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat
-



20

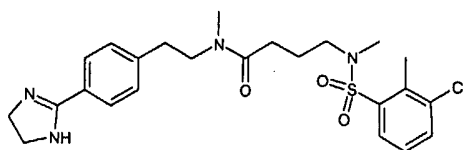
- $C_{22}H_{29}N_5O_3S \times C_2HF_3O_2$ (557.59)

Ausbeute: 11% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 2.81 min

25 Beispiel 156

- 4-[(3-Chlor-2-methylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat
-



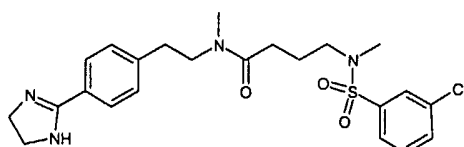
$C_{24}H_{31}ClN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (605.07)

5 Ausbeute: 26% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.32 min

Beispiel 157

- 10 4-[(3-Chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat
-



15 $C_{23}H_{29}ClN_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (591.05)

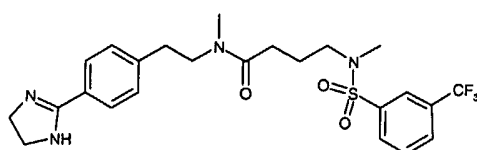
Ausbeute: 28% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.23 min

Beispiel 158

20

N-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(3-trifluoromethylbenzoylsulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat



25

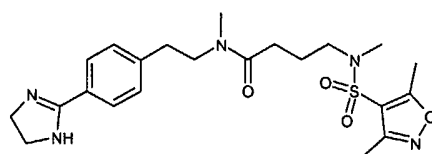
$C_{24}H_{29}F_3N_4O_3S \times C_2HF_3O_2$ (624.60)

Ausbeute: 30% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 3.32 min

Beispiel 159

- 5 *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(3,5-dimethylisoxazol-4-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid Trifluoracetat
-



- 10 $C_{22}H_{31}N_5O_4S \times C_2HF_3O_2$ (575.60)

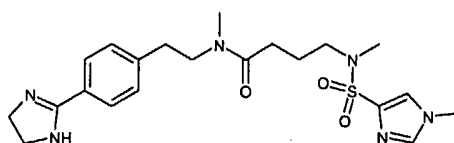
Ausbeute: 17% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 2.99 min

Beispiel 160

15

- N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(1-methyl-1*H*-imidazol-4-sulfonyl)-amino]-butyramid Trifluoracetat
-



20

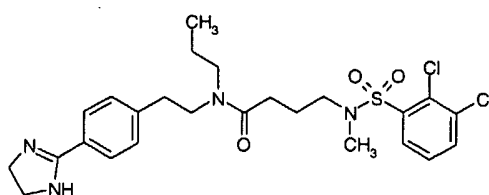
- $C_{21}H_{30}N_6O_3S \times C_2HF_3O_2$ (560.59)

Ausbeute: 29% der Theorie

Retentionszeit (HPLC): 2.62 min

25 Beispiel 161

- 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-propylbutyramid
-



Hergestellt analog Beispiel 13b aus *N*-[2-(4-Cyanphenyl)-ethyl]-4-[(2,3-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-propylbutyramid.

5 $C_{25}H_{32}Cl_2N_4O_3S$ (539.52)

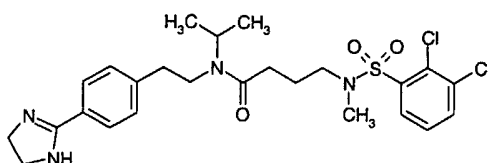
Ausbeute: 48% der Theorie

$[M+H]^+ = 539/541/543$

Beispiel 162

10

4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-isopropylbutyramid



15

Hergestellt analog Beispiel 13b aus *N*-[2-(4-Cyanphenyl)-ethyl]-4-[(2,3-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-isopropylbutyramid.

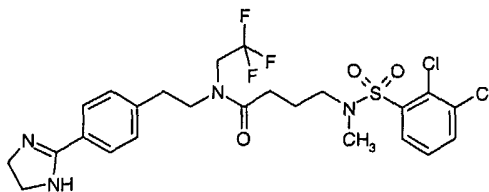
$C_{25}H_{32}Cl_2N_4O_3S$ (539.52)

Ausbeute: 28% der Theorie

20 $[M+H]^+ = 539/541/543$

Beispiel 163

25 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-(2,2,2-trifluorethyl)-butyramid



Hergestellt analog Beispiel 13b aus *N*-[2-(4-Cyanphenyl)-ethyl]-4-[(2,3-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-(2,2,2-trifluorethyl)-butyramid.

5 $C_{24}H_{27}Cl_2F_3N_4O_3S$ (579.46)

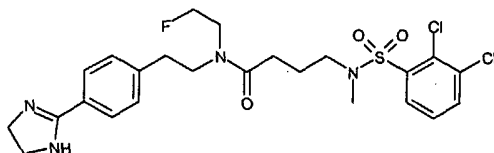
Ausbeute: 53% der Theorie

$[M+H]^+ = 579/581/583$

Analog den voran genannten Beispielen können auch die folgenden Verbindungen
10 hergestellt werden:

Beispiel 164

4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-
15 phenyl]-ethyl}-*N*-(2-fluorethyl)-butyramid



Hergestellt analog Beispiel 13b) aus *N*-[2-(4-Cyanphenyl)-ethyl]-4-[(2,3-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-(2-fluorethyl)-butyramid.

20

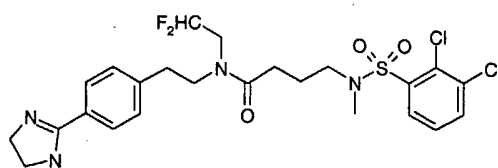
$C_{24}H_{25}Cl_2FN_4O_3S$ (543.48)

$[M+H]^+ = 543/545/547$

Beispiel 165

25

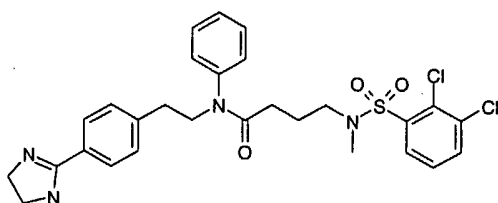
4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-(2,2-difluorethyl)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-butyramid



Beispiel 166

5

4-[(2,3-Dichlorobenzolsulfonyl)-methylamino]-N-[2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl]-N-phenylbutyramid



10

Hergestellt analog Beispiel 13b) aus N-[2-(4-Cyanphenyl)-ethyl]-4-[(2,3-dichlorobenzolsulfonyl)-methylamino]-N-phenylbutyramid.

$C_{28}H_{30}Cl_2N_4O_3S$ (573.53)

$[M+H]^+ = 573/575/577$

15

Die nachfolgenden Beispiele beschreiben pharmazeutischer Darreichungsformen, die als Wirkstoff eine beliebige Verbindung der allgemeinen Formel I enthalten:

Beispiel I

20

Trockenampulle mit 75 mg Wirkstoff pro 10 ml

Zusammensetzung:

25	Wirkstoff	75,0 mg
	Mannitol	50,0 mg
	Wasser für Injektionszwecke	ad 10,0 ml

Herstellung:

Wirkstoff und Mannitol werden in Wasser gelöst. Nach Abfüllung wird gefriergetrocknet. Die Auflösung zur gebrauchsfertigen Lösung erfolgt mit Wasser für Injektionszwecke.

5

Beispiel II

Tablette mit 50 mg Wirkstoff

10 Zusammensetzung:

	(1) Wirkstoff	50,0 mg
	(2) Milchzucker	98,0 mg
	(3) Maisstärke	50,0 mg
15	(4) Polyvinylpyrrolidon	15,0 mg
	(5) Magnesiumstearat	<u>2,0 mg</u>
		215,0 mg

Herstellung:

20

(1), (2) und (3) werden gemischt und mit einer wäßrigen Lösung von (4) granuliert. Dem getrockneten Granulat wird (5) zugemischt. Aus dieser Mischung werden Tabletten gepreßt, biplan mit beidseitiger Facette und einseitiger Teilerbe. Durchmesser der Tabletten: 9 mm.

25

Beispiel III

Tablette mit 350 mg Wirkstoff

30 Zusammensetzung:

	(1) Wirkstoff	350,0 mg
	(2) Milchzucker	136,0 mg
	(3) Maisstärke	80,0 mg

(4) Polyvinylpyrrolidon	30,0 mg
(5) Magnesiumstearat	<u>4,0 mg</u>
	600,0 mg

5 Herstellung:

(1), (2) und (3) werden gemischt und mit einer wäßrigen Lösung von (4) granuliert. Dem getrockneten Granulat wird (5) zugemischt. Aus dieser Mischung werden Tabletten gepreßt, biplan mit beidseitiger Facette und einseitiger Teilerbe. Durchmesser der Tabletten: 12 mm.

10

Beispiel IVKapseln mit 50 mg Wirkstoff

15 Zusammensetzung:

(1) Wirkstoff	50,0 mg
(2) Maisstärke getrocknet	58,0 mg
(3) Milchzucker pulverisiert	50,0 mg
20 (4) Magnesiumstearat	<u>2,0 mg</u>
	160,0 mg

Herstellung:

25 (1) wird mit (3) verrieben. Diese Verreibung wird der Mischung aus (2) und (4) unter intensiver Mischung zugegeben.

Diese Pulvermischung wird auf einer Kapselabfüllmaschine in Hartgelatine-Steckkapseln Größe 3 abgefüllt.

30

Beispiel VKapseln mit 350 mg Wirkstoff

Zusammensetzung:

	(1) Wirkstoff	350,0 mg
	(2) Maisstärke getrocknet	46,0 mg
5	(3) Milchezucker pulverisiert	30,0 mg
	(4) Magnesiumstearat	<u>4,0 mg</u>
		430,0 mg

Herstellung:

10

(1) wird mit (3) verrieben. Diese Verreibung wird der Mischung aus (2) und (4) unter intensiver Mischung zugegeben.

Diese Pulvermischung wird auf einer Kapselabfüllmaschine in Hartgelatine-Steck-
15 kapseln Gr6Be 0 abgefüllt.

Beispiel VISuppositorien mit 100 mg Wirkstoff

20

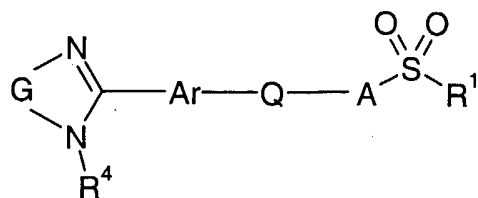
1 Zäpfchen enthält:

	Wirkstoff	100,0 mg
	Polyethylenglykol (M.G. 1500)	600,0 mg
	Polyethylenglykol (M.G. 6000)	460,0 mg
25	Polyethylensorbitanmonostearat	<u>840,0 mg</u>
		2 000,0 mg

30

Patentansprüche

1. Verbindungen der allgemeinen Formel



5

, (I)

in denen

10 R^1 eine Phenyl-, Naphthyl- oder Heteroarylgruppe, eine Phenyl- C_{1-3} -alkyl- oder C_{3-7} -Cycloalkylgruppe,

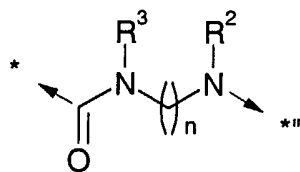
R^4 ein Wasserstoffatom oder eine C_{1-6} -Alkylgruppe,

15 G die Gruppe $-(CH_2)_m-$, in der m die Zahl 2 oder 3 bedeutet und in der ein bis drei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch C_{1-3} -Alkylgruppen ersetzt sein können,

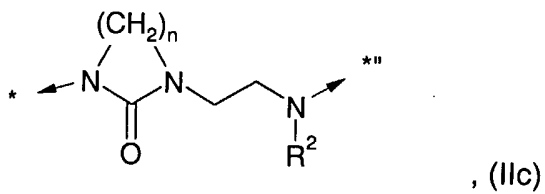
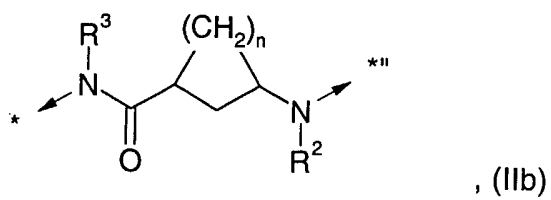
Ar eine Phenylen- oder Heteroarylengruppe,

20 Q die Gruppe $-(CH_2)_p-$, in der p die Zahl 2 oder 3 bedeutet und in der ein bis drei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch C_{1-3} -Alkylgruppen ersetzt sein können,

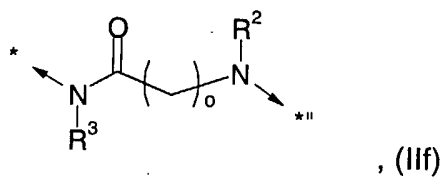
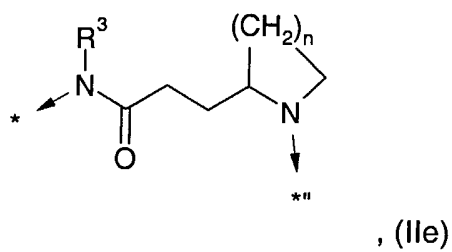
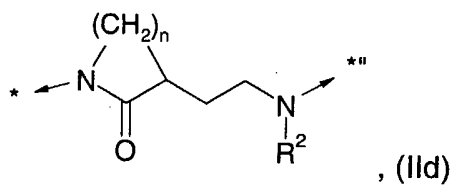
25 A einen über ein Stickstoffatom mit der Sulfonylgruppe in Formel (I) verknüpften Rest der allgemeinen Formel (IIa) bis (III)



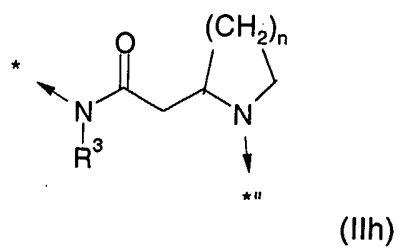
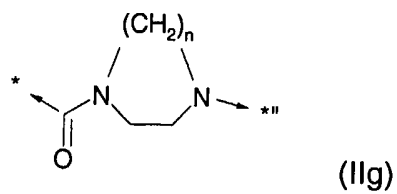
, (IIa)

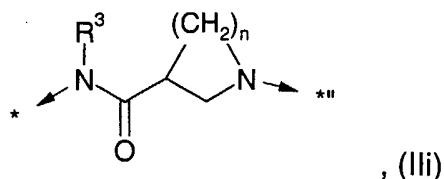


5



10





wobei die Verknüpfung der Reste (Iia) bis (Iii) mit der Sulfonylgruppe in Formel (I)
5 bevorzugt über die mit "*" gekennzeichnete Position erfolgt,

n die Zahl 2 oder 3,

o die Zahl 1, 2 oder 3,

10 R^2 ein Wasserstoffatom, eine C_{1-6} -Alkyl-, C_{2-5} -Alkenyl-methyl-, C_{2-5} -Alkinyllmethyl-, C_{3-7} -Cycloalkyl- oder eine Phenylgruppe und

15 R^3 ein Wasserstoffatom, eine Phenyl-, C_{1-6} -Alkyl-, C_{2-5} -Alkenyl-methyl-, C_{2-5} -Alkinyllmethyl- oder C_{3-7} -Cycloalkylgruppe oder eine Gruppe $-CH_2-CF_3$, $-CH_2-CHF_2$ oder $-CH_2-CH_2F$ sein kann,

bedeuten, wobei die in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen
Phenyl- und Phenylengruppen durch Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome, durch
20 C_{1-5} -Alkyl-, Trifluormethyl-, Amino-, C_{1-3} -Alkylamino-, Di-(C_{1-3} -alkyl)-amino-, Di-
(C_{1-3} -alkyl)-amino-carbonylamino-, Nitro-, Cyano-, C_{1-3} -Alkylcarbonyl-,
 C_{1-3} -Alkylsulfonyl-, Aminocarbonyl-, C_{1-3} -Alkylaminocarbonyl-, Di-(C_{1-3} -alkyl)-
aminocarbonyl-, Aminosulfonyl-, C_{1-3} -Alkylaminosulfonyl-, Di-(C_{1-3} -alkyl)-
aminosulfonyl-, C_{1-3} -Alkylcarbonylamino-, Carboxy- C_{1-3} -alkyl-, C_{1-3} -Alkyloxycarbonyl-
25 C_{1-3} -alkyl-, Phenyl-, Phenyloxy-, Hydroxy-, C_{1-4} -Alkyloxy-, Monofluormethoxy-,
Difluormethoxy- oder Trifluormethoxygruppen oder durch *N*-Pyrrolidinocarbonyl-,
N-Pyrrolidinosulfonyl-, *N*-Piperidinocarbonyl- oder *N*-Piperidinosulfonyl-, wobei die in
den voranstehend genannten Piperidinringen enthaltene Methylengruppe in 4-
Position durch O, S, SO, SO₂, NH oder N(C_{1-3} -Alkyl) ersetzt sein kann, mono-, di-, tri-
30 oder tetrasubstituiert sein können und die Substituenten gleich oder verschieden sein
können, jedoch die Substitution durch zwei, drei oder vier Nitrogruppen

ausgeschlossen ist,

wobei die in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen Naphthylgruppen durch Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome, durch C₁₋₃-Alkyl-, Amino- oder Di-
5 (C₁₋₃-alkyl)-aminogruppen mono- oder disubstituiert sein können und die Substituenten gleich oder verschieden sein können,

wobei, soweit nichts anderes erwähnt wurde, eine voranstehend erwähnte Heteroarylgruppe

10

eine über ein Kohlenstoff- oder Stickstoffatom gebundene monocyclische 5-gliedrige Heteroarylgruppe, die

15

eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl-, Phenyl- oder Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe substituierte Iminogruppe, ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder

20

eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl-, Phenyl-, Amino-C₂₋₃-alkyl-, C₁₋₃-Alkylamino-C₂₋₃-alkyl- oder Di-(C₁₋₃-alkyl)-amino-C₂₋₃-alkylgruppe, durch eine 4- bis 7-gliedrige Cycloalkylenimino-C₁₋₃-alkyl- oder Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe
substituierte Iminogruppe oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom und zusätzlich ein Stickstoffatom oder

25

eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl- oder Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe substituierte Iminogruppe und zwei oder drei Stickstoffatome enthält,

oder eine monocyclische 6-gliedrige Heteroarylgruppe, die ein, zwei oder drei Stickstoffatome enthält,

30

oder eine bicyclische 9-gliedrige Heteroarylgruppe, bestehend aus einer der vorstehend erwähnten 5-gliedrigen Heteroarylgruppen, die mit einem der vorstehend erwähnten 6-gliedrigen Heteroarylgruppen über zwei benachbarte Kohlenstoffatome oder ein Kohlenstoff- und ein benachbartes Stickstoffatom zu einem Bicyclus kondensiert ist, wobei die 5-gliedrige Heteroarylgruppe auch durch eine

Cyclopentadienylgruppe oder die 6-gliedrige Heteroarylgruppe auch durch einen Phenylring ersetzt sein kann,

oder eine bicyclische 10-gliedrige Heteroarylgruppe, bestehend aus einem Phenylring und einem der vorstehend erwähnten 6-gliedrigen Heteroarylgruppen
5 oder aus zwei der vorstehend erwähnten 6-gliedrigen Heteroarylgruppen, die jeweils über zwei benachbarte Kohlenstoffatome zu einem Bicyclus kondensiert sind,

wobei die voranstehend erwähnten mono- und bicyclischen Heteroarylgruppen
10 zusätzlich im Kohlenstoffgerüst durch Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome oder durch C₁₋₃-Alkylgruppen mono-, di- oder trisubstituiert und die Substituenten gleich oder verschieden sein können,

bedeutet und unter dem voranstehend in den Definitionen erwähnten Ausdruck
15 "Heteroarylggruppe" die vorstehend erwähnten mono- oder bicyclischen Heteroarylgruppen, die jedoch über zwei Kohlenstoffatome oder ein Kohlenstoff- und ein Stickstoffatom mit den benachbarten Gruppen verknüpft sind, zu verstehen ist,

wobei die in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen Alkyl- und
20 Alkoxygruppen, die mehr als zwei Kohlenstoffatome aufweisen, soweit nichts anderes erwähnt wurde, geradkettig oder verzweigt sein können, und

wobei die Wasserstoffatome der in den voranstehend erwähnten Definitionen
25 enthaltenen Methyl- oder Ethylgruppen ganz oder teilweise durch Fluoratome ersetzt sein können,

deren Tautomere, deren Enantiomere, deren Diastereomere, deren Gemische und deren Salze.

30 2. Verbindungen der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1, in denen

R¹ eine Phenyl-, Naphthyl-, oder Heteroarylgruppe, eine Phenyl-C₁₋₃-alkyl- oder C₃₋₆-Cycloalkylgruppe,

R⁴ ein Wasserstoffatom oder eine C₁₋₄-Alkylgruppe,

G die Gruppe -(CH₂)_m-, in der m die Zahl 2 oder 3 bedeutet und in der ein bis drei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch C₁₋₃-Alkylgruppen ersetzt sein
5 können,

Ar eine Phenylengruppe oder

eine über ein Kohlenstoff- oder Stickstoffatom gebundene monocyclische 5-gliedrige
10 Heteroarylengruppe oder eine monocyclische 6-gliedrige Heteroarylengruppe,

Q die Gruppe -(CH₂)_p-, in der p die Zahl 2 oder 3 bedeutet und in der ein bis drei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch C₁₋₃-Alkylgruppen ersetzt sein
15 können,

15

A einen über ein Stickstoffatom mit der Sulfonylgruppe in Formel (I) verknüpften Rest der allgemeinen Formel (IIa), (IIb), (IIc), (IId), (IIe), (IIf), (IIg), (IIh) oder (Iii),

20

wobei die Verknüpfung der Reste (IIa) bis (Iii) mit der Sulfonylgruppe in Formel (I) bevorzugt über die mit "*" gekennzeichnete Position erfolgt und

n die Zahl 2 oder 3,

o die Zahl 1, 2 oder 3,

25

R² ein Wasserstoffatom, eine C₁₋₄-Alkyl-, C₂₋₅-Alkenyl-methyl-, C₃₋₆-Cycloalkyl- oder eine Phenylgruppe und

30

R³ ein Wasserstoffatom, eine C₁₋₄-Alkyl-, C₂₋₅-Alkenyl-methyl- oder C₃₋₆-Cycloalkylgruppe oder eine C₁₋₃-Alkylgruppe, in der jede Methylgruppe mit bis zu drei und jede Methylengruppe mit bis zu zwei Fluoratomen substituiert sein kann, darstellen,

bedeuten, wobei die in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen

Phenyl- und Phenylengruppen durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome, durch C₁₋₅-Alkyl-, Trifluormethyl-, Amino-, C₁₋₃-Alkylamino-, Di-(C₁₋₃-alkyl)-amino-, Di-(C₁₋₃-alkyl)-amino-carbonylamino-, Nitro-, Cyano-, C₁₋₃-Alkylcarbonyl-, C₁₋₃-Alkylsulfonyl-, Aminocarbonyl-, C₁₋₃-Alkylaminocarbonyl-, Di-(C₁₋₃-alkyl)-aminocarbonyl-, Aminosulfonyl-, C₁₋₃-Alkylaminosulfonyl-, Di-(C₁₋₃-alkyl)-aminosulfonyl-, C₁₋₃-Alkylcarbonylamino-, Phenyl-, Phenyloxy-, Hydroxy-, C₁₋₄-Alkyloxy-, Monofluormethyloxy-, Difluormethyloxy- oder Trifluormethyloxygruppen oder durch *N*-Pyrrolidinocarbonyl-, *N*-Pyrrolidinosulfonyl-, *N*-Piperidinocarbonyl- oder *N*-Piperidinosulfonyl-, wobei die in den voranstehend genannten Piperidinringen enthaltene Methylengruppe in 4-Position durch O, S, SO, SO₂, NH oder N(C₁₋₃-Alkyl) ersetzt sein kann, mono-, di-, tri- oder tetrasubstituiert sein können und die Substituenten gleich oder verschieden sein können, jedoch die Substitution durch zwei, drei oder vier Nitrogruppen ausgeschlossen ist,

wobei die in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen Naphthylgruppen durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome, durch C₁₋₃-Alkyl-, Amino- oder Di-(C₁₋₃-alkyl)-aminogruppen mono- oder disubstituiert sein können und die Substituenten gleich oder verschieden sein können,

wobei, soweit nichts anderes erwähnt wurde, eine voranstehend erwähnte Heteroarylgruppe

eine über ein Kohlenstoff- oder Stickstoffatom gebundene monocyclische 5-gliedrige Heteroarylgruppe, die

eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl-, Phenyl- oder Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe substituierte Iminogruppe, ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder

eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl- oder Phenylgruppe, durch eine 5- bis 7-gliedrige Cycloalkylenimino-C₁₋₃-alkyl- oder eine Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe substituierte Iminogruppe oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom und zusätzlich ein Stickstoffatom oder

eine gegebenenfalls durch eine C₁₋₃-Alkyl- oder Phenyl-C₁₋₃-alkylgruppe substituierte Iminogruppe und zusätzlich zwei Stickstoffatome enthält, oder

5 eine monocyclische 6-gliedrige Heteroarylgruppe, die ein oder zwei Stickstoffatome enthält, oder

eine bicyclische 9-gliedrige Heteroarylgruppe, bestehend aus einer der vorstehend erwähnten 5-gliedrigen Heteroarylgruppen, die mit einem der vorstehend erwähnten 6-gliedrigen Heteroarylgruppen über zwei benachbarte Kohlenstoffatome oder ein
10 Kohlenstoff- und ein benachbartes Stickstoffatom zu einem Bicyclus kondensiert ist, wobei die 5-gliedrige Heteroarylgruppe auch durch eine Cyclopentadienylgruppe oder die 6-gliedrige Heteroarylgruppe auch durch einen Phenylring ersetzt sein kann, oder

15 eine bicyclische 10-gliedrige Heteroarylgruppe, bestehend aus einem Phenylring und einem der vorstehend erwähnten 6-gliedrigen Heteroarylgruppen oder aus zwei der vorstehend erwähnten 6-gliedrigen Heteroarylgruppen, die jeweils über zwei benachbarte Kohlenstoffatome zu einem Bicyclus kondensiert sind,

20 wobei die voranstehend erwähnten mono- und bicyclischen Heteroarylgruppen zusätzlich im Kohlenstoffgerüst durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome oder durch C₁₋₃-Alkylgruppen mono-, di- oder trisubstituiert und die Substituenten gleich oder verschieden sein können,

25 bedeutet und unter dem voranstehend in den Definitionen erwähnten Ausdruck "Heteroarylggruppe" die vorstehend erwähnten mono- oder bicyclischen Heteroarylgruppen, die jedoch über zwei Kohlenstoffatome oder ein Kohlenstoff- und ein Stickstoffatom mit den benachbarten Gruppen verknüpft sind, zu verstehen ist,

30 wobei die in den voranstehend erwähnten Definitionen enthaltenen Alkyl- und Alkoxygruppen, die mehr als zwei Kohlenstoffatome aufweisen, soweit nichts anderes erwähnt wurde, geradkettig oder verzweigt sein können, und

wobei die Wasserstoffatome der in den voranstehend erwähnten Definitionen

enthaltenen Methyl- oder Ethylgruppen ganz oder teilweise durch Fluoratome ersetzt sein können,

deren Tautomere, deren Enantiomere, deren Gemische und deren Salze.

5

3. Verbindungen der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1, in denen

R¹ eine gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome, Nitro-, Cyano-, C₁₋₃-Alkylsulfonyl-, C₁₋₅-Alkyl-, Trifluormethyl-, Hydroxy-, C₁₋₅-Alkyloxy-,
10 Trifluormethoxy-, Phenyloxy-, Morpholin-4-ylsulfonyl-, Phenyl-, Dimethylaminocarbonylamino-, Amino-, Methylcarbonylamino-, Dimethylamino-, Carboxy-C₁₋₃-alkyl- oder C₁₋₃-Alkyloxycarbonyl-C₁₋₃-alkylgruppen mono-, di- oder trisubstituierte Phenyl- oder Phenylmethylgruppe, wobei die Substituenten gleich oder verschieden sein können und die Mehrfachsubstitution durch zwei oder drei
15 Nitrogruppen ausgeschlossen ist,

eine gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome, Cyano-, C₁₋₃-Alkyl-, Trifluormethyl-, C₁₋₃-Alkyloxy- oder Trifluormethoxygruppen tetrasubstituierte Phenylgruppe, wobei die Substituenten gleich oder verschieden sein können,

20

eine gegebenenfalls durch Chlor- oder Bromatome oder Methyl-, Amino-, Methylamino- oder Dimethylaminogruppen mono-, di- oder trisubstituierte Benzo[b]thiophenyl-, Chinolinyl-, Naphthyl-, Benzo[1,2,5]oxadiazolyl-, Furanyl-, Thiophenyl-, Imidazolyl-, Thiazolyl-, Pyrazolyl-, Pyridinyl- oder Isoxazolylgruppe oder

25

eine C₃₋₆-Cycloalkylgruppe, beispielsweise die Cyclopropylgruppe,

R⁴ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe,

30 G die Gruppe $-(CH_2)_m-$, in der m die Zahl 2 oder 3 bedeutet oder

die Gruppe $-(CH_2)_m-$, in der m die Zahl 2 oder 3 bedeutet und in der ein, zwei oder drei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch Methyl- oder Ethylgruppen ersetzt sind,

Ar eine Phenylengruppe,

Q die Gruppe $-(CH_2)_p-$, in der p die Zahl 2 bedeutet, oder

5

die Gruppe $-(CH_2)_p-$, in der p die Zahl 2 bedeutet und in der ein oder zwei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch Methyl- oder Ethylgruppen ersetzt sind,

10 A einen über die mit "*" gekennzeichnete Position mit der Sulfonylgruppe in Formel (I) verknüpften Rest der allgemeinen Formel (IIa), (IIb), (IIc), (IId), (IIe), (IIf), (IIg), (IIh) oder (IIi),

worin

15

n die Zahl 2 oder 3,

o die Zahl 1, 2 oder 3,

20 R^2 ein Wasserstoffatom, eine C_{1-3} -Alkyl-, Cyclopropyl- oder eine Phenylgruppe und

R^3 ein Wasserstoffatom, eine Cyclopropylgruppe, eine geradkettige oder verzweigte C_{1-3} -Alkylgruppe, eine F_3C-CH_2- , F_2CH-CH_2- oder H_2FC-CH_2- Gruppe
25 darstellen,

bedeuten, deren Tautomere, deren Enantiomere, deren Diastereomere, deren Gemische und deren Salze.

30 4. Verbindungen der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1, in denen

R^1 eine Isopropyl-, Cyclopropyl-, Phenyl-, Phenylmethyl-, 2,4-Dichlorphenylmethyl-, 2-Chlorphenyl-, 3-Chlorphenyl-, 4-Chlorphenyl-, 2-Bromphenyl-, 3-Bromphenyl-, 4-Bromphenyl-, 3-Fluorphenyl-, 4-Fluorphenyl-, 2,3-Dichlorphenyl-, 2,4-

Dichlorphenyl-, 2,5-Dichlorphenyl-, 2,6-Dichlorphenyl-, 3,4-Dichlorphenyl-, 3,5-Dichlorphenyl-, 2,4,5-Trichlorphenyl-, 3,4-Difluorphenyl-, 2-Chlor-4-fluorphenyl-, 2-Chlor-4-cyanphenyl-, 5-Fluor-2-methylphenyl-, 2-Chlor-6-methylphenyl-, 2-Chlor-4-trifluormethylphenyl-, 3-Chlor-2-methylphenyl-, 4-Amino-3,5-dichlorphenyl-,
5 4-Amino-2,5-dichlorphenyl-, 4-Chlor-2,5-dimethylphenyl-, 2,4-Dichlor-5-methylphenyl-, 3,5-Dichlor-4-hydroxyphenyl-, 4-(Morpholin-4-ylsulfonyl)-phenyl-, 4-Chlor-3-nitrophenyl-, 3-Methylsulfonylphenyl-, 4-Methylsulfonylphenyl-, 4-Cyanphenyl-, 2-Nitrophenyl-, 3-Nitrophenyl-, 4-Nitrophenyl-, 4-Nitro-3-fluorphenyl-, 4-Nitro-3-trifluormethylphenyl-, 4-Methoxy-2-nitrophenyl-, 2-Trifluormethoxyphenyl-,
10 2-Methylphenyl-, 3-Methylphenyl-, 4-Methylphenyl-, 2-Trifluormethylphenyl-, 3-Trifluormethylphenyl-, 4-Trifluormethylphenyl-, 4-Propylphenyl-, 4-Isopropylphenyl-, 4-*tert.*-Butylphenyl-, 4-Pentylphenyl-, 4-(3-Methoxycarbonylpropyl)-phenyl-, 2,4,6-Trimethylphenyl-, 2,5-Dimethylphenyl-, 3,5-Dimethylphenyl-, 2,4,6-Trimethylphenyl-, 2,3,5,6-Tetramethylphenyl-, 4-Methoxy-2,3,6-trimethylphenyl-, 4-Butoxyphenyl-,
15 4-Methoxyphenyl-, 4-Trifluormethoxyphenyl-, 2,5-Dimethoxyphenyl-, 3,4-Dimethoxyphenyl-, 4-Chlor-2-methoxyphenyl-, 5-Chlor-2-methoxyphenyl-, 4-Acetylaminophenyl-, 4-Acetyl-amino-3-chlorphenyl-, 4-(3,3-Dimethylureido)-phenyl-, 4-Phenoxyphenyl-, Benzyl-, 2-Chlorbenzyl-, 2,4-Dichlorbenzyl-, Biphen-4-yl-, Benzo[b]thiophen-2-yl-, Benzo[b]thiophen-3-yl-, Chinolin-8-yl-, Isochinolin-1-yl-,
20 Isochinolin-3-yl-, Naphthalin-1-yl-, Naphthalin-2-yl-, 4-Chlornaphthalin-1-yl-, 5-Chlornaphthalin-1-yl-, 5-Dimethylaminonaphthalin-1-yl-, Benzo[1,2,5]oxadiazol-4-yl-, Furan-2-yl-, Furan-3-yl-, Thiophen-2-yl-, Thiophen-3-yl-, 4,5-Dichlorthiophen-2-yl-, 5-Chlorthiophen-2-yl-, 1,2-Dimethyl-1*H*-imidazol-4-yl-, 2-Methyl-1*H*-imidazol-4-yl-,
25 4-Brom-5-chlorthiophen-2-yl-, 3-Brom-5-chlorthiophen-2-yl-, 2,4-Dimethylthiazol-5-yl-, 5-Chlor-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-4-yl-, Pyridin-2-yl-, Pyridin-3-yl-, Pyridin-4-yl-, 3,5-Dimethylisoxazol-4-yl- oder 1-Methyl-1*H*-imidazol-4-ylgruppe,

R⁴ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe,

30 G die Gruppe $-(CH_2)_m-$, in der m die Zahl 2 oder 3 bedeutet oder

die Gruppe $-(CH_2)_m-$, in der m die Zahl 2 oder 3 bedeutet und in der ein oder zwei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch Methylgruppen ersetzt sind,

Ar eine gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome, Cyano-, C₁₋₃-Alkyl-, Trifluormethyl-, C₁₋₃-Alkyloxy- oder Trifluormethoxygruppen unabhängig voneinander mono- oder disubstituierte, vorzugsweise jedoch unsubstituierte Phenylengruppe,

5 Q die Gruppe $-(CH_2)_p-$, in der p die Zahl 2 bedeutet, oder

die Gruppe $-(CH_2)_p-$, in der p die Zahl 2 bedeutet und in der ein oder zwei Wasserstoffatome unabhängig voneinander durch Methylgruppen ersetzt sind,

10 A einen über die mit "*" gekennzeichnete Position mit der Sulfonylgruppe in Formel (I) verknüpften Rest der allgemeinen Formel (IIa), (IIb), (IIc), (IId), (IIe), (IIf), (IIg), (IIh) oder (IIi), vorzugsweise jedoch einen Rest der Formel (IIa), (IIb), (IIc), (IIe), (IIf), (IIg), (IIh) oder (IIi),

15 worin

n die Zahl 2 oder 3,

o die Zahl 1, 2 oder 3,

20

R² ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, Ethyl-, n-Propyl-, i-Propyl-, Cyclopropyl- oder Phenylgruppe und

25 R³ ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, Ethyl-, n-Propyl-, i-Propyl-, 2-Monofluorethyl-, 2,2-Difluorethyl-, 2,2,2-Trifluorethyl- oder Cyclopropylgruppe darstellen,

bedeuten, wobei die vorstehend genannten Phenylgruppen oder die in den vorstehend genannten Resten enthaltene Phenylgruppen, sofern nichts anderes erwähnt wurde, unabhängig voneinander durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome, Cyano-, C₁₋₃-Alkyl-, Trifluormethyl-, C₁₋₃-Alkyloxy- oder Trifluormethoxygruppen mono- oder disubstituiert sein können, vorzugsweise jedoch unsubstituiert sind,

30

deren Tautomere, deren Enantiomere, deren Diastereomere, deren Gemische und

deren Salze.

5. Folgende Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1:

- 5 (1) 3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (2) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 10 (3) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-phenylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (4) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-isopropylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 15 (5) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-cyclopropylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (6) 2-(Benzolsulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylacetamid,
- 20 (7) 3-(Benzolsulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 25 (8) 3-[1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-piperidin-2-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (9) 3-[1-(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-piperidin-2-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 30 (10) 3-(1-Benzolsulfonylpiperidin-2-yl)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

- (11) 3-[1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-pyrrolidin-2(S)-yl]-N-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-N-methylpropionamid,
- 5 (12) 1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-piperidin-3-carbonsäure-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-methyamid,
- (13) N-{3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-propionamid,
- 10 (14) N-{3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-propyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-N-methylpropionamid,
- (15) 3-[4-(4,5-Dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-N-methyl-N-{3-[phenyl-(toluol-4-sulfonyl)-amino]-propyl}-propionamid,
- 15 (16) N-{2-[(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-propionamid,
- (17) 2,3-Dichlor-N-[2-(3-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-2-oxoimidazolidin-1-yl)-ethyl]-N-methylbenzolsulfonamid,
- 20 (18) 2,3-Dichlor-N-[2-(3-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-2-oxotetrahydropyrimidin-1-yl)-ethyl]-N-methylbenzolsulfonamid,
- 25 (19) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-N-methyl-N-{2-[4-(1-methyl-4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-butyramid,
- (20) 3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-cyclohexancarbonsäure-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-methyamid,
- 30 (21) 3-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-cyclopentancarbonsäure-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-methyamid,
- (22) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-N-{2-[4-(4,5-dihydro-1H-imidazol-

2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-ethylbutyramid,

(23) *N*-Cyclopropyl-4-[(2,3-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-butyramid,

5

(24) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-butyramid,

(25) 3-[(2,5-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

10

(26) 3-[(Benzo[b]thiophene-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

(27) 3-[(2-Chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

15

(28) 2-[1-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-pyrrolidin-2-yl]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylacetamid,

20

(29) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(2,4,6-trimethylbenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,

(30) 3-[(2-Chlor-6-methylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

25

(31) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(chinolin-8-sulfonyl)-amino]-propionamid,

(32) 3-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methyl-*N*-{2-[methyl-(2,4,6-trimethyl-benzolsulfonyl)-amino]-ethyl}-propionamid,

30

(33) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(4-trifluormethoxy-benzol-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,

- (34) *N*-{2-[(4-Chlor-2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methylpropionamid,
- 5 (35) 3-[(5-Chlor-2-methoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (36) *N*-{2-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-ethyl}-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-*N*-methylpropionamid,
- 10 (37) 3-(Cyclopropansulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (38) 1-[4-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-[1,4]diazepan-1-yl]-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-propan-1-on,
- 15 (39) 1-[4-(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-piperazin-1-yl]-3-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-propan-1-on,
- (40) 2-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylacetamid,
- 20 (41) 3-[(3,5-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 25 (42) 3-(Benzolsulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (43) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-propylbenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,
- 30 (44) 3-[(4-Chlor-3-nitrobenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

- (45) 3-[(2-Chlor-6-methyl-benzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (46) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(4-isopropylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,
- 5 (47) 3-[(5-Chlornaphthalin-1-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (48) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(toluol-4-sulfonyl)-amino]-propionamid,
- 10 (49) 3-[(2-Brombenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 15 (50) 3-[(2,4-Dichlor-5-methyl-benzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (51) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-{methyl-[4-(morpholin-4-sulfonyl)-benzolsulfonyl]-amino}-propionamid,
- 20 (52) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(3-nitrobenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,
- (53) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(2-trifluormethoxybenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,
- 25 (54) 3-[(Benzo[1,2,5]oxadiazole-4-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 30 (55) 3-[(2-Chlor-4-trifluormethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (56) 3-[(4-Butoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-

yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylpropionamid,

(57) 3-[(3,4-Difluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

5

(58) 3-[(3,5-Dichlor-4-hydroxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

(59) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(naphthalin-1-sulfonyl)-amino]-propionamid,

10

(60) 3-[(2,4-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

15

(61) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-pentylbenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,

(62) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(3,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,

20

(63) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-(methylphenylmethansulfonylamino)-propionamid,

(64) 3-[(2-Chlor-4-fluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

25

(65) 3-[(2-Chlor-4-cyanbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

30

(66) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(3-methansulfonylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,

(67) 3-[(Biphenyl-4-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,

- (68) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(5-fluor-2-methylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,
- 5 (69) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-nitrobenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,
- (70) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[[4-(3,3-dimethylureido)-benzolsulfonyl]-methylamino]-*N*-methylpropionamid,
- 10 (71) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,
- (72) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(furan-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,
- 15 (73) 3-[(2-Chlorphenylmethansulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (74) 3-[(2,6-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 20 (75) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(4-methoxy-2-nitrobenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,
- 25 (76) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(thiophen-3-sulfonyl)-amino]-propionamid,
- (77) 3-[(Benzo[b]thiophen-3-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- 30 (78) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(5-dimethylaminonaphthalin-1-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,

- (79) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(toluol-2-sulfonyl)-amino]-propionamid,
- (80) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-phenoxy-benzolsulfonyl)-amino]-propionamid,
- (81) 3-[(2,4-Dichlorphenylmethansulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylpropionamid,
- (82) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-3-[(4-methoxy-2,3,6-trimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylpropionamid,
- (83) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-3-[methyl-(4-nitro-3-trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-propionamid,
- (84) 4-[(5-Chlorthiophen-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (85) 4-[(2-Chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (86) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(2,5-dimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- (87) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(1,2-dimethyl-1*H*-imidazol-4-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- (88) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(4-methansulfonyl-benzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- (89) 4-[(3-Brombenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (90) 4-[(4-Brom-5-chlorthiophen-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-

imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

(91) 4-[(3-Brom-5-chlorthiophen-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

5

(92) 4-[(4,5-Dichlorthiophen-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

(93) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(2,4-dimethylthiazol-5-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid

10

(94) 4-[(5-Chlor-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-4-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

15 (95) 4-[(4-Amino-3,5-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

(96) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methyl-4-[methyl-(2,4,5-trichlorbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,

20

(97) 4-[(2,5-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

(98) 4-[(3,4-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

25

(99) 4-[(4-Brombenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

30 (100) 4-[(4-Fluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

(101) 4-[(3-Fluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-*N*-methylbutyramid,

- (102) 4-[(4-Chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 5 (103) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(2-trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- (104) 4-[(5-Chlor-2-methoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 10 (105) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(toluol-3-sulfonyl)-amino]-butyramid,
- (106) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(4-methoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- 15 (107) 4-[(4-Acetylamino-3-chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 20 (108) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(2,5-dimethoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- (109) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(3,4-dimethoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- 25 (110) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(2,4,6-trimethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- (111) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-
- 30 (naphthalin-2-sulfonyl)-amino]-butyramid,
- (112) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(2,3,5,6-tetramethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,

- (113) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(2-nitromethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- 5 (114) 4-[(4-Cyanbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (115) 4-[(4-Amino-2,5-dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 10 (116) 4-[(4-*tert.*-Butylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (117) 4-[(4-Butoxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 15 (118) 4-[(2,4-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (119) 4-[(2-Chlor-4-fluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 20 (120) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(5-fluor-2-methylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- (121) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(4-methoxy-2-nitrobenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- 25 (122) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(toluol-2-sulfonyl)-amino]-butyramid,
- 30 (123) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(4-methoxy-2,3,6-trimethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- (124) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-

propylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,

(125) 4-[(2,4-Dichlor-5-methylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,

5

(126) 4-[(3,4-Difluorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,

(127) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-pentylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,

10

(128) 4-[(2-Chlor-4-cyanbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,

15

(129) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-nitromethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,

(130) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(furan-2-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,

20

(131) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(furan-3-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,

(132) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(thiophen-3-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,

25

(133) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-phenoxybenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,

30

(134) 4-[(5-Chlornaphthalene-1-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,

(135) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-{methyl-[4-(morpholin-4-sulfonyl)-benzolsulfonyl]-amino}-butyramid,

- (136) 4-[(2-Chlor-4-trifluormethylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 5 (137) 4-[(3,5-Dichlor-4-hydroxybenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (138) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(3,5-dimethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- 10 (139) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(3-methansulfonyl-benzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- (140) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[[4-(3,3-dimethyl-15 harnstoff)-benzolsulfonyl]-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- (141) 4-[(Benzo[b]thiophen-3-sulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 20 (142) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-nitro-3-trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- (143) 4-[(4-Chlor-3-nitrobenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 25 (144) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(toluol-4-sulfonyl)-amino]-butyramid,
- (145) 4-[(4-Acetylamino-benzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 30 (146) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(3-nitromethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,

- (147) 4-(Benzolsulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (148) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-
5 (naphthalin-1-sulfonyl)-amino]-butyramid,
- (149) 4-(Biphenyl-4-sulfonylmethylamino)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- 10 (150) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(4-trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,
- (151) 4-[(2,6-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
15
- (152) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(5-dimethylamino naphthalin-1-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- (153) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(thiophen-2-sulfonyl)-
20 methylamino]-*N*-methylbutyramid,
- (154) 3-(4-[[3-({2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl)-methylcarbamoyl]-propyl]-methylsulfamoyl]-phenyl)-propionsäuremethylester,
- 25 (155) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(pyridin-2-sulfonyl)-amino]-butyramid,
- (156) 4-[(3-Chlor-2-methylbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
30
- (157) 4-[(3-Chlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methylbutyramid,
- (158) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(3-

trifluormethylbenzolsulfonyl)-amino]-butyramid,

(159) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-4-[(3,5-dimethylisoxazol-4-sulfonyl)-methylamino]-*N*-methylbutyramid,

5

(160) *N*-{2-[4-(4,5-Dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-methyl-4-[methyl-(1-methyl-1*H*-imidazol-4-sulfonyl)-amino]-butyramid,

(161) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-propylbutyramid,

10

(162) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-isopropylbutyramid,

(163) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-(2,2,2-trifluorethyl)-butyramid,

15

(164) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-(2-fluorethyl)-butyramid,

20

(165) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-(2,2-difluorethyl)-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-butyramid,

(166) 4-[(2,3-Dichlorbenzolsulfonyl)-methylamino]-*N*-{2-[4-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-phenyl]-ethyl}-*N*-phenylbutyramid,

25

deren Tautomere, deren Enantiomere, deren Gemische und deren Salze.

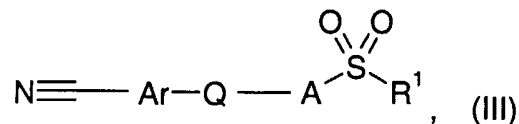
6. Physiologisch verträgliche Salze der Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 5 mit anorganischen oder organischen Säuren oder Basen.

30

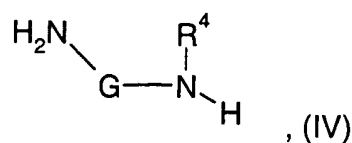
7. Arzneimittel, enthaltend eine Verbindung nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 5 oder ein physiologisch verträgliches Salz gemäß Anspruch 6 neben gegebenenfalls einem oder mehreren inerten Trägerstoffen und/oder

Verdünnungsmitteln.

8. Verwendung einer Verbindung nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 5 zur Herstellung eines Arzneimittels zur akuten und prophylaktischen Behandlung von Schmerzen, insbesondere chronischen Schmerzen, neuropathischen Schmerzen, post-operativen Schmerzen, inflammatorischen Schmerzen, perioperativen Schmerzen, Migräne, Arthralgie, Neuropathien, Nervenverletzungen, diabetischer Neuropathie, Neurodegeneration, neurotischen Hautkrankheiten, Schlaganfall, Harnblasen-Übersensitivität, Reizdarm, Atemwegserkrankungen wie Asthma oder chronischer obstruktiver Lungenerkrankung, Irritationen der Haut, Augen oder Schleimhäute, Zwölffingerdarm- und Magengeschwüren, Magenentzündung oder anderen Entzündungserkrankungen, Schmerzen hervorgerufen durch Osteoarthritis oder Rückenschmerzen.
9. Verfahren zur Herstellung eines Arzneimittels gemäß Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass auf nichtchemischem Weg eine Verbindung nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 6 in einen oder mehrere inerte Trägerstoffe und/oder Verdünnungsmittel eingearbeitet wird.
10. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel I gemäß den Ansprüchen 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, daß
- (a) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in der R^1 , R^4 , G, A, Q und Ar wie im Anspruch 1 definiert sind, ein Nitril der allgemeinen Formel



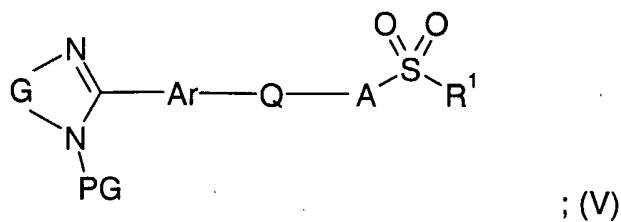
in der R^1 , A, Q und Ar wie im Anspruch 1 definiert sind, mit einem Diamin der allgemeinen Formel



in der G und R⁴ wie im Anspruch 1 definiert sind, umgesetzt wird, oder

- (b) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in der R¹, R⁴, G, A, Q und Ar wie im Anspruch 1 definiert sind, eine Schutzgruppe PG von einer Verbindung der allgemeinen Formel

5



in der R¹, G, A, Q und Ar wie im Anspruch 1 definiert sind und PG eine Amin-Schutzgruppe darstellt, abgespalten wird,

10

und gewünschtenfalls anschließend eine so erhaltene Verbindung der allgemeinen Formel I in ihre Salze, insbesondere für die pharmazeutische Anwendung in ihre physiologisch verträglichen Salze übergeführt wird und/oder

15

gewünschtenfalls eine so erhaltene Verbindung der allgemeinen Formel I in ihre Stereoisomere aufgetrennt wird.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2005/011602

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D233/24 C07D401/12 C07D403/12 C07D233/26 C07D233/36
 C07D409/12 C07D401/10 C07D403/10 C07D413/12 C07D405/12
 C07D417/12 A61K31/4164 A61K31/4178 A61P29/00 A61P11/00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D A61K A61P

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 03/106428 A (LABORATOIRES FOURNIER SA; BARTH, MARTINE; BONDOUX, MICHEL; DODEY, PIER) 24 December 2003 (2003-12-24) claims examples	1-10
Y	WO 2004/054584 A (MERCCK & CO., INC; SU, DAI-SHI; BOCK, MARK, G) 1 July 2004 (2004-07-01) examples 1-4 claims	1-10
	----- -/--	

 Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents

A document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

E earlier document but published on or after the international filing date

L document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance, the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

& document member of the same patent family

Date of the actual completion of the International search

4 April 2006

Date of mailing of the International search report

19/04/2006

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
 Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Kollmannsberger, M

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2005/011602

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	SU, DAI-SHI ET AL: "Discovery of a Potent, Non-peptide Bradykinin B1 Receptor Antagonist" JOURNAL OF THE AMERICAN CHEMICAL SOCIETY , 125(25), 7516-7517 CODEN: JACSAT; ISSN: 0002-7863, 2003, XP002375613 page 7517, paragraph 2 -----	1-10
Y	WO 2004/083173 A (MERCK & CO., INC; BOCK, MARK; DORSEY, BRUCE; SU, DAI-SHI; HAN, WEI; WO) 30 September 2004 (2004-09-30) claims -----	1-10

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2005/011602

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 03106428	A	24-12-2003	AU 2003255668 A1	31-12-2003
			CA 2489209 A1	24-12-2003
			EP 1521744 A1	13-04-2005
			FR 2840897 A1	19-12-2003
			JP 2005535613 T	24-11-2005
WO 2004054584	A	01-07-2004	AU 2003296382 A1	09-07-2004
			CA 2507425 A1	01-07-2004
			EP 1572209 A1	14-09-2005
WO 2004083173	A	30-09-2004	NONE	

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/011602

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
 INV. C07D233/24 C07D401/12 C07D403/12 C07D233/26 C07D233/36
 C07D409/12 C07D401/10 C07D403/10 C07D413/12 C07D405/12
 C07D417/12 A61K31/4164 A61K31/4178 A61P29/00 A61P11/00

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

C07D A61K A61P

Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehorende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr Anspruch Nr.
Y	WO 03/106428 A (LABORATOIRES FOURNIER SA; BARTH, MARTINE; BONDOUX, MICHEL; DODEY, PIER) 24. Dezember 2003 (2003-12-24) Ansprüche Beispiele	1-10
Y	WO 2004/054584 A (MERCK & CO., INC; SU, DAI-SHI; BOCK, MARK, G) 1. Juli 2004 (2004-07-01) Beispiele 1-4 Ansprüche	1-10

 Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

& Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

4. April 2006

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

19/04/2006

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Kollmannsberger, M

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/011602

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	SU, DAI-SHI ET AL: "Discovery of a Potent, Non-peptide Bradykinin B1 Receptor Antagonist" JOURNAL OF THE AMERICAN CHEMICAL SOCIETY , 125(25), 7516-7517 CODEN: JACSAT; ISSN: 0002-7863, 2003, XP002375613 Seite 7517, Absatz 2 -----	1-10
Y	WO 2004/083173 A (MERCK & CO., INC; BOCK, MARK; DORSEY, BRUCE; SU, DAI-SHI; HAN, WEI; WO) 30. September 2004 (2004-09-30) Ansprüche -----	1-10

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/011602

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 03106428 A	24-12-2003	AU 2003255668 A1 CA 2489209 A1 EP 1521744 A1 FR 2840897 A1 JP 2005535613 T	31-12-2003 24-12-2003 13-04-2005 19-12-2003 24-11-2005
WO 2004054584 A	01-07-2004	AU 2003296382 A1 CA 2507425 A1 EP 1572209 A1	09-07-2004 01-07-2004 14-09-2005
WO 2004083173 A	30-09-2004	KEINE	