



(19)
Bundesrepublik Deutschland
Deutsches Patent- und Markenamt

(10) **DE 60 2005 001 553 T2** 2008.03.13

(12) **Übersetzung der europäischen Patentschrift**

(97) **EP 1 720 838 B1**

(51) Int Cl.⁸: **C07D 233/92** (2006.01)

(21) Deutsches Aktenzeichen: **60 2005 001 553.1**

(86) PCT-Aktenzeichen: **PCT/JP2005/002668**

(96) Europäisches Aktenzeichen: **05 710 450.7**

(87) PCT-Veröffentlichungs-Nr.: **WO 2005/077913**

(86) PCT-Anmeldetag: **15.02.2005**

(87) Veröffentlichungstag
der PCT-Anmeldung: **25.08.2005**

(97) Erstveröffentlichung durch das EPA: **15.11.2006**

(97) Veröffentlichungstag
der Patenterteilung beim EPA: **04.07.2007**

(47) Veröffentlichungstag im Patentblatt: **13.03.2008**

(30) Unionspriorität:

2004041381	18.02.2004	JP
2004278999	27.09.2004	JP

(84) Benannte Vertragsstaaten:

AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LI, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR

(73) Patentinhaber:

Otsuka Pharmaceutical Co., Ltd., Tokio/Tokyo, JP

(72) Erfinder:

SHINHAMA, Koichi, Tokushima-shi, Tokushima 7700812, JP

(74) Vertreter:

HOFFMANN & EITLE, 81925 München

(54) Bezeichnung: **VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG EINER 4-NITROIMIDAZOLVERBINDUNG**

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

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

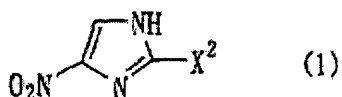
Beschreibung

Technisches Gebiet

[0001] Die vorliegende Erfindung bezieht sich auf ein Verfahren zur Herstellung einer 4-Nitroimidazolverbindung.

Stand der Technik

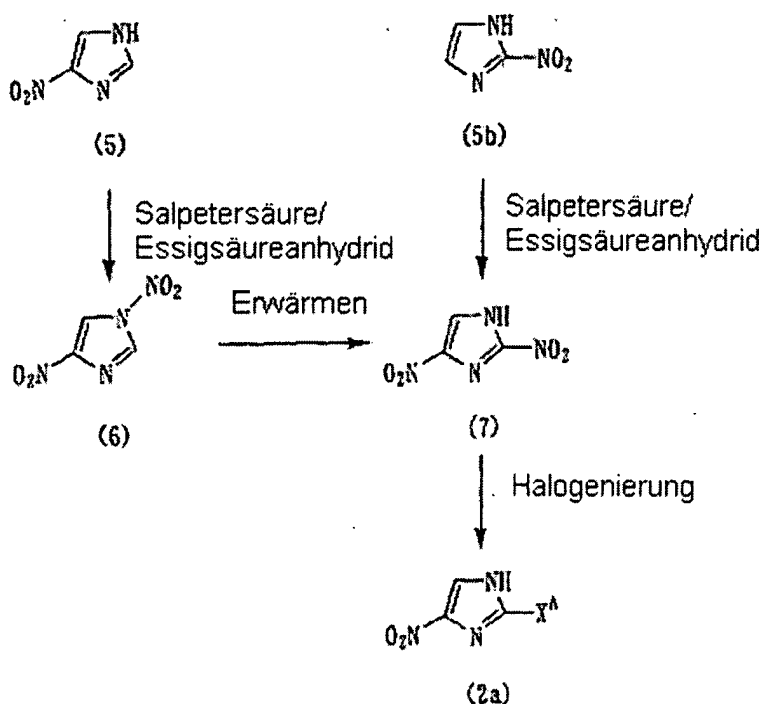
[0002] Eine 4-Nitroimidazolverbindung, die durch die folgende allgemeine Formel (1) dargestellt wird:



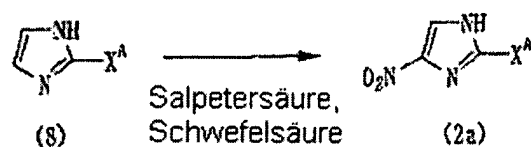
worin X^2 ein Chloratom oder Bromatom darstellt, ist als ein synthetisches Intermediat, das für die Herstellung verschiedener pharmazeutischer und landwirtschaftlicher Chemikalien verwendet wird, geeignet und wird insbesondere zur Herstellung von antituberkulären Mitteln verwendet.

[0003] Beispielsweise sind früher Verfahren, die durch die folgenden Reaktionsschemata-1 und -2 dargestellt werden, als Verfahren zur Herstellung der 4-Nitroimidazolverbindung, die durch die allgemeine Formel (1) dargestellt wird, bekannt gewesen (Jerzy Suwinski, Eva Salwinska, Jan Watras und Maria Widel, Polish Journal of Chemistry, 56, 1261–1272 (1982)).

Reaktionsschema-1



Reaktionsschema-2



worin X^A ein Halogenatom darstellt.

[0004] Allerdings weisen diese Verfahren zahlreiche Nachteile auf und sind somit als Herstellungsverfahren, welche industriell angewendet werden, nicht geeignet.

[0005] Beispielsweise sind in dem Verfahren, das durch das Reaktionsschema-1 dargestellt wird, die Verbindungen (6) und (7), die Reaktionsintermediate darstellen, chemisch nicht stabil, und es liegt ein Risiko vor, dass diese Verbindungen aufgrund eines Aufpralls, wie eines Falls oder eines Bruchs, explodieren können. Zusätzlich übersteigt in diesem Verfahren die Temperatur, die während der Reaktion angelegt wird, um die Verbindung (7) von der Verbindung (6) durch Erwärmen (etwa 130°C) zu erhalten, die TNR (Temperature of No Return; die maximale Temperatur im Bereich von 60°C bis 70°C, bei der die Verbindung in einer chemischen Verarbeitungsvorrichtung sicher gehandhabt werden kann) der Verbindung (6). Somit ist es extrem gefährlich gewesen, die betreffende Verbindung in hohem Volumen über dieses Verfahren industriell herzustellen.

[0006] Das Verfahren, das durch das Reaktionsschema-2 dargestellt wird, schließt eine Nitrierungsreaktion der Verbindung (8) ein. Allerdings kann die Verbindung (1a) nur mit einer geringen Ausbeute durch solch eine Nitrierung erhalten werden und somit ist dieses Verfahren industriell von Nachteil.

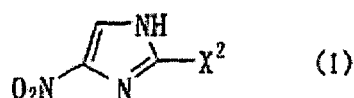
Offenbarung der Erfindung

[0007] Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung liegt darin, ein Verfahren zur Herstellung einer 4-Nitroimidazolverbindung, die durch die allgemeine Formel (1) dargestellt wird, mit einer hohen Ausbeute und mit einer hohen Reinheit durch ein sicheres Verfahren, wobei weniger Gefahren, wie eine Explosion, verursacht werden, bereitzustellen.

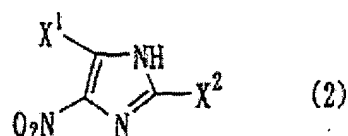
[0008] Um die zuvor genannte Aufgabe zu lösen, haben die vorliegenden Erfinder intensive Studien im Hinblick auf ein Verfahren zur Herstellung einer 4-Nitroimidazolverbindung, die durch die allgemeine Formel (1) dargestellt wird, durchgeführt. Als ein Ergebnis haben die vorliegenden Erfinder festgestellt, dass die zuvor genannte Aufgabe durch selektive Substitution eines Chloratoms oder eines Bromatoms an der Position 5 einer 4-Nitroimidazolverbindung, die durch die allgemeine Formel (2), die unten angegeben ist, dargestellt wird, mit einem Iodatom und anschließend selektive Reduktion der Position 5 der erhaltenen 5-Iod-4-Nitroimidazolverbindung, die durch die allgemeine Formel (3) dargestellt wird, die unten angegeben ist, erreicht werden kann. Das heißt, die vorliegenden Erfinder haben festgestellt, dass eine 4-Nitroimidazolverbindung, die durch die allgemeine Formel (1) dargestellt wird, in einer hohen Ausbeute und mit einer hohen Reinheit durch ein sicheres Verfahren hergestellt werden kann, das geringere Gefahren, wie eine Explosion, verursacht, das die selektive Substitution eines Chloratoms oder Bromatoms an der Position 5 einer 4-Nitroimidazolverbindung, die durch die allgemeine Formel (2) dargestellt wird, die unten angegeben ist, mit einem Iodatom und anschließend selektive Reduktion der Position 5 der erhaltenen 5-Iod-4-Nitroimidazolverbindung, die durch die allgemeine Formel (3) dargestellt wird, die unten angegeben ist, umfasst.

[0009] Die vorliegende Erfindung wurde aufgrund dieser Feststellungen fertiggestellt.

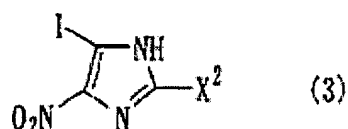
1. Die vorliegende Erfindung stellt ein Verfahren zur Herstellung einer 4-Nitroimidazolverbindung bereit, die durch die allgemeine Formel (1) dargestellt wird:



wobei X² ein Chloratom oder ein Bromatom darstellt, umfassend Iodieren einer durch die allgemeine Formel (2) dargestellten 4-Nitroimidazolverbindung:



wobei jedes von X¹ und X² ein Chloratom oder Bromatom darstellen, und dann Reduzieren der erhaltenen 5-Iod-4-Nitroimidazolverbindung, die durch die allgemeine Formel (3) dargestellt wird:



worin X^2 das Gleiche wie oben definiert ist.

2. Die vorliegende Erfindung stellt in dem oben genannten Herstellungsverfahren ein Verfahren zur Herstellung einer 4-Nitroimidazolverbindung bereit, wobei ein iodierendes Mittel ein Halogenmolekül, Iodwasserstoffsäure oder ein Metallsalz der Iodwasserstoffsäure ist.

3. Die vorliegende Erfindung stellt in dem oben genannten Herstellungsverfahren ein Verfahren zur Herstellung einer 4-Nitroimidazolverbindung bereit, wobei das Metallsalz der Iodwasserstoffsäure Natriumiodid, Kaliumiodid, Lithiumiodid, Zinkiodid, Magnesiumiodid oder Aluminiumiodid ist.

4. Die vorliegende Erfindung stellt in dem oben genannten Herstellungsverfahren ein Verfahren zur Herstellung einer 4-Nitroimidazolverbindung bereit, wobei das iodierende Mittel auf die Verbindung (2) in einem molaren Verhältnis zwischen 1,5:1 und 15:1 angewendet wird und das iodierende Mittel Natriumiodid ist.

5. Die vorliegende Erfindung stellt in dem oben genannten Herstellungsverfahren ein Verfahren zur Herstellung einer 4-Nitroimidazolverbindung bereit, wobei die Reaktion in Gegenwart eines Phasentransferkatalysators durchgeführt wird.

6. Die vorliegende Erfindung stellt in dem oben genannten Herstellungsverfahren ein Verfahren zur Herstellung einer 4-Nitroimidazolverbindung bereit, wobei der Phasentransferkatalysator auf die Verbindung (2) in einem molaren Verhältnis zwischen 0,01:1 und 1:1 angewendet wird und der Phasentransferkatalysator ein quartäres Ammoniumsalz, Phosphoniumsalz oder Pyridiniumsalz ist.

7. Die vorliegende Erfindung stellt in dem oben genannten Herstellungsverfahren ein Verfahren zur Herstellung einer 4-Nitroimidazolverbindung bereit, wobei das Reduktionsmittel ein Hydrierungsreduktionsmittel ist und das Reduktionsmittel auf die Verbindung (3) in einem molaren Verhältnis zwischen 1:1 und 10:1 angewendet wird.

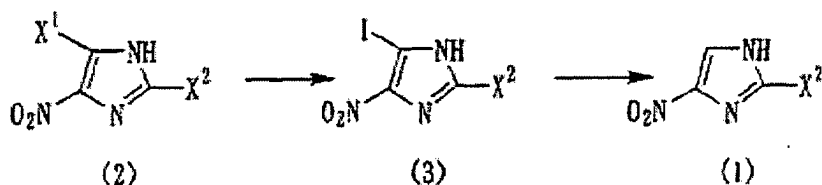
8. Die vorliegende Erfindung stellt in dem oben genannten Herstellungsverfahren ein Verfahren zur Herstellung einer 4-Nitroimidazolverbindung bereit, wobei das Reduktionsmittel ein katalytisches Hydrierungsreduktionsmittel ist und das Reduktionsmittel auf die Verbindung (3) in einem Gewichtsverhältnis zwischen 0,1 Gew.% und 40 Gew.% angewendet wird.

9. Die vorliegende Erfindung stellt in dem oben genannten Herstellungsverfahren ein Verfahren zur Herstellung einer 4-Nitroimidazolverbindung bereit, wobei die Reaktion in Gegenwart von Triethylamin, Trimethylamin oder N-Ethyl-diisopropylamin durchgeführt wird.

Beste Ausführungsform zum Durchführen der Erfindung

[0010] Das Verfahren zur Herstellung einer 4-Nitroimidazolverbindung, die durch die allgemeine Formel (1) der vorliegenden Erfindung dargestellt wird, wird unten beschrieben.

Reaktionsschema-3



worin X^1 und X^2 die gleichen wie oben angegeben sind.

[0011] In dem oben angegebenen Reaktionsschema-3 kann die Reaktion zum Erhalt der Verbindung (3) von der Verbindung (2) in einem geeigneten Lösemittel in Anwesenheit eines Iodierungsmittels durchgeführt werden.

[0012] Als ein Iodierungsmittel können bekannte Iodierungsmittel in einem breiten Bereich verwendet werden. Beispiele von solch einem Iodierungsmittel können ein Halogenatom, wie Iod, Iodwasserstoffsäure und Metallsalze von Iodwasserstoffsäure, wie Natriumiodid, Kaliumiodid, Lithiumiodid, Zinkiodid, Magnesiumiodid oder Aluminiumiodid einschließen. Darunter ist Natriumiodid bevorzugt. Solch ein Iodierungsmittel wird auf die Verbindung (2) angewendet, im Allgemeinen in einer überschüssigen Menge und vorzugsweise in einem molaren Verhältnis zwischen 1,5:1 und 15:1.

[0013] Beispiele eines Lösemittels können einschließen: Wasser; Alkohole, wie Methanol, Ethanol oder Isopropanol; Ketone, wie Aceton; Acetonitril; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan, Dichlorethan, Chloroform oder Tetrachlorkohlenstoff; aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Benzol, Toluol oder Xylol; Ester, wie Methylacetat oder Ethylacetat; Ether, wie Tetrahydrofuran, Dioxan, Diethylether, Dimethoxyethan oder

tert-Butylmethylether; Dimethylformamid; und gemischte Lösemittel davon.

[0014] Bevorzugte Lösemittel sind Wasser und Alkohole.

[0015] Säuren, wie Iodwasserstoffsäure und/oder Katalysatoren, wie ein Phasentransferkatalysator, können zu einem Reaktionssystem, in dem die oben genannte Reaktion durchgeführt wird, zugegeben werden.

[0016] Beispiele eines Phasentransferkatalysators können ein quaternäres Ammoniumsalz, ein Phosphoniumsalz und ein Pyridiniumsalz einschließen.

[0017] Beispiele eines quaternären Ammoniumsalzes können quaternäre Ammoniumsalze einschließen, worin eine Gruppe, die aus der folgenden Gruppe ausgewählt ist, substituiert wird: eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe, die 1 bis 18 Kohlenstoffatome enthält; eine Phenylalkylgruppe, worin der Alkylabschnitt eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe ist, die 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthält; und eine Phenylgruppe. Spezielle Beispiele von solch einem quaternären Ammoniumsalz können Tetrabutylammoniumchlorid, Tetrabutylammoniumbromid, Tetrabutylammoniumfluorid, Tetrabutylammoniumiodid, Tetrabutylammoniumhydroxid, Tetrabutylammoniumbisulfit, Tributylmethylammoniumchlorid, Tributylbenzylammoniumchlorid, Tetrapentylammoniumchlorid, Tetrapentylammoniumbromid, Tetrahexylammoniumchlorid, Benzyltrimethyloctylammoniumchlorid, Methyltrihexylammoniumchlorid, Benzyltrimethyloctadecylammoniumchlorid, Methyltridecylammoniumchlorid, Benzyltripropylammoniumchlorid, Benzyltriethylammoniumchlorid, Phenyltriethylammoniumchlorid, Tetraethylammoniumchlorid und Tetramethylammoniumchlorid einschließen.

[0018] Beispiele eines Phosphoniumsalzes können Phosphoniumsalze einschließen, wobei eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe, die 1 bis 18 Kohlenstoffatome enthält, substituiert ist. Ein spezielles Beispiel von solch einem Phosphoniumsalz kann Tetrabutylphosphoniumchlorid sein.

[0019] Beispiele eines Pyridiniumsalzes können Pyridiniumsalze einschließen, wobei eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe, die 1 bis 18 Kohlenstoffatome enthält, substituiert ist.

[0020] Ein spezielles Beispiel von solch einem Pyridiniumsalz kann 1-Dodecylpyridiniumchlorid sein.

[0021] Der zuvor erwähnte Phasentransferkatalysator wird einzeln oder in Kombination von zwei oder mehr Arten verwendet.

[0022] Der Phasentransferkatalysator wird auf 1 Mol der Verbindung (2) verwendet, in einer Menge im Allgemeinen zwischen 0,01 und 1 Mol und vorzugsweise zwischen 0,01 und 0,5 Mol.

[0023] Die oben angegebene Reaktion wird bei einer Temperatur im Allgemeinen zwischen 0°C und 150°C und vorzugsweise zwischen 0°C und 120°C durchgeführt und wird im Allgemeinen für 1 bis 80 Stunden vor der Terminierung durchgeführt.

[0024] In der oben angegebenen Reaktion wird ein Chloratom oder Bromatom an Position 5 des Imidazolrings selektiv iodiert und somit wird die Verbindung (3) wirksam hergestellt.

[0025] Die Reaktion zum Erhalt der Verbindung (1) von der Verbindung (3) wird in einem geeigneten Lösemittel in Anwesenheit eines Reduktionsmittels durchgeführt.

[0026] Bekannte Hydrierungsreduktionsmittel, katalytische Hydrierungsreduktionsmittel und andere Mittel werden als solche Reduktionsmittel verwendet.

[0027] Beispiele eines Hydrierungsreduktionsmittels können einschließen: Sulfitverbindungen, wie Natriumbisulfit, Natriumsulfit, Natriumpyrosulfit, Ammoniumsulfit, Ammoniumsulfidmonohydrat oder Ammoniumbisulfit; niedere Tetraalkylammoniumborhydride, wie Tetramethylammoniumborhydrid, Tetraethylammoniumborhydrid, Tetra-n-butylammoniumborhydrid oder Tetra-n-butylammoniumcyanoborhydrid; Natriumcyanoborhydrid, Lithiumcyanoborhydrid, Natriumborhydrid und Diboran. Diese Hydrierungsreduktionsmittel werden allein oder in Kombination von zwei oder mehr Arten verwendet.

[0028] Beispiele eines katalytischen Hydrierungsreduktionsmittels können Palladium, Palladiumschwarz, Palladium-Kohlenstoff, Palladiumhydroxid-Kohlenstoff, Rhodium-Aluminiumoxid, Platin, Platinoxid, Kupferchromit, Palladiumacetat, Platin-Aluminiumoxid, Platin-Kohlenstoff, Palladium-Aluminiumoxid, Platinschwarz

und Raney-Nickel einschließen. Diese katalytischen Hydrierungsreduktionsmittel werden allein oder in Kombination von zwei oder mehr Arten verwendet.

[0029] Von diesen Reduktionsmitteln sind katalytische Hydrierungsreduktionsmittel, insbesondere Platinoxid und Palladium-Aluminiumoxid, bevorzugt.

[0030] In der vorliegenden Erfindung können die zuvor genannten Hydrierungsreduktionsmittel und katalytischen Hydrierungsreduktionsmittel in Kombination verwendet werden.

[0031] Beispiele eines Lösemittels, das hier verwendet wird, können einschließen: Wasser; Fettsäuren, wie Essigsäure; niedere Alkohole, wie Methanol, Ethanol oder Isopropanol; aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie n-Hexan oder Cyclohexan; Ketone, wie Aceton oder Methylethylketon; Ether, wie Diethylether, Tetrahydrofuran, Diisopropylether, Monoglime, Diglime, 1,4-Dioxan oder Dimethoxyethan; aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Benzol, Toluol oder Xylol; Ester, wie Ethylacetat, Methylacetat oder n-Butylacetat; aprotische polare Lösemittel, wie Dimethylsulfoxid, N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid oder 1-Methyl-2-pyrrolidinon (NMP); und ihre gemischten Lösemittel.

[0032] Wenn Diboran oder dergleichen als ein Hydrierungsreduktionsmittel verwendet wird, ist es geeignet, ein wasserfreies Lösemittel zu verwenden. Wenn Platinoxid oder Palladium-Aluminiumoxid als ein katalytisches Hydrierungsreduktionsmittel verwendet wird, ist es bevorzugt, gemischte Lösemittel, die Wasser enthalten, zu verwenden, insbesondere gemischte Lösemittel, die aus Wasser und Fettsäuren, Ketonen, Ethern oder aprotischen polaren Lösemitteln bestehen.

[0033] Ein Hydrierungsreduktionsmittel wird zu 1 mol der Verbindung (3) zu einer Menge von im Allgemeinen zumindest 1 mol und vorzugsweise zwischen 1 und 10 mol verwendet.

[0034] Die Reaktion, bei der ein Hydrierungsreduktionsmittel verwendet wird, wird bei einer Temperatur im Allgemeinen zwischen 0°C und 150°C und vorzugsweise zwischen 0°C und 120°C durchgeführt. Die Reaktion wird im Allgemeinen für 1 bis 30 Stunden vor der Terminierung durchgeführt.

[0035] Wenn ein katalytisches Hydrierungsreduktionsmittel verwendet wird, wird die Reaktion in einer Wasserstoffatmosphäre unter im Allgemeinen zwischen Normaldruck und 20 Atmosphären und vorzugsweise zwischen Normaldruck und 10 Atmosphären bei einer Temperatur im Allgemeinen zwischen -30°C und 100°C und vorzugsweise zwischen 0°C und 80°C durchgeführt. Die Reaktion wird im Allgemeinen für 1 bis 90 Stunden vor der Terminierung durchgeführt.

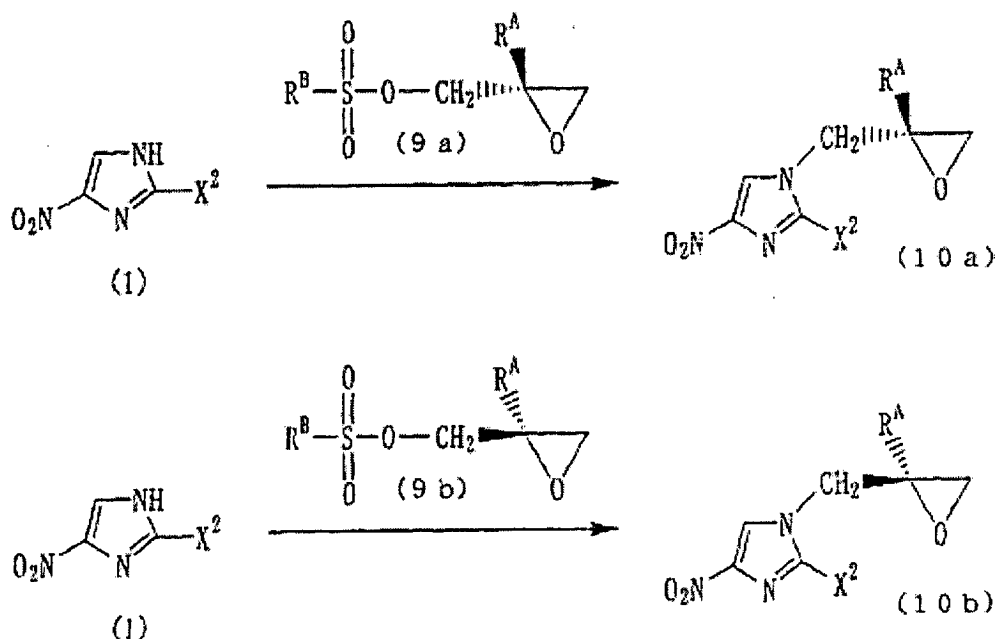
[0036] Ein katalytisches Hydrierungsreduktionsmittel wird zu der Verbindung (3) zu einem Gewichtsverhältnis im Allgemeinen zwischen 0,1 Gew.% und 40 Gew.% und vorzugsweise zwischen 0,1 Gew.% und 20 Gew.% verwendet.

[0037] Um die Reaktion fortzuführen, können Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin oder N-Ethyl-diisopropylamin zu dem Reaktionssystem zugegeben werden, bei dem ein katalytisches Hydrierungsreduktionsmittel verwendet wird.

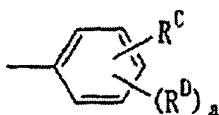
[0038] Als ein Ergebnis der zuvor genannten Reduktionsreaktion wird ein Iodat, das an die Position 5 des Imidazolrings substituiert ist, selektiv eliminiert, derart, dass eine gewünschte Verbindung, die durch die allgemeine Formel (1) dargestellt wird, wirksam erhalten werden kann. Die vorliegenden Erfinder haben solch eine Tatsache zum ersten Mal festgestellt.

[0039] Die 4-Nitroimidazolverbindung, die durch die allgemeine Formel (1) der vorliegenden Erfindung dargestellt wird, kann zu einer Verbindung (13a) oder (13b) induziert werden, die als antituberkuläres Mittel geeignet ist, beispielsweise durch die Verfahren, die durch das folgende Reaktionsschema-4 und Reaktionsschema-5 dargestellt werden:

Reaktionsschema-4



worin X² das Gleiche wie oben definiert ist; R^A ein Wasserstoffatom oder eine Niederalkylgruppe darstellt und R^B die folgende Gruppe darstellt:



worin R^C eine Nitrogruppe darstellt; R^D ein Halogenatom oder eine Niederalkylgruppe darstellt und a 0, 1 oder 2 darstellt, und wenn a 2 darstellt, können zwei R^D entweder identisch oder verschieden sein können.

[0040] Die Reaktion zwischen der 4-Nitroimidazolverbindung, die durch die allgemeine Formel (1) und die Verbindung (9a) oder (9b) dargestellt wird, wird in einem geeigneten Lösemittel in Anwesenheit einer basischen Verbindung durchgeführt.

[0041] Beispiele eines Lösemittels, das hier verwendet werden kann, schließen ein: aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Benzol, Toluol oder Xylol; Ether, wie Diethylether, Tetrahydrofuran, Dioxan oder Diethylenglykoldimethylether; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan, Chloroform oder Tetrachlorkohlenstoff; niedere Alkohole, wie Methanol, Ethanol, Isopropanol, Butanol oder tert-Butanol; Essigsäure; Ester, wie Ethylacetat oder Methylacetat; Ketone, wie Aceton oder Methylethylketon; Acetonitril; Pyridin; 2,4,6-Coluidin; Dimethylsulfoxid; Dimethylformamid; Hexamethylphosphortriamid und deren gemischte Lösemittel.

[0042] Bekannte anorganische Basen und organische Basen können in einem breiten Bereich als basische Verbindungen verwendet werden.

[0043] Beispiele einer anorganischen Base können einschließen: Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat oder Kaliumcarbonat; Alkalimetallwasserstoffcarbonate, wie Natriumbicarbonat oder Kaliumbicarbonat; Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid oder Kaliumhydroxid; Alkalimetallphosphate, wie Natriumphosphat oder Kaliumphosphat; Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid oder Kaliumhydrid; Alkalimetalle, wie Kalium oder Natrium; Alkalimetallamidate, wie Natriumamid; und Alkalimetallalkoholate, wie Natriummethylat oder Natriummethylat.

[0044] Beispiele einer organischen Base können Pyridin, Trimethylamin, Triethylamin, N-Ethyldiisopropylamin, 2,4,6-Coluidin, Dimethylanilin, Dimethylaminopyridin, 1-Methyl-2-pyrrolidinon (NMP), N-Methylmorpholin, N,N-Dimethyl-4-aminopyridin, 1,5-Diazabicyclo[4.3.0]nonen-5 (DBN), 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undecen-7 (DBU) und 1,4-Diazabicyclo[2.2.2]octan (DABCO) einschließen.

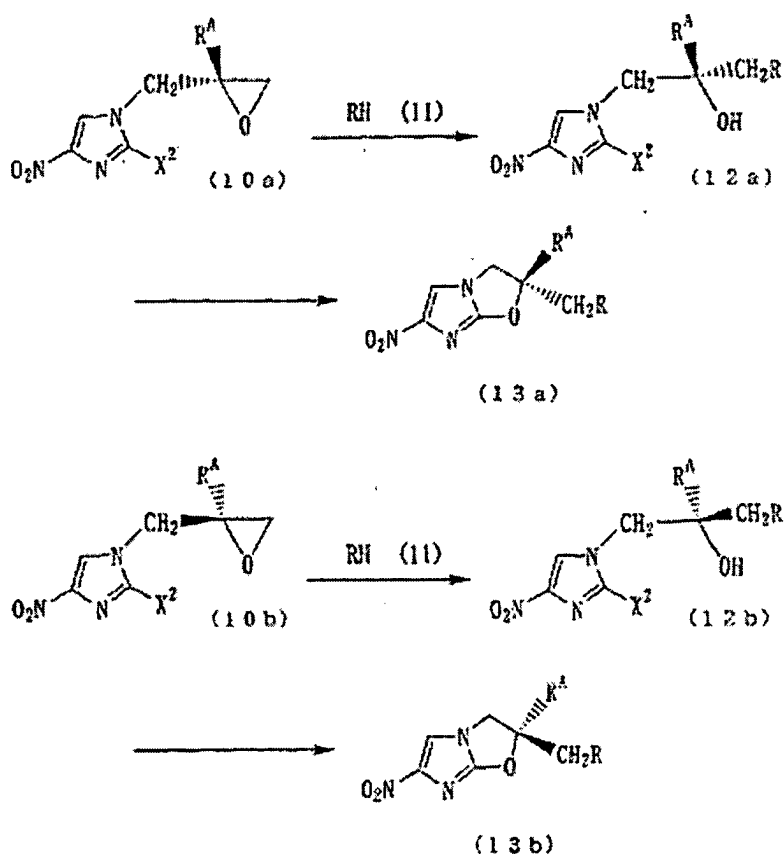
[0045] Diese basischen Verbindungen werden allein oder in Kombination von zwei oder mehr Arten verwendet.

[0046] Die Verbindung (1) wird auf 1 mol der Verbindung (9a) oder (9b) in einer Menge von im Allgemeinen zumindest 1 mol und vorzugsweise zwischen 1 und 3 mol verwendet. Die basische Verbindung wird auf 1 mol der Verbindung (9a) oder (9b) in einer Menge im Allgemeinen zwischen 1 und 10 mol und vorzugsweise zwischen Äquimolar und 5 mol verwendet.

[0047] Die Reaktion zwischen der Verbindung (1) und der Verbindung (9a) oder (9b) wird im Allgemeinen bei einer Temperatur im Allgemeinen zwischen Raumtemperatur und 150°C und vorzugsweise zwischen Raumtemperatur und 100°C durchgeführt. Die Reaktion wird im Allgemeinen für 1 bis 100 Stunden vor der Terminierung durchgeführt.

[0048] Während der oben angegebenen Reaktion können Halogenide, wie Cäsiumfluorid, zu dem Reaktionssystem zugegeben werden.

Reaktionsschema-5



worin R^A und X^2 die Gleichen wie oben definiert sind und R eine Gruppe darstellt, die durch die folgenden allgemeinen Formeln (A), (B), (C), (D), (E), (F) oder (G) dargestellt werden.

[0049] Eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (A) dargestellt wird:

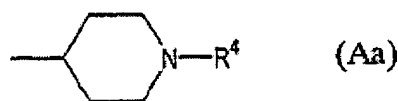


(A)

(worin R^3 darstellt:

- A1) ein Wasserstoffatom;
- A2) eine C1-C6-Alkylgruppe;
- A3) eine C1-C6-Alkoxy-C1-C6-alkylgruppe;
- A4) eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin beim Phenylring zumindest eines, das aus der folgenden Gruppe ausgewählt ist, substituiert sein kann: eine Phenyl-C1-C6-alkoxygruppe; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe; und eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkoxygruppe und eine Phenoxygruppe [worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkoxygruppe substituiert sein kann]);
- A5) eine Biphenyl-C1-C6-alkylgruppe;
- A6) eine Phenyl-C2-C6-alkenylgruppe;

- A7) eine C1-C6-Alkylsulfonylgruppe;
 A8) eine Benzolsulfonylgruppe, worin eine C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann;
 A9) eine C1-C6-Alkanoylgruppe;
 A10) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Aa) hergestellt wird:



- (worin R⁴ darstellt: eine C1-C6-Alkoxy-carbonylgruppe; eine Phenyl-C1-C6-alkoxy-carbonylgruppe [worin am Phenylring zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Phenyl-C1-C6-alkoxygruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; oder eine Phenyl-C1-C6-Alkylgruppe [worin am Phenylring zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Phenyl-C1-C6-alkoxygruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]);
 A11) eine Biphenyl-C1-C6-alkoxy-carbonylgruppe;
 A12) eine Benzoxazolyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Benzoxazolring wenigstens eine Oxogruppe substituiert sein kann);
 A13) eine Benzoxazolylgruppe; oder
 A14) eine Oxazolyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Oxazolring zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Phenylgruppe und einer C1-C6-Alkylgruppe besteht, substituiert sein kann).

[0050] Eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (B) dargestellt wird:



(worin R⁵ eine Tetrazolylgruppe darstellt [worin am Tetrazolring eine C1-C6-Alkylgruppe oder eine Phenylgruppe, welche ein Halogenatom aufweisen kann, substituiert sein kann] oder eine Benzoxazolylgruppe).

[0051] Eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (C) dargestellt wird:



(worin R⁶ eine C1-C6-Alkylgruppe darstellt).

[0052] Eine Carbamoyloxygruppe, die durch die allgemeine Formel (D) dargestellt wird:

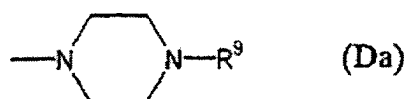


(worin R⁷ und R⁸ jeweils identisch oder unterschiedlich sind und darstellen:

- D1) ein Wasserstoffatom;
 D2) eine C1-C8-Alkylgruppe;
 D3) eine halogensubstituierte C1-C6-Alkylgruppe;
 D4) eine C1-C6-Alkoxy-carbonyl-C1-C6-alkylgruppe;
 D5) eine C3-C8-Cycloalkylgruppe;
 D6) eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);
 D7) eine Phenylgruppe (worin am Phenylring 1 bis 3 Gruppen, die aus der Gruppe ausgewählt sind, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe, einer C1-C6-Alkanoylgruppe, einer Carbonylgruppe, einer C1-C6-Alkoxy-carbonylgruppe, einer Phenyl-C1-C6-alkoxy-carbonylgruppe, einer Carbamoylgruppe, einer C1-C6-Alkylcarbamoylgruppe, einer Aminosulfonylgruppe und einer Morpholinogruppe besteht, substituiert sein können);
 D8) eine Naphthylgruppe; oder
 D9) eine Pyridylgruppe; oder ferner
 D10) R⁷ und R⁸ können jeweils aneinander zusammen mit Stickstoffatomen benachbart dazu, direkt oder durch andere Heteroatome oder Kohlenstoffatome binden, um eine gesättigte heterozyklische Gruppe zu bilden, die durch eines von (D10-1) bis (D10-3), was unten angegeben ist, dargestellt werden oder eine

benzolkondensierte heterozyklische Gruppe, die durch irgendeines von (D10-4) bis (D10-7), was unten angegeben ist, dargestellt wird:

(D10-1) eine Piperazinygruppe, die durch die allgemeine Formel (Da) dargestellt wird:



(worin R⁹ darstellt:

(Da1) ein Wasserstoffatom;

(Da2) eine C1-C6-Alkylgruppe;

(Da3) eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Da4) eine Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

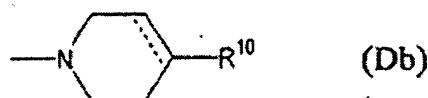
(Da5) eine C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe;

(Da6) eine Phenyl-C1-C6-alkoxycarbonylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Da7) eine Phenyl-C3-C6-alkenylloxycarbonylgruppe (worin am Phenylring zumindest eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann); oder

(Da8) eine Phenyl-C1-C6-alkylidensubstituierte Aminogruppe (worin am Phenylring zumindest eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann));

(D10-2) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Db) dargestellt wird:



(worin die gestrichelte Linie anzeigt, dass die Bindung eine Doppelbindung sein kann; und R¹⁰ stellt dar:

(Db1) ein Wasserstoffatom;

(Db2) eine Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus Halogen, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Db3) eine Phenoxygruppe (worin am Phenylring zumindest eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann); oder

(Db4) eine Phenylaminogruppe (worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann));

(D10-3) eine Morpholinogruppe;

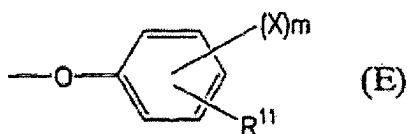
(D10-4) eine Indolinylgruppe (worin am Indolinring wenigstens ein Halogenatom substituiert sein kann);

(D10-5) eine Isoindolinylgruppe (worin am Isoindolinring wenigstens ein Halogenatom substituiert sein kann);

(D10-6) eine 1,2,3,4-Tetrahydrochinolylgruppe (worin am 1,2,3,4-Tetrahydrochinolylring wenigstens ein Halogenatom substituiert sein kann); oder

(D10-7) eine 1,2,3,4-Tetrahydroisochinolylgruppe (worin am 1,2,3,4-Tetrahydroisochinolylring wenigstens ein Halogenatom substituiert sein kann).

[0053] Eine Phenoxygruppe, die durch die allgemeine Formel (E) dargestellt wird:



[worin X ein Halogenatom oder eine aminosubstituierte C1-C6-Alkylgruppe darstellt, die eine C1-C6-Alkylgruppe als einen Substituenten aufweisen kann; m eine ganze Zahl zwischen 0 und 3 darstellt und R¹¹ darstellt:

E1) ein Wasserstoffatom;

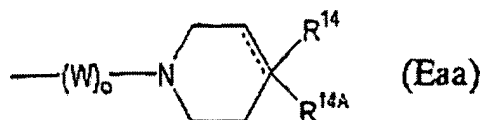
- E2) eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe;
 E3) eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkoxygruppe;
 E4) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Ea) dargestellt wird:



(Ea)

(worin W die Gruppe -CO- oder eine C1-C6-Alkylengruppe darstellt; o stellt 0 oder 1 dar; und R^{12} und R^{13} stellen jeweils gleich oder verschieden voneinander dar:

- (Ea1) ein Wasserstoffatom;
 (Ea2) eine C1-C6-Alkylgruppe;
 (Ea3) eine C1-C6-Alkanoylgruppe;
 (Ea4) eine C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe;
 (Ea5) eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring zumindest eines, das aus der folgenden Gruppe ausgewählt ist, substituiert sein kann: ein Halogenatom; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkoxygruppe; und eine Phenoxygruppe [worin am Phenylring zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe als ein Substituent besteht, substituiert sein kann] und ferner, worin eine C1-C6-Alkoxyiminogruppe durch einen C1-C6-Alkylabschnitt davon substituiert sein kann);
 (Ea6) eine Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);
 (Ea7) eine Benzoylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);
 (Ea8) eine Pyridylgruppe (worin am Pyridinring zumindest ein Halogenatom substituiert sein kann);
 (Ea9) eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);
 (Ea10) eine Phenoxy-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann); oder
 (Ea11) eine Benzoyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);
 E5) eine Imidazolylgruppe;
 E6) eine Triazolylgruppe;
 E7) eine Morpholinogruppe;
 E8) eine Thiomorpholinogruppe;
 E9) eine s-Oxidthiomorpholinogruppe;
 E10) eine Piperidylgruppe, die durch die allgemeine Formel (Eaa) dargestellt wird:



(worin W und o die gleichen wie oben definiert sind; R^{14A} ein Wasserstoffatom, eine Hydroxylgruppe, eine C1-C6-Alkoxygruppe oder eine Phenylgruppe darstellt [worin am Phenylring ein Halogenatom substituiert sein kann]; die gestrichelte Linie anzeigt, dass die Bindung eine Doppelbindung sein kann und wenn die gestrichelte Linie solch eine Doppelbindung darstellt, nur R^{14} substituiert ist; und R^{14} und R^{14A} über Kohlenstoffatome, die daran angrenzen, derart miteinander verbunden werden können, um eine C1-C4-Alkylendioxygruppe zu bilden, worin R^{14} darstellt:

- (Eaa1) ein Wasserstoffatom;
 (Eaa2) eine C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe;
 (Eaa3) eine Phenoxygruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der folgenden Gruppe ausgewählt ist, substituiert sein kann: ein Halogenatom; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte

C1-C6-Alkylgruppe; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkoxygruppe; eine C1-C4-Alkylendioxygruppe; eine C1-C6-Alkoxy-carbonylgruppe; eine Cyanogruppe; eine C2-C6-Alkenylgruppe; eine Nitrogruppe; eine Phenylgruppe; eine Aminogruppe, die als einen Substituenten eine Gruppe aufweisen kann, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Phenylgruppe, einer C1-C6-Alkylgruppe, einer Carbamoylgruppe und einer C1-C6-Alkanoylgruppe; einer C1-C6-alkanoylsubstituierten C1-C6-Alkylgruppe, einer Hydroxylgruppe; einer C1-C6-alkoxy-carbonylsubstituierten C1-C6-Alkylgruppe; einer Phenyl-C1-C6-Alkylgruppe; einer C1-C6-Alkanoylgruppe; einer C1-C6-Alkylthiogruppe; einer 1,2,4-Triazolylgruppe; einer Isoxazolylgruppe; einer Imidazolylgruppe; einer Benzothiazolylgruppe; einer 2H-Benzotriazolylgruppe; einer Pyrolylgruppe; einer Benzoxazolylgruppe; einer Piperazinylgruppe [worin am Piperazinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkoxy-carbonylgruppe und einer Phenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann) besteht, als ein Substituent substituiert sein kann]; einer Piperidylgruppe [worin am Piperidinring wenigstens eine Aminogruppe substituiert sein kann, worin an der Aminogruppe wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe und einer Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eine, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann) besteht, als ein Substituent substituiert sein kann], und einer Carbamoylgruppe besteht);

(Eaa4) eine Hydroxylgruppe;

(Eaa5) eine Carboxygruppe;

(Eaa6) eine Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Phenoxygruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, als ein Substituent substituiert sein kann], einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, als ein Substituent substituiert sein kann);

(Eaa7) eine C1-C6-Alkoxygruppe;

(Eaa8) eine C3-C8-Cycloalkyl-C1-C6-alkoxygruppe;

(Eaa9) eine Phenylcarbamoylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe, und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Eaa10) eine Tetrahydropyranyloxygruppe;

(Eaa11) eine 1,3-Dioxolanylgruppe;

(Eaa12) eine Oxogruppe;

(Eaa13) eine Naphthyloxygruppe (worin am Naphthalinring wenigstens eine C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann);

(Eaa14) eine 2,3-Dihydrobenzofuryloxygruppe (worin am 2,3-Dihydrobenzofuranring wenigstens eines von der Gruppe, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe und einer Oxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Eaa15) eine Benzothiazolyloxygruppe (worin am Benzothiazolring wenigstens eine C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann);

(Eaa16) eine 1,2,3,4-Tetrahydronaphthyloxygruppe (worin am 1,2,3,4-Tetrahydronaphthalinring zumindest eine Oxogruppe substituiert sein kann);

(Eaa17) eine 1,3-Benzoxathiolanyloxygruppe (worin am 1,3-Benzoxathiolanring wenigstens eine Oxogruppe substituiert sein kann);

(Eaa18) eine Isochinolinolyloxygruppe;

(Eaa19) eine Pyridyloxygruppe;

(Eaa20) eine Chinolyloxygruppe (worin am Chinolinring zumindest eine C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann);

(Eaa21) eine Dibenzofuryloxygruppe;

(Eaa22) eine 2H-Chromenyloxygruppe (worin am 2H-Chromenring wenigstens eine Oxogruppe substituiert sein kann);

(Eaa23) eine Benzoisoxazololyloxygruppe;

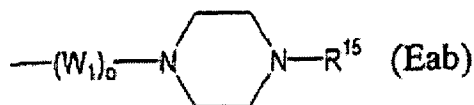
(Eaa24) eine Chinoxalyloxygruppe;

(Eaa25) eine 2,3-Dihydro-1H-indenyloxygruppe (worin am 2,3-Dihydro-1H-indenring zumindest eine Oxogruppe substituiert sein kann);

(Eaa26) eine Benzofurazanyloxygruppe; oder

(Eaa27) eine Phenyl-C2-C6-Alkenylgruppe (worin am Phenylring zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann));

E11) stellt eine Gruppe dar, die durch die allgemeine Formel (Eab) dargestellt wird:



(worin o das Gleiche wie oben definiert ist; W_1 eine niedere Alkylengruppe darstellt; und R^{15} darstellt:

(Eab1) ein Wasserstoffatom;

(Eab2) eine C1-C6-Alkylgruppe (worin an der Alkylgruppe eine Morpholinogruppe, eine Benzoylgruppe, eine Carbamoylgruppe, die eine C1-C6-Alkylgruppe als einen Substituenten aufweisen kann, oder eine Cyanogruppe substituiert sein kann);

(Eab3) eine C3-C8-Cycloalkylgruppe;

(Eab4) eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer Cyanogruppe, einer Phenylgruppe, einer Nitrogruppe, einer C1-C6-Alkylthiogruppe, einer C1-C6-Alkylsulfonylgruppe, einer Phenyl-C1-C6-alkoxygruppe, einer C2-C6-Alkanoyloxygruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe und einer 1,2,3-Thiadiazolgruppe besteht, substituiert sein kann);

(Eab5) eine C2-C6-Alkenylgruppe;

(Eab6) eine Phenylgruppe (worin am Phenylring zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer Cyanogruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Eab7) eine C1-C6-Alkanoylgruppe;

(Eab8) eine Phenyl-C2-C6-alkanoylgruppe (worin am Phenylring zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Eab9) eine Benzoylgruppe (worin am Benzolring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Eab10) eine C1-C20-Alkoxy-carbonylgruppe (worin an der Alkoxygruppe wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer Aminogruppe, die eine C1-C6-Alkylgruppe als einen Substituenten aufweisen kann, und eine C1-C6-alkoxysubstituierte C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Eab11) eine Phenyl-C1-C6-alkoxy-carbonylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe, einer Nitrogruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylthiogruppe, einer Aminogruppe, die eine C1-C6-Alkanoylgruppe aufweisen kann, einer Phenyl-C1-C6-alkoxygruppe, einer C1-C6-Alkoxy-carbonylgruppe und einer 1,2,3-Thiadiazolylgruppe besteht, substituiert sein kann);

(Eab12) eine Phenyl-C3-C6-Alkenyloxycarbonylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Eab13) eine Phenoxycarbonylgruppe (worin am Phenylring zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Eab14) eine Phenyl-C1-C6-Alkylcarbamoylgruppe (worin an dem Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Eab15) eine Phenylcarbamoylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkyl-

gruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Eab16) eine benzofurylsubstituierte C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe (worin am Benzofuranring wenigstens ein Halogenatom substituiert sein kann);

(Eab17) eine Benzothieryl-C1-C6-alkoxycarbonylgruppe (worin am Benzothiophenring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Eab18) eine naphthylsubstituierte C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe;

(Eab19) eine pyridylsubstituierte C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe (worin am Pyridinring zumindest ein Halogenatom substituiert sein kann);

(Eab20) eine furylsubstituierte C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe (worin am Furanring wenigstens eine Nitrogruppe substituiert sein kann);

(Eab21) eine thienylsubstituierte C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe (worin am Thiophenring wenigstens ein Halogenatom substituiert sein kann);

(Eab22) eine thiazolylsubstituierte C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe (worin am Thiazolring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe und einer Phenylgruppe [worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann] besteht, substituiert sein kann);

(Eab23) eine tetrazolylsubstituierte C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe (worin am Tetrazolring zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe und einer Phenylgruppe [worin an dem Phenylring wenigstens ein Halogenatom substituiert sein kann] besteht, substituiert sein kann);

(Eab24) eine 2,3-Dihydro-1H-indenylloxycarbonylgruppe;

(Eab25) eine adamantansubstituierte C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe;

(Eab26) eine Phenyl-C3-C6-alkynyloxycarbonylgruppe;

(Eab27) eine Phenylthio-C1-C6-alkoxycarbonylgruppe;

(Eab28) eine phenyl-C1-C6-alkoxysubstituierte C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe;

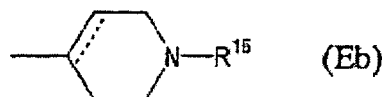
(Eab29) eine C2-C6-Alkenyloxycarbonylgruppe;

(Eab30) eine C2-C6-Alkynyloxycarbonylgruppe;

(Eab31) eine C3-C8-cycloalkylsubstituierte C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe; oder

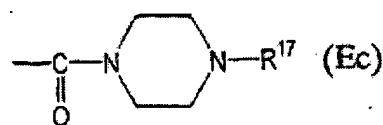
(Eab32) eine benzoylsubstituierte C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe);

E12) stellt eine Gruppe dar, die durch die allgemeine Formel (Eb) dargestellt wird:



(worin die gestrichelte Linie bedeutet, dass die Bindung eine Doppelbindung sein kann; und R^{16} die gleiche Gruppe wie R^{15} darstellt);

E13) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Ec) dargestellt wird:



(worin R^{17} darstellt:

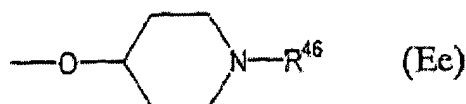
(Ec1) eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Ec2) eine C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe; oder

(Ec3) eine Phenyl-C1-C6-alkoxycarbonylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

E14) eine Pyridylgruppe;

E15) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Ee) dargestellt wird:



(worin R^{46} darstellt: eine Phenylgruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; eine Phenyl-C1-C6-alkoxycarbonylgruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; oder eine C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe);
 E16) eine Phenoxygruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);
 E17) eine Benzoylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);
 E18) eine 8-Azabicyclo[3,2,1]-octylgruppe (worin am 8-Azabicyclo[3,2,1]octanring wenigstens eine Phenoxygruppe substituiert sein kann (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann));

E19) eine Gruppe, die durch die folgende allgemeine Formel (Ef) dargestellt wird:



(worin R^{47} und R^{48} jeweils gleich oder verschieden voneinander darstellen: ein Wasserstoffatom; eine C1-C6-Alkylgruppe; eine Phenylgruppe [worin am Phenylring zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; oder eine Pyridylgruppe [worin am Pyridinring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe als ein Substituent substituiert sein kann] und ferner, worin R^{47} und R^{48} aneinander zusammen mit Stickstoffatomen, die direkt dazu benachbart vorliegen, oder durch andere Heteroatome binden können, um einen 5-7-gliedrigen gesättigten heterozyklischen Ring zu bilden, worin am heterozyklischen Ring wenigstens eine Phenylgruppe als ein Substituent substituiert sein kann [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]);

E20) eine Phenyl-C1-C6-alkoxygruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

E21) eine aminosubstituierte C2-C6-Alkenylgruppe (worin an der Aminogruppe wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe und einer Phenylgruppe besteht [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann] substituiert sein kann); oder E22) eine Oxazolidinylgruppe (worin am Oxazolidinring wenigstens eine Oxogruppe substituiert sein kann)].

[0054] Eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (F) dargestellt wird:



[worin R^{19} und R^{20} jeweils identisch oder unterschiedlich voneinander darstellen:

F1) ein Wasserstoffatom;

F2) eine C1-C6-Alkylgruppe;

F3) eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der folgenden Gruppe ausgewählt ist, substituiert sein kann: eine Phenoxygruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; ein Halogenatom; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Al-

kylgruppe; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkoxygruppe; eine Aminogruppe (worin an der Aminogruppe zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe und einer Phenyl-C1-C6-alkylgruppe besteht [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann] substituiert sein kann); eine Piperazinylgruppe [worin am Piperazinring wenigstens eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe substituiert sein kann (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann)]; und eine Piperidylgruppe [worin am Piperidinring wenigstens eine Aminogruppe substituiert sein kann, worin an der Aminogruppe wenigstens eines aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann) und einer C1-C6-Alkylgruppe besteht, substituiert sein kann]);

F4) eine Phenoxy-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

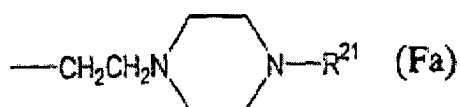
F5) eine Amino-C1-C6-alkylgruppe (worin an der Aminogruppe wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe, einer C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe und einer Phenylgruppe besteht [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe besteht, substituiert sein kann] substituiert sein kann);

F6) eine Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer Phenoxygruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann] und einer C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe besteht, substituiert sein kann);

F7) eine C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe;

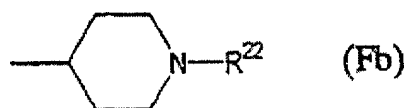
F8) eine Phenyl-C1-C6-alkoxycarbonylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

F9) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Fa) dargestellt wird:



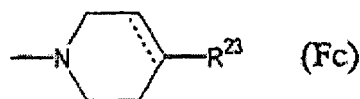
(worin R^{21} darstellt: eine C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe; eine Phenyl-C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer Cyanogruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann); eine Phenyl-C1-C6-Alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe besteht, substituiert sein kann); oder eine Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einem Cyanoatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann));

F10) eine 1-substituierte-4-Piperidylgruppe, die durch die allgemeine Formel (Fb) dargestellt wird:



(worin R^{22} darstellt: eine C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe; eine Phenyl-C1-C6-alkoxycarbonylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann); oder eine Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer

Cyanogruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann); oder
 F11) eine Piperidyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Piperidinring wenigstens eine Phenoxygruppe substituiert sein kann (worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann)); oder ferner
 F12) R^{19} und R^{20} miteinander direkt über dazu angrenzende Stickstoffatome binden können oder durch andere Heteroatome oder Kohlenstoffatome, derart, um einen heterozyklischen Ring zu bilden, der durch irgendeines von (F12-1) bis (F12-10) dargestellt wird, was unten angegeben wird:
 (F12-1) stellt eine Gruppe dar, die durch die allgemeine Formel (Fc) dargestellt wird:



[worin die gestrichelte Linie bedeutet, dass die Bindung eine Doppelbindung sein kann; und R^{23} stellt dar:

(Fc1) eine C1-C6-Alkylgruppe

(Fc2) eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fc3) eine Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der folgenden Gruppe ausgewählt ist, substituiert sein kann: ein Halogenatom; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkoxygruppe; eine Aminogruppe, die als einen Substituenten eine Gruppe, die aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe und einer Phenyl-C1-C6-alkylgruppe besteht, aufweisen kann [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; eine Phenoxygruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; eine Phenyl-C1-C6-Alkoxygruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; und eine Piperidylgruppe [worin am Piperidinring wenigstens eine Aminogruppe substituiert sein kann und worin an der Aminogruppe wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Phenyl-C1-C6-Alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann) und einer C1-C6-Alkylgruppe besteht, substituiert sein kann]);

(Fc4) eine Phenyl-C1-C6-Alkoxygruppe (worin am Phenylring zumindest eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fc5) eine Biphenyl-C1-C6-alkoxygruppe;

(Fc6) eine Phenyl-C3-C6-alkenylalkoxygruppe, worin am Phenylring wenigstens ein Halogenatom substituiert sein kann;

(Fc7) eine Phenoxygruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer Cyanogruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fc8) eine Benzoylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fc9) eine C1-C6-Alkoxy-carbonylgruppe;

(Fc10) eine Phenyl-C1-C6-alkoxy-carbonylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkoxygruppe substituiert sein kann);

(Fc11) eine Phenyl-C1-C6-alkyl-carbamoylgruppe, worin am Phenylring wenigstens ein Halogenatom substituiert sein kann;

(Fc12) eine Phenyl-carbamoylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkyl-

gruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fc13) eine Phenylthiogruppe (worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkoxygruppe substituiert sein kann);

(Fc14) ein Phenylsulfoxid (worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkoxygruppe substituiert sein kann);

(Fc15) eine Pyridyl-C1-C6-alkoxygruppe; oder

(Fc16) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Fca) dargestellt wird:



(worin o das Gleiche ist wie oben beschrieben; R²⁴ und R²⁵ jeweils darstellen:

(Fca1) ein Wasserstoffatom;

(Fca2) eine C1-C6-Alkylgruppe;

(Fca3) eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das ausgewählt ist aus der Gruppe, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fca4) eine Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer Cyanogruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fca5) eine C1-C6-Alkanoylgruppe;

(Fca6) eine Phenyl-C2-C6-alkanoylgruppe, worin am Phenylring wenigstens ein Halogenatom substituiert sein kann;

(Fca7) eine Benzoylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fca8) eine C1-C6-Alkoxy-carbonylgruppe;

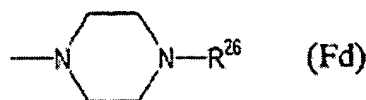
(Fca9) eine Phenyl-C1-C6-alkoxy-carbonylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fca10) eine Phenyl-carbamoylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann); oder

(Fca11) eine Piperidyl-oxycarbonylgruppe (worin am Piperidinring wenigstens eine Phenylgruppe als ein Substituent substituiert sein kann [worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann]); oder ferner

(Fca12) R²⁴ und R²⁵ einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten heterozyklischen Ring über Stickstoffatome daran angrenzend bilden können, worin am heterozyklischen Ring wenigstens eines, das aus den folgenden Gruppen ausgewählt wird, substituiert sein kann: eine C1-C6-Alkoxy-carbonylgruppe; eine Benzoylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann); eine Phenoxygruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann); eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann); eine Phenyl-C1-C6-alkoxy-carbonylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann); eine Phenyl-C2-C6-alkenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann); und eine Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

F12-2) eine 4-substituierte-1-Piperazinylgruppe, die durch die allgemeine Formel (Fd) dargestellt wird:



(worin R^{26} darstellt:

(Fd1) ein Wasserstoffatom;

(Fd2) eine C1-C6-Alkylgruppe;

(Fd3) eine C3-C8-Cycloalkylgruppe;

(Fd4) eine C3-C8-Cycloalkyl-C1-C6-Alkylgruppe;

(Fd5) eine C1-C6-Alkoxycarbonyl-C1-C6-Alkylgruppe;

(Fd6) eine Phenyl-C2-C6-Alkenylgruppe;

(Fd7) eine Phenyl-C1-C6-Alkylgruppe (worin am Phenylring 1 bis 3 Gruppen, die aus der folgenden Gruppe ausgewählt sind, substituiert sein können: ein Halogenatom; eine Cyanogruppe; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe; eine C3-C8-Cycloalkylgruppe; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkoxygruppe; eine Aminogruppe, die eine C1-C6-Alkylgruppe als einen Substituenten aufweisen kann; eine C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe; eine Phenoxygruppe; eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe; eine Phenyl-C2-C6-Alkenylgruppe; eine Pyridylgruppe; eine Imidazolylgruppe und eine Piperidylgruppe);

(Fd8) Biphenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe und einer Aminogruppe, die eine C1-C6-Alkylgruppe als einen Substituenten aufweisen kann, besteht, substituiert sein kann);

(Fd9) eine Naphthyl-C1-C6-Alkylgruppe;

(Fd10) eine Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der folgenden Gruppe ausgewählt ist, substituiert sein kann: ein Halogenatom; eine Cyanogruppe; eine Aminogruppe, die eine C1-C6-Alkylgruppe als einen Substituenten aufweisen kann; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkoxygruppe; eine C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe; eine Carboxylgruppe; eine Phenoxygruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; eine Amino-C1-C6-Alkylgruppe [worin an der Aminogruppe wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann) und einer C1-C6-Alkylgruppe besteht, substituiert sein kann]; und eine Phenyl-C1-C6-alkoxygruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann));

(Fd11) eine Biphenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann);

(Fd12) eine Aminogruppe, eine Aminogruppe, bei der eine C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe substituiert ist, Phenyl-C1-C6-alkylaminogruppe (worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann), oder eine Phenylaminogruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fd13) eine Benzoyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens ein Halogenatom substituiert sein kann);

(Fd14) eine Phenylcarbamoyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann);

(Fd15) eine Thiazolyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Thiazolring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten Phenylgruppe und einer C1-C6-Alkylgruppe besteht, substituiert sein kann);

(F16) eine Oxazolyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Oxazolring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten Phenylgruppe und einer C1-C6-Alkylgruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fd17) eine Indolyl-C1-C6-alkylgruppe;

(Fd18) eine Furyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Furanring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte Phenylgruppe substituiert sein kann);

(Fd19) eine Imidazolyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Imidazolring eine Phenylgruppe substituiert sein

kann);

(Fd20) eine Chinolyl-C1-C6-alkylgruppe;

(Fd21) eine Tetrazolylgruppe (worin am Tetrazolring eine Phenylgruppe substituiert sein kann);

(Fd22) eine Pyrimidylgruppe, worin eine Phenylgruppe substituiert sein kann;

(Fd23) eine Pyridylgruppe;

(Fd24) eine Benzoxazolylgruppe;

(Fd25) eine Benzothiazolylgruppe;

(Fd26) eine Benzoxazolyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Benzoxazolring wenigstens eine Oxogruppe substituiert sein kann);

(Fd27) eine Phenoxy-C2-C6-alkanoylgruppe, worin am Phenylring ein Halogenatom substituiert sein kann;

(Fd28) eine Phenylthio-C2-C6-alkanoylgruppe, worin am Phenylring ein Halogenatom substituiert sein kann;

(Fd29) eine Phenyl-C2-C6-alkanoylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fd30) eine Benzoylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe und einer Aminogruppe, die eine C1-C6-Alkylgruppe als einen Substituenten aufweisen kann, besteht, substituiert sein kann);

(Fd31) eine Biphenylcarbonylgruppe;

(Fd32) eine Pyridylcarbonylgruppe;

(Fd33) eine Phenyl-C2-C6-alkenylcarbonylgruppe, worin am Phenylring ein Halogenatom substituiert sein kann;

(Fd34) eine Phenyl-C1-C6-alkylsulfonylgruppe, worin am Phenylring ein Halogenatom substituiert sein kann;

(Fd35) eine Benzolsulfonylgruppe (worin am Benzolring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom und einer C1-C6-Alkylgruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fd36) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Fda) dargestellt wird:



(Fda)

(worin R^{27} darstellt:

(Fda1) eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C8-Alkylgruppe;

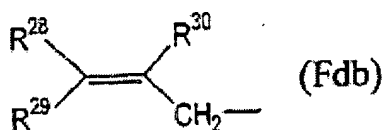
(Fda2) eine C3-C8-Cycloalkylgruppe;

(Fda3) eine C3-C8-Cycloalkyl-C1-C6-alkylgruppe;

(Fda4) eine C1-C6-Alkoxy-C1-C6-alkylgruppe;

(Fda5) eine Amino-C1-C6-alkylgruppe, die eine C1-C6-Alkylgruppe aufweisen kann;

(Fda6) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Fdb): dargestellt wird



(worin jedes von R^{28} , R^{29} und R^{30} darstellt: ein Wasserstoffatom; eine C1-C6-Alkylgruppe; oder eine Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fda7) eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring 1 bis 5 Gruppen ausgewählt sind, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylthiogruppe, einer Phenyl-C1-C6-alkoxygruppe, einer Hydroxygruppe, einer C1-C6-Alkylsulfinylgruppe, einer C1-C6-Alkylsulfonylgruppe, einer C1-C6-Alkylsulfonyloxygruppe, einer Cyanogruppe, einer C1-C6-Alkanoylgruppe, einer Benzoylgruppe, einer Phenyl-C1-C6-alkylgruppe, die eine C1-C6-Alkoxygruppe an einem Alkylabschnitt davon aufweist, einer Aminogruppe, einer Nitrogruppe, einer Carbamoylgruppe, einer C1-C6-Alkanoylaminogruppe, einer C1-C6-Alkoxy-carbonylgruppe, einer C1-C6-Alkylaminocarbonylgruppe, einer C1-C6-Alkoxy-carbonylaminogruppe, einer Tri-C1-C6-alkylsiloxygruppe, einer Pyrrolylgruppe, einer Tetrahydropyranyloxygruppe und einer Imidazolylgruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fda8) eine Biphenyl-C1-C6-alkylgruppe;

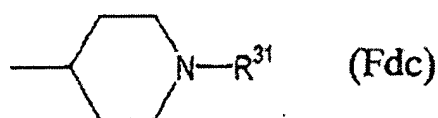
(Fda9) eine Benzhydrylgruppe (worin am Benzolring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer Trifluormethylgruppe und einer Trifluormethoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fda10) eine Phenoxy-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fda11) eine Phenyl-C2-C6-alkynylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann);

(Fda12) eine Pyridyl-C1-C6-alkylgruppe;

(Fda13) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Fdc) dargestellt wird:



(worin R³¹ darstellt: eine Phenylgruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer Cyanogruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; eine Phenyl-C1-C6-Alkylgruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; oder eine Benzoylgruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]);

(Fda14) eine Piperidino-C1-C6-alkylgruppe (worin am Piperidinring eine Phenoxygruppe, die als einen Substituenten wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte Alkylgruppe am Phenylring aufweisen kann, substituiert sein kann);

(Fda15) eine Amino-C1-C6-alkylgruppe (worin an der Aminogruppe wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe und einer Phenylgruppe besteht, die als einen Substituenten eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkoxygruppe am Phenylring aufweisen kann, substituiert sein kann);

(Fda16) eine 1,2,3,6-Tetrahydropyridyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am 1,2,3,6-Tetrahydropyridinring wenigstens eine Phenylgruppe [worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder unsubstituierte C1-C6-Alkoxygruppe substituiert sein kann]);

(Fda17) eine Naphthyl-C1-C6-alkylgruppe;

(Fda18) eine Fluorenyl-C1-C6-alkylgruppe;

(Fda19) eine Pyridyl-C1-C6-alkylgruppe;

(Fda20) eine Furyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Furanring eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte Phenylgruppe substituiert sein kann);

(Fda21) eine Thienyl-C1-C6-alkylgruppe;

(Fda22) eine Oxazolyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Oxazolring ein Halogenatom oder eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte Phenylgruppe substituiert sein kann);

(Fda23) eine Oxadiazolyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Oxadiazolring eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte Phenylgruppe substituiert sein kann);

(Fda24) eine Pyrazolyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Pyrazolring eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte Phenylgruppe substituiert sein kann);

(Fda25) eine Benzothienyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Benzothiophenring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fda26) eine Thienyl-C1-C6-alkylgruppe, worin am Thiophenring ein Halogenatom substituiert sein kann;

(Fda27) eine Benzothiazolyl-C1-C6-alkylgruppe;

(Fda28) eine Benzofuryl-C1-C6-alkylgruppe, worin am Benzofuranring ein Halogenatom substituiert sein kann;

(Fda29) eine Indoliny-C1-C6-alkylgruppe (worin am Indolinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe und einer Oxogruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fda30) eine Benzoxazolyl-C1-C6-Alkylgruppe (worin am Benzoxazolring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer C1-C6-Alkylgruppe und einer Oxogruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fda31) eine Chromenyl-C1-C6-alkylgruppe;

(Fda32) eine 1,2,3,4-Tetrahydrochinolyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Chinolinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe und einer Oxogruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fda33) eine Thiazolyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Thiazolring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten Phenylgruppe und einer C1-C6-Alkylgruppe besteht, substituiert sein kann); oder

(Fda34) eine Tetrazolyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Tetrazolring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten Phenylgruppe und einer C1-C6-Alkylgruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fd37) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Fe) dargestellt wird:



(worin Z -C=O oder -C=S darstellt; R^{32} und R^{33} jeweils gleich oder verschieden voneinander darstellen:

(Fe1) ein Wasserstoffatom;

(Fe2) eine C1-C6-Alkylgruppe;

(Fe3) eine C3-C8-Cycloalkylgruppe;

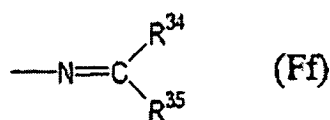
(Fe4) eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Fe5) eine Phenyl-C2-C6-alkenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann); oder

(Fe6) eine Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann); oder ferner

(Fe7) R^{32} und R^{33} miteinander mit benachbarten Stickstoffatomen dazu durch andere Kunststoffatome binden können, um einen Piperidinring oder einen 1,2,3,6-Tetrahydropyridinring zu bilden, worin, am Piperidinring oder am 1,2,3,6-Tetrahydropyridinring, eine Phenylgruppe substituiert sein kann und ferner wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe besteht, an der Phenylgruppe substituiert sein kann);

(Fd38) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Ff) dargestellt wird:

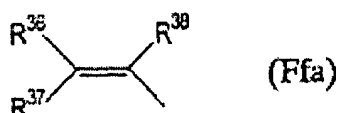


(worin R^{34} ein Wasserstoffatom oder eine niedere C1-C6-Alkylgruppe darstellt und R^{35} darstellt:

(Ff1) eine C3-C8-Cycloalkylgruppe;

(Ff2) eine C3-C8-Cycloalkenylgruppe;

(Ff3) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Ffa) dargestellt wird:



(worin jedes von R^{36} , R^{37} und R^{38} darstellt: ein Wasserstoffatom; eine C1-C6-Alkylgruppe; eine Phenylgruppe [worin am Phenylring 1 bis 5 Gruppen, die aus der Gruppe ausgewählt sind, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe, einer C1-C4-Alkylendioxygruppe, einer C1-C6-Alkylsulfonylgruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylthiogruppe, einer Nitrogruppe und einer Aminogruppe, welche eine C1-C6-Alkanoylgruppe als einen Substituenten aufweist, besteht, substituiert sein können]; eine Benzofurylgruppe [worin am Benzofuranring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; eine Biphenylgruppe; eine Furylgruppe [worin am Furanring eine Phenylgruppe,

die ein Halogenatom als einen Substituenten aufweisen kann, substituiert sein kann]; oder eine Thiazolylgruppe [worin am Thiazolring wenigstens eine Phenylgruppe, die ein Halogenatom aufweisen kann, substituiert sein kann];

(Ff4) eine Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der folgenden Gruppe ausgewählt ist, substituiert sein kann: ein Halogenatom; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe; eine C3-C8-Cycloalkylgruppe; eine Hydroxylgruppe; eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C8-Alkoxygruppe; eine C3-C8-Cycloalkoxygruppe; eine C1-C4-Alkylendioxygruppe; eine Cyanogruppe; eine Nitrogruppe; eine Phenyl-C2-C6-alkenylgruppe; eine C2-C6-Alkanoyloxygruppe; eine Aminogruppe, die eine C1-C6-Alkanoylgruppe als einen Substituenten aufweisen kann; eine C1-C6-Alkylsulfonylaminogruppe; eine Phenyl-C1-C6-alkoxygruppe; eine Phenoxygruppe; eine Aminogruppe, worin wenigstens eine C1-C6-Alkylgruppe substituiert ist; eine Aminogruppe, worin wenigstens eine Phenylgruppe substituiert ist; eine Amino-C1-C6-alkoxygruppe [worin an der Aminogruppe wenigstens eine C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann]; eine C1-C6-Alkoxy-carbonylgruppe; eine C1-C6-Alkoxy-carbonyl-C1-C6-alkoxygruppe; eine C1-C6-Alkylthiogruppe; eine Pyrolylgruppe; eine Imidazolylgruppe; eine Piperidylgruppe; eine Morpholinogruppe; eine Pyrrolidinylgruppe; eine Thienylgruppe; eine Benzofurylgruppe; eine Piperazinylgruppe [worin am Piperazinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe, einer Phenyl-C1-C6-Alkylgruppe und einer Benzoylgruppe, die wenigstens eine C1-C6-Alkylgruppe aufweist, besteht, als ein Substituent substituiert sein kann]; eine Chinolylgruppe [worin am Chinolinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkoxygruppe und einer Oxyoruppe besteht, substituiert sein kann]; eine Piperidylcarbonylgruppe, worin am Piperidinring eine Carbostyrylgruppe substituiert sein kann und eine Triazolylgruppe);

(Ff5) eine Naphthylgruppe (worin am Naphthalinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe und einer Aminogruppe, die eine C1-C6-Alkylgruppe als einen Substituenten aufweisen kann, besteht, substituiert sein kann);

(Ff6) eine Biphenylgruppe (worin am Biphenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C9-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Ff7) eine Fluorenylgruppe; eine Pyrenylgruppe;

(Ff8) eine Benzofurylgruppe (worin am Benzofuranring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Ff9) eine Benzothienylgruppe (worin am Benzothiophenring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

(Ff10) eine Pyridylgruppe (worin am Pyridinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe, einer Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann), einer Furylgruppe und einer Thienylgruppe besteht, substituiert sein kann);

(Ff11) eine Furylgruppe (worin am Furanring 1 bis 3 Gruppen, die aus der Gruppe ausgewählt sind, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe, einer Nitrogruppe und einer Phenylgruppe besteht [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe und einer Nitrogruppe besteht, substituiert sein kann] substituiert sein können);

(Ff12) eine Benzothiazolgruppe (worin am Benzothiazolring wenigstens eine Phenylgruppe, die als einen Substituenten eine C1-C6-Alkoxygruppe am Phenylring aufweisen kann, substituiert sein kann);

(Ff13) eine Thienylgruppe (worin am Thiophenring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer Nitrogruppe, einer C1-C6-Alkylgruppe, einer Pyrazolylgruppe, worin am Pyrazolring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann, und einer Thienylgruppe, worin am Thiophenring ein Halogenatom substituiert sein kann, besteht, substituiert sein kann);

(Ff14) eine Indolylgruppe (worin am Indolring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Phenylsulfonylgruppe, die eine C1-C6-Alkylgruppe als einen Substituenten aufweisen kann, einer Phenyl-C1-C6-alkylgruppe, einer C1-C6-Alkoxy-carbonylgruppe und einer Phenylgruppe besteht, substituiert sein kann);

(Ff15) eine Pyrrolylgruppe (worin am Pyrrolring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Phenylgruppe, worin wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann, und eine C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann, besteht);

(Ff16) eine Coumarylgruppe;

(Ff17) eine Benzoimidazolylgruppe (worin am Benzoimidazolring wenigstens eine Thienylgruppe substituiert sein kann);

(Ff18) eine Oxazolylgruppe (worin am Oxazolring wenigstens eine Phenylgruppe, die ein Halogenatom aufweisen kann, substituiert sein kann);

(Ff19) eine Thiazolylgruppe (worin am Thiazolring wenigstens eine Phenylgruppe substituiert sein kann und ferner worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer Nitrogruppe und einer Phenylgruppe besteht, substituiert sein kann);

(Ff21) eine Chinolylgruppe;

(Ff22) eine 3,4-Dihydrocarbostyrylgruppe (worin am 3,4-Dihydrocarbostyrylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkoxygruppe, einer C1-C6-Alkylgruppe und einer Phenyl-C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann); eine Carbostyrylgruppe (worin am Carbostyrylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkoxygruppe, einer C1-C6-Alkylgruppe und einer Phenyl-C1-C6-alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann);

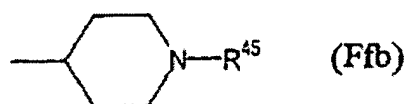
(Ff23) eine Imidazo[2,1-b]thiazolylgruppe;

(Ff24) eine Imidazo[2,1-a]pyridylgruppe;

(Ff25) eine Chromanylgruppe (worin am Chromanring wenigstens eine C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann); oder

(Ff26) eine 2,3-Dihydrobenzofurylgruppe); oder

(Fd39) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Ffb) dargestellt wird:



(worin R^{45} darstellt: eine C1-C6-Alkoxy-carbonylgruppe; eine Phenylgruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; eine aminosubstituierte C1-C6-Alkylgruppe [worin an der Aminogruppe wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Phenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann) und einer C1-C6-Alkylgruppe besteht, substituiert sein kann]; eine Benzoylgruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; eine Phenyl-C1-C6-alkylgruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; eine Phenyl-C1-C6-alkoxy-carbonylgruppe [worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann]; oder eine Phenyl-C2-C6-alkenylgruppe (worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe und einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein kann))];

F12-3) eine Morpholinogruppe;

F12-4) eine Imidazolylgruppe;

F12-5) eine 1,4-Dioxazaspiro[4,5]decylgruppe (worin am 1,4-Dioxazaspiro[4,5]decanring wenigstens eine Oxogruppe substituiert sein kann);

F12-6) eine Homopiperazinylgruppe (worin am Homopiperazinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkoxy-carbonylgruppe, einer Phenyl-C1-C6-alkoxy-carbonylgruppe und einer phenylsubstituierten oder nicht-substituierten Phenylgruppe besteht, substituiert sein kann);

F12-7) eine Piperazinylgruppe (worin am Piperazinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Oxogruppe, einer C1-C6-Alkylgruppe und einer Phenyl-C1-C6-alkylgruppe besteht [worin am Phenylring wenigstens eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe substituiert sein kann] substituiert sein kann);

F12-8) eine Piperidylgruppe (worin am Piperidinring wenigstens eine Oxogruppe substituiert sein kann);

F12-9) eine Pyrrolidinylgruppe (worin am Pyrrolidinring wenigstens eine Phenoxy-C1-C6-alkylgruppe, die eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkoxygruppe als einen Substituenten aufweisen kann, substituiert sein kann); oder

F12-10) eine Isoindolinygruppe; oder ferner

F13) R^{19} und R^{20} können aneinander über Stickstoffatome, die daran benachbart sind, direkt oder durch Heteroatome binden, und somit ein zyklisches Imid oder Amid bilden, das durch eine der folgenden (F13-1) bis (F13-11) dargestellt wird:

(F13-1) eine Succinimidgruppe;

(F13-2) eine Oxazolidinylgruppe (worin am Oxazolidinring wenigstens eine Oxogruppe substituiert sein kann);

(F13-3) eine Benzo-1,3-oxazolidinylgruppe (worin am Benzo-1,3-oxazolidinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Oxogruppe, einem Halogenatom und einer Phenylgruppe besteht, substituiert sein kann);

(F13-4) eine Imidazolidinylgruppe (worin am Imidazolidinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Oxogruppe, einer Phenyl-C1-C6-alkylgruppe [worin am Phenylring 1 bis 3 Gruppen, die aus der Gruppe ausgewählt sind, die aus einem Halogenatom und einer C1-C6-Alkoxygruppe besteht, substituiert sein können] und einer Phenylgruppe besteht, substituiert sein kann);

(F13-5) eine Benzoimidazolidinylgruppe (worin am Benzoimidazolidinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Oxogruppe, einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe, einer Aminogruppe, die eine C1-C6-Alkylgruppe auf einem Substituenten aufweist, einer C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe und einer Piperidylgruppe besteht [worin am Piperidinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe, einer Phenylgruppe, worin am Phenylring 1 bis 3 Halogenatome substituiert sein können, einer C1-C6-Alkoxycarbonylgruppe und einer Phenyl-C1-C6-alkoxycarbonylgruppe besteht, substituiert sein kann) substituiert sein kann;

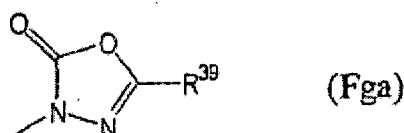
(F13-6) eine Phthalimidgruppe;

(F13-7) eine Indolinygruppe (worin am Indolinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer C1-C6-Alkylgruppe, einem Halogenatom und einer Oxogruppe besteht, substituiert sein kann);

(F13-8) eine 2,3-Dihydrobenzothiazolylgruppe (worin an 2,3-Dihydrobenzothiazolring wenigstens eine Oxogruppe substituiert sein kann);

(F13-9) eine 1H-2,4-Benzoxazinylgruppe (worin am 1H-2,4-Benzoxazinring wenigstens eine Oxogruppe substituiert sein kann);

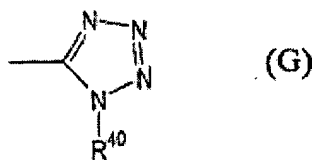
(F13-10) eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (Fga) dargestellt wird:



(worin R^{39} darstellt: ein Wasserstoffatom; eine Phenyl-C1-C6-Alkylgruppe, die als einen Substituenten ein Halogenatom am Phenylring aufweisen kann; eine Phenoxy-C1-C6-Alkylgruppe, die als einen Substituenten ein Halogenatom am Phenylring aufweisen kann; eine Phenyl-C2-C6-alkenylgruppe, die als einen Substituenten ein Halogenatom am Phenylring aufweisen kann; eine Phenylgruppe, worin am Phenylring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einem Halogenatom, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkylgruppe, einer halogensubstituierten oder nicht-substituierten C1-C6-Alkoxygruppe und einer Phenylgruppe besteht, als ein Substituent substituiert sein kann; eine Pyridylgruppe; oder eine Pyrazinylgruppe); oder

(F13-11) eine 1,3-Thiazolidinylgruppe (worin am 1,3-Thiazolidinring wenigstens eines, das aus der Gruppe ausgewählt ist, die aus einer Oxogruppe und einer Phenyl-C1-C6-alkylidengruppe, die eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte C1-C6-Alkylgruppe am Phenylring aufweisen kann, besteht, als ein Substituent substituiert sein kann).

[0055] Eine Gruppe, die durch die allgemeine Formel (G) dargestellt wird:



(worin R^{40} eine C1-C6-Alkylgruppe oder eine halogensubstituierte oder nicht-substituierte Phenylgruppe auf-

weist).

[0056] Die Reaktion zwischen einer Verbindung (10a) oder (10b) und einer Verbindung (11) wird in einem geeigneten Lösemittel oder in keinem Lösemittel durchgeführt, in Anwesenheit oder Abwesenheit einer basischen Verbindung.

[0057] Beispiele eines Lösemittels, das hier verwendet wird, können einschließen: Wasser, Alkohole, wie Methanol, Ethanol, Isopropanol, n-Butanol, oder tert-Butanol; aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Benzol, Toluol, Xylol, Tetralin, o-Chlorbenzol, m-Chlorbenzol oder 2,3-Dichlorbenzol; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan, Dichlorethan, Chloroform oder Tetrachlorkohlenstoff; Ether, wie Diethylether, Dimethoxyethan, Dioxan, Tetrahydrofuran, Diglime oder Dipropylether; gesättigte Kohlenwasserstoffe, wie n-Hexan, n-Butan, Cyclohexan, oder Flüssigparaffin; Ketone, wie Aceton oder Methylethylketon; polare Lösemittel, wie N-N-Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, Hexamethylphosphortriamid, Acetonitril, N-N-Dimethylacetamid oder NMP; und deren gemischte Lösemittel.

[0058] Bekannte anorganische Basen und organische Basen können als basische Verbindungen in einem breiten Umfang verwendet werden.

[0059] Beispiele einer anorganischen Base können einschließen: Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat oder Kaliumcarbonat; Alkalimetallkohlenwasserstoffe, wie Natriumbicarbonat oder Kaliumbicarbonat; Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid oder Kaliumhydroxid; Alkalimetallphosphate, wie Natriumphosphat oder Kaliumphosphat; Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid oder Kaliumhydrid; Alkalimetalle, wie Kalium oder Natrium; Alkalimetallamide, wie Natriumamid; und Alkalimetallalkoholate, wie Natriummethylat, Natriumethylat, oder Natriumtert-butoxid.

[0060] Beispiele einer organischen Base können Acetate, wie Natriumacetat oder Kaliumacetat, Pyridin, Trimethylamin, Triethylamin, Diisopropylethylamin, Dimethylanilin, 1-Methylpyrrolidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethyl-4-aminopyridin, 1,5-Diazabicyclo[4.3.0]nonen-5(DBN), 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undecen-7(DBU) und 1,4-Diazabicyclo[2.2.2]octan (DABCO) einschließen.

[0061] Die Verbindung (11) wird zu 1 mol der Verbindung (10a) oder (10b) in einer Menge von im Allgemeinen wenigstens 1 mol und vorzugsweise zwischen 1 und 5 mol verwendet.

[0062] Die basische Verbindung wird zu 1 mol der Verbindung (10a) oder (10b) in einer Menge im Allgemeinen zwischen 0,1 und 1 mol und vorzugsweise zwischen 0,1 und 0,5 mol verwendet.

[0063] Die Reaktion zwischen der Verbindung (10a) oder (10b) und der Verbindung (11) wird bei einer Temperatur im Allgemeinen zwischen Raumtemperatur und 150°C durchgeführt und vorzugsweise zwischen Raumtemperatur und 120°C. Sie wird im Allgemeinen für 10 Minuten bis 24 Stunden vor der Terminierung durchgeführt.

[0064] Die Reaktion zum Erhalt einer Verbindung (13a) von einer Verbindung (12a) und die Reaktion zum Erhalt einer Verbindung (13b) und einer Verbindung (12b) werden in einem geeigneten Lösemittel oder in keinen Lösemitteln, in Anwesenheit einer basischen Verbindung durchgeführt.

[0065] Alle Lösemittel und basischen Verbindungen, die in der zuvor genannten Reaktion zwischen der Verbindung (10a) oder (10b) und der Verbindung (11) verwendet werden können, können auch hier als Lösemittel und basische Verbindungen verwendet werden.

[0066] Die basische Verbindung wird zu 1 mol der Verbindung (12a) oder (12b) in einer Menge von im Allgemeinen wenigstens 1 mol und vorzugsweise zwischen 1 und 2 mol verwendet.

[0067] Die oben angegebene Reaktion wird bei einer Temperatur im Allgemeinen zwischen 0°C und 150° und vorzugsweise zwischen 0°C und 120° durchgeführt. Sie wird im Allgemeinen für 10 Minuten bis 48 Stunden vor der Terminierung durchgeführt.

[0068] Unter den 4-Nitroimidazolverbindungen, die durch die allgemeine Formel (1) der vorliegenden Erfindung dargestellt werden, können solche mit einer basischen Gruppe leicht zusammen ein Salz mit im Allgemeinen pharmakologisch verträglichen Säuren bilden. Beispiele solcher Säuren können einschließen: anorganische Säuren, wie Schwefelsäure, Salpetersäure, Salzsäure, Phosphorsäure oder Hydrobromsäure und or-

ganische Säuren, wie Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure, Methansulfonsäure, Ethansulfonsäure, Oxalsäure, Maleinsäure, Fumarsäure, Zitronensäure, Succinsäure, Äpfelsäure, Tartarsäure, Malonsäure, Milchsäure oder Benzoesäure.

[0069] Eine betreffende Verbindung, die als ein Ergebnis von jeder der oben angegebenen Reaktionen erhalten wird, wird von der Reaktionsmischung durch herkömmliche Abtrennmittel abgetrennt und kann ferner gereinigt werden. Beispiele solcher Abtrenn- und Reinigungsmittel schließen Destillation, Rekristallisation, Säulenchromatographie, Ionenaustauschchromatographie, Gelchromatographie, Affinitätschromatographie, präparative Dünnschichtchromatographie und das Lösemittlextraktionsverfahren ein.

[0070] Gemäß der vorliegenden Erfindung kann die betreffende Verbindung, die durch die allgemeine Formel (1) dargestellt wird, hergestellt werden, ohne den Zustand eines Intermediats zu durchlaufen, der die Gefahr einer Explosion aufweist.

[0071] Das Herstellungsverfahren der vorliegenden Erfindung schließt einfache Vorgänge ein und benötigt kein kompliziertes Reinigungsverfahren.

[0072] Gemäß dem Herstellungsverfahren der vorliegenden Erfindung kann die betreffende 4-Nitroimidazol-Verbindung, die durch die allgemeine Formel (1) dargestellt wird, ökonomisch mit einer hohen Ausbeute und mit einer hohen Reinheit hergestellt werden.

[0073] Dementsprechend ist das Verfahren der vorliegenden Erfindung industriell äußerst vorteilig.

[0074] Die vorliegende Erfindung wird nun in den folgenden Beispielen spezieller beschrieben.

Vergleichsbeispiel 1

Herstellung von 2,5-Dibrom-4-nitroimidazol

[0075] Eine Mischung, die aus 4-Nitroimidazol (100 g, 884 mmol), Natriumbicarbonat (164 g, 1,94 mol) und Wasser (500 ml) besteht, wurde intensiv gerührt und danach wurde Brom (106 ml, 2,07 mol) tropfenweise zu der Mischung bei Raumtemperatur (23°C bis 25°C) in einem Verlauf von 6 Stunden zugegeben (wobei es während dem Zutropfen intensiv schäumte).

[0076] Die so erhaltene Mischung wurde ferner unter Erwärmen gerührt (50°C bis 55°C, 4 Stunden). Danach wurde Wasser (400 ml) und konzentrierte Salzsäure (80 ml) unter Eiskühlung (10°C oder weniger) dazugegeben und die erhaltene Mischung wurde für 1 Stunde gerührt. Kristalle wurden durch Filtration gesammelt. Die erhaltenen Kristalle wurden mit Wasser (auf einem Filterpapier, mit 400 ml Wasser) gewaschen, fein verteilt gewaschen (mit 800 ml Wasser, zweimal) und luftgetrocknet (50°C, 16 Stunden).

Ausbeute: 213 g (Ausbeute: 88,9 %) blassgelbe Kristalle

IR (KBr): 3074, 1548, 1468, 1392, 1361, 1345, 1310, 1259, 1172, 1066, 975, 830, 667 cm⁻¹.

Vergleichsbeispiel 2

Herstellung von 2,5-Dichlor-4-nitroimidazol

[0077] Eine Mischung, die aus 2,5-Dibrom-4-nitroimidazol (27,1 g, 100 mmol) und konzentrierter Salzsäure (434 ml) besteht, wurde unter Erwärmen (77°C bis 80°C, 16 Stunden) gerührt. Die Reaktionsmischung ließ man abkühlen und anschließend wurde unter Eiskühlung (5°C bis 10°C, 2 Stunden) gerührt. Anschließend wurden die ausgefällten Kristalle durch Filtration gesammelt und luftgetrocknet (50°C, 5 Stunden). Die Ausbeute des getrockneten Produkts betrug 8,26 g.

[0078] Das Filtrat wurde ferner mit Ethylacetat (300 ml) extrahiert und anschließend getrocknet (MgSO₄), gefolgt von einer Vakuumkonzentration und Trocknung. Die Ausbeute des getrockneten Produkts betrug 9,63 g. Somit wurden 17,9 g (Gesamtsumme) von 2,5-Dichlor-4-nitroimidazol erhalten (Ausbeute: 98,3 %).

IR (KBr): 1566, 1475, 1403, 1366, 1332, 1272, 1190, 1091, 996, 834, 679 cm⁻¹.

MS (70 eV) m/z (relative Intensität): 183 (15, M⁺), 181 (25), 108 (28), 74 (42), 62 (100).

Beispiel 1

Herstellung von 2-Chlor-5-iod-4-nitroimidazol

[0079] Eine Suspension, die aus 2,5-Dichlor-4-nitroimidazol (7,66 g, 42,1 mmol), Natriumiodid (75,7 g, 505 mmol) und Wasser (77 ml) besteht, wurde unter Rückfluss erwärmt (102°C, 35 Stunden). Die Reaktionsmischung wurde auf Raumtemperatur abgekühlt. Anschließend wurden Kristalle mittels Filtration gesammelt, mit Wasser gewaschen (auf einem Filterpapier, 77 ml) und dann luftgetrocknet (50°C, 20 Stunden).

Ausbeute: 9,36 g (Ausbeute: 81,3 %), blassgelbe Kristalle

IR (KBr): 3199, 1538, 1468, 1394, 1346, 1300, 1262, 1166, 1049, 986, 831, 756, 734, 674 cm⁻¹

MS (70 eV) m/z (relative Intensität): 274 (34, M⁺), 273 (100), 166 (35), 154 (80).

Beispiel 2

Herstellung von 2-Brom-5-iod-4-nitroimidazol

[0080] Eine Suspension, die aus 2,5-Dibrom-4-nitroimidazol (27,1 g, 100 mmol), Natriumiodid (150 g, 1,00 mol) und Wasser (271 ml) besteht, wurde unter Rückfluss erwärmt (102°C, 15 Stunden). Die Reaktionsmischung wurde auf Raumtemperatur abgekühlt. Anschließend wurden Kristalle durch Filtration gesammelt, mit Wasser gewaschen (auf einem Filterpapier, 270 ml) und dann luftgetrocknet (50°C, 20 Stunden).

Ausbeute: 29,0 g (Ausbeute: 91 %), blassgelbe Kristalle

IR (KBr): 3218, 1537, 1456, 1386, 1336, 1288, 1250, 1156, 1048, 969, 829, 756, 731, 665 cm⁻¹

MS (70 eV) m/z (relative Intensität): 319 (80, M⁺), 317 (82), 154 (100), 106 (78).

Beispiel 3

Herstellung von 2-Brom-5-iod-4-nitroimidazol

[0081] Eine Suspension, die aus 2,5-Dibrom-4-nitroimidazol (2,71 g, 10,0 mmol), Natriumiodid (15,0 g, 100 mmol), Tetrabutylammoniumiodid (185 mg, 0,50 mmol) und Wasser (27 ml) besteht, wurde unter Erwärmen (80°C bis 85°C, 27 Stunden) gerührt. Die Reaktionsmischung wurde auf Raumtemperatur abgekühlt. Anschließend wurden Kristalle durch Filtration gesammelt, mit Wasser gewaschen (auf einem Filterpapier, 27 ml) und anschließend luftgetrocknet (50°C, 18 Stunden).

Ausbeute: 2,71 g (Ausbeute: 85,3 %), blassgelbe Kristalle

IR (KBr): 3218, 1537, 1456, 1386, 1336, 1288, 1250, 1156, 1048, 969, 829, 756, 731, 665 cm⁻¹

MS (70 eV) m/z (relative Intensität): 319 (80, M⁺), 317 (82), 154 (100), 106 (78).

Beispiel 4

Herstellung von 2-Brom-5-iod-4-nitroimidazol

[0082] Eine Suspension, die aus 2,5-Dibrom-4-nitroimidazol (2,71 g, 10,0 mmol), Natriumiodid (15,0 g, 100 mmol), Wasser (27 ml) und einer 57 %igen wässrigen Iodwasserstoffsäurelösung (5,4 ml) besteht, wurde unter Erwärmen gerührt (50°C bis 60°C, 56 Stunden). Die Reaktionsmischung wurde auf Raumtemperatur abgekühlt. Anschließend wurden Kristalle durch Filtration gesammelt, mit Wasser gewaschen (auf einem Filterpapier, 27 ml) und dann luftgetrocknet (50°C, 15 Stunden).

Ausbeute: 2,43 g (Ausbeute: 76,4 %), blassgelbe Kristalle IR (KBr): 3218, 1537, 1456, 1386, 1336, 1288, 1250, 1156, 1048, 969, 829, 756, 731, 665 cm⁻¹

MS (70 eV) m/z (relative Intensität): 319 (80, M⁺), 317 (82), 154 (100), 106 (78).

Beispiel 5

Herstellung von 2-Brom-5-iod-4-nitroimidazol

[0083] Eine Suspension, die aus 2,5-Dibrom-4-nitroimidazol (2,71 g, 10,0 mmol), Wasser (13,6 ml) und einer 57 %igen wässrigen Iodwasserstoffsäurelösung (13,6 ml) besteht, wurde unter Erwärmen (50°C bis 60°C, 36 Stunden) gerührt. Die Reaktionsmischung wurde auf Raumtemperatur abgekühlt. Anschließend wurden Kristalle durch Filtration gesammelt, mit Wasser gewaschen (auf einem Filterpapier, 27 ml) und anschließend luftgetrocknet (50°C, 15 Stunden).

Ausbeute: 1,11 g (Ausbeute: 34,9 %), blassgelbe Kristalle

IR (KBr): 3218, 1537, 1456, 1386, 1336, 1288, 1250, 1156, 1048, 969, 829, 756, 731, 665 cm^{-1}
 MS (70 eV) m/z (relative Intensität): 319 (80, M^+), 317 (82), 154 (100), 106 (78).

Beispiel 6.

Herstellung von 2-Chlor-4-nitroimidazol

[0084] Eine Mischung, die aus 2-Chlor-5-iod-4-nitroimidazol (273 mg, 1,00 mmol), Ethanol (2,7 ml), Triethylamin (443 mg, 3,00 mmol) und Platinoxid (2,9 mg, 1,1 Gew.%) besteht, wurde unter Normaldruck in einer Wasserstoffatmosphäre bei Raumtemperatur für 2 Stunden gerührt. Das Filtrat wurde konzentriert und unter vermindertem Druck getrocknet und der Rückstand wurde anschließend in Ethylacetat (30 ml) aufgelöst. Die organische Schicht wurde mit 3 % verdünnter Salzsäure (10 ml) und mit gesättigter Saline (5 ml, zweimal) gewaschen und anschließend getrocknet (MgSO_4), mit anschließender Vakuumkonzentration und Trocknung.

Ausbeute: 144 mg (Ausbeute: 97,6 %)

IR (KBr): 1556, 1510, 1472, 1404, 1375, 1358, 1193, 1093, 998, 979, 822, 753, 679, 595, 523 cm^{-1}

NMR (DMSO-d_6) δ ppm: 8,40 (s, 1H), 14,2 (br, s, 1H).

Beispiel 7

Herstellung von 2-Brom-4-nitroimidazol

[0085] Eine Mischung, die aus 2-Brom-5-iod-4-nitroimidazol (607 mg, 2,00 mmol), Ethanol (6,4 ml), Triethylamin (607 mg, 6,00 mmol) und Platinoxid (3,4 mg, 0,53 Gew.%) besteht, wurde unter Normaldruck in einer Wasserstoffatmosphäre bei Raumtemperatur für 3 Stunden gerührt. Das Filtrat wurde konzentriert und unter vermindertem Druck getrocknet und der Rückstand wurde anschließend in Ethylacetat (50 ml) aufgelöst. Die organische Schicht wurde mit 3 % verdünnter Salzsäure (10 ml) und gesättigter Saline (10 ml, zweimal) gewaschen und anschließend getrocknet (MgSO_4), gefolgt von einer Vakuumkonzentration und Trocknung.

Ausbeute: 365 mg (Ausbeute: 95,1 %)

IR (KBr): 1548, 1514, 1453, 1392, 1373, 1258, 1168, 1085, 968, 823, 799, 751, 668 cm^{-1}

NMR (DMSO-d_6) δ ppm: 8,45 (s, 1H), 14,1 (br, s, 1H).

Beispiel 8

Herstellung von 2-Brom-4-nitroimidazol

[0086] Eine Mischung, die aus 2-Brom-5-iod-4-nitroimidazol (636 mg, 2,00 mmol), Ethanol (6,4 ml), Triethylamin (607 mg, 6,00 mmol) und 2 % Pd-Aluminiumoxid (95,4 mg, 15 Gew.%) besteht, wurde unter Normaldruck in einer Wasserstoffatmosphäre bei 50°C bis 60°C für 15 Stunden gerührt. Das Filtrat wurde konzentriert und unter vermindertem Druck getrocknet und der Rückstand wurde anschließend in Ethylacetat (50 ml) aufgelöst. Die organische Schicht wurde mit 3 % verdünnter Salzsäure (10 ml) und gesättigter Saline (10 ml, zweimal) gewaschen und anschließend getrocknet (MgSO_4), gefolgt von einer Vakuumkonzentration und Trocknung.

Ausbeute: 364 mg (Ausbeute: 94,8 %)

IR (KBr): 1548, 1514, 1453, 1392, 1373, 1258, 1168, 1085, 968, 823, 799, 751, 668 cm^{-1}

NMR (DMSO-d_6) δ ppm: 8,45 (s, 1H), 14,1 (br, s, 1H).

Beispiel 9

Herstellung von 2-Brom-4-nitroimidazol

[0087] Eine Mischung, die aus 2-Brom-5-iod-4-nitroimidazol (1,27 g, 4,00 mmol), Ethanol (13 ml), Triethylamin (1,21 g, 12,0 mmol) und 2 % Pd-Aluminiumoxid (191 mg, 15 Gew.%) besteht, wurde gerührt, während Druck (3 bis 4 Atmosphären) in einer Wasserstoffatmosphäre bei Raumtemperatur für 14 Stunden angelegt wurde. Das Filtrat wurde konzentriert und unter vermindertem Druck getrocknet und der Rückstand wurde anschließend in Ethylacetat (100 ml) aufgelöst. Die organische Schicht wurde 3 % verdünnter Salzsäure (30 ml) und gesättigter Saline (20 ml, zweimal) gewaschen und anschließend getrocknet (MgSO_4), gefolgt von einer Vakuumkonzentration und Trocknung.

Ausbeute: 761 mg (Ausbeute: 99,1 %)

IR (KBr): 1548, 1514, 1453, 1392, 1373, 1258, 1168, 1085, 968, 823, 799, 751, 668 cm^{-1}

NMR (DMSO-d_6) δ ppm: 8,45 (s, 1H), 14,1 (br, s, 1H).

Beispiel 10

Herstellung von 2-Brom-4-nitroimidazol

[0088] Tetra-n-butyl-ammoniumborhydrid (602 mg, 2,34 mmol) wurde zu einer Lösung zugegeben, die durch Auflösen von 2-Brom-5-iod-4-nitroimidazol (186 mg, 0,585 mmol) in getrocknetem Dioxan (2,8 ml) erhalten wurde, zugegeben. Die erhaltene Mischung wurde bei 60°C für 28 Stunden gerührt. Die Reaktionsmischung wurde auf Raumtemperatur abgekühlt und wurde in 10 % verdünnte Salzsäure (10 ml) gegossen. Das Reaktionsprodukt wurde mit Ethylacetat extrahiert und die Ethylacetatextraktlösung (40 ml) wurde getrocknet (MgSO_4), gefolgt von einer Vakuumkonzentration und Trocknung. Ausbeute: 86 mg (Ausbeute: 76,6 %). IR (KBr): 1548, 1514, 1453, 1392, 1373, 1258, 1168, 1085, 968, 823, 799, 751, 668 cm^{-1} . NMR (DMSO-d_6) δ ppm: 8,45 (s, 1H), 14,1 (br, s, 1H).

Beispiel 11

Herstellung von 2-Brom-4-nitroimidazol

[0089] Eine Mischung, die aus 2-Brom-5-iod-4-nitroimidazol (2,43 g, 7,64 mmol), Isopropylalkohol (12,2 ml), Wasser (2,4 ml), Triethylamin (2,32 g, 22,9 mmol) und 5 % Pd-Aluminiumoxid (12,2 mg) besteht, wurde gerührt, während Druck (3 bis 4 Atmosphären) in einer Wasserstoffatmosphäre bei 60°C für 3 Stunden angelegt wurde. Das Filtrat wurde konzentriert und unter vermindertem Druck getrocknet und das entstandene Produkt wurde anschließend in Wasser (10 ml) aufgelöst. Die so erhaltene Lösung wurde mit aktiviertem Kohlenstoff (243 mg) (der bei Raumtemperatur für 1 Stunde gerührt wurde) behandelt. Das Filtrat wurde unter Eiskühlung gerührt und 35 %ige konzentrierte Salzsäure (0,7 ml) wurde derart dazugegeben, dass der pH-Wert der Lösung 2 wurde. Die so erhaltene Lösung wurde ferner unter Eiskühlung für 1 Stunde gerührt. Anschließend wurden die ausgefallenen Kristalle durch Filtration gesammelt und anschließend bei 50°C für 16 Stunden getrocknet.

Ausbeute: 1,14 g (Ausbeute: 77,7 %)

NMR (DMSO-d_6) δ ppm: 8,42 (s, 1H), 14,1 (br, s, 1H).

Beispiel 12

Herstellung von 2-Brom-4-nitroimidazol

[0090] 2-Brom-5-iod-4-nitroimidazol (1,00 g, 3,15 mmol) wurde in Dimethylformamid (8 ml) und Wasser (3 ml) aufgelöst. Die erhaltene Lösung wurde unter Eiskühlung gerührt und anschließend wurde eine 50 % bis 55 % wässrige Ammoniumbisulfitlösung (3,6 ml, 23,5 ml mit einem Gehalt von 52,5 %) dazugegeben. Die erhaltene Mischung wurde bei Raumtemperatur für 3 Tage gerührt. Anschließend wurde kaltes Wasser (30 ml) zu dem Reaktionsprodukt zugegeben, gefolgt von einer dreimaligen Extraktion mit Ethylacetat (167 ml in der Gesamtsumme). Die organische Schicht wurde mit 5 % Saline gewaschen und anschließend getrocknet (MgSO_4), gefolgt von einer Vakuumkonzentration und Trocknung.

Ausbeute: 375 mg (Ausbeute: 62,1 %)

NMR (DMSO-d_6) δ ppm: 8,44 (s, 1H), 14,1 (br, s, 1H).

Beispiel 13

Herstellung von 2-Brom-4-nitroimidazol

[0091] 2-Brom-5-iod-4-nitroimidazol (1,54 g, 4,84 mmol) wurde in Dimethylformamid (12,3 ml) und Wasser (6,2 ml) aufgelöst. Anschließend wurde Natriumsulfit (1,22 g, 9,70 mmol) zu der erhaltenen Lösung zugegeben. Die Mischung wurde auf eine Temperatur zwischen 40°C und 60°C erwärmt und anschließend bei der Temperatur für 20 Stunden gerührt. Anschließend wurde Natriumsulfit (2,44 g, 19,4 mmol) ferner zu der Reaktionslösung zugegeben und die erhaltene Mischung wurde bei 60°C für 15 Stunden gerührt. Die Reaktionsmischung wurde auf Raumtemperatur abgekühlt und anschließend wurde verdünnte Salzsäure dazugegeben, gefolgt von einer Extraktion mit Ethylacetat (dreimal, 200 ml in der Gesamtsumme). Die organische Schicht wurde getrocknet (MgSO_4) und Wasser (10 ml) wurde zu dem ölartigen Rückstand, der durch Konzentrierung erhalten wurde, zugegeben. Die ausgefallenen Kristalle wurden durch Filtration gesammelt und anschließend bei 60°C für 15 Stunden getrocknet.

Ausbeute: 349 mg (Ausbeute: 37,5 %)

IR (KBr): 3201, 3146, 1547, 1514, 1452, 1391, 1373, 1356, 1258, 1167, 1084, 968, 823, 798, 750, 668 cm^{-1}

NMR (DMSO-d₆) δ ppm: 8,43 (s, 1H), 14,1 (br, s, 1H).

Beispiele 14 bis 19

[0092] 2-Brom-4-nitroimidazol wurde auf die gleiche Weise wie bei Beispiel 12 hergestellt mit den Ausnahmen, dass die Sulfite und Lösemittel, die in Tabelle 1 unten angegeben sind, verwendet wurden, und dass die Reaktionstemperatur und die Reaktionszeit bestimmt wurde, wie es in Tabelle 1 unten angegeben ist. Die Ausbeuten von 2-Brom-4-nitroimidazol sind auch in Tabelle 1 gezeigt. In der Tabelle ist die Menge des verwendeten Sulfits (mol) ein Wert, der unter Verwendung von 1 mol 2-Brom-5-iod-4-nitroimidazol als ein Standard bestimmt wird. Zusätzlich wurde die Menge eines Lösemittels (Dimethylformamid) (DMF), Wasser oder 1-Methyl-2-pyrrolidinon (NMP)) als ein Wert verwendet, der unter Verwendung von 1 mmol 2-Brom-5-iod-4-nitroimidazol als ein Standard bestimmt wurde.

[Tabelle 1]

Beispiel No.	Sulfit (mol)	Lösemittel (ml)	Reaktionstemperatur (°C)	Reaktionszeit (Stunde)	Ausbeute (%)
14	Natriumsulfit (6,0 mol)	DMF 2,4 ml Wasser 0,8 ml	65–70	31	40,0
15	Natriumbisulfit (4,6 mol)	DMF 2,5 ml Wasser 1,3 ml	50	20	47,6
16	Natriumpyrosulfit (4,0 mol)	DMF 2,5 ml Wasser 1,3 ml	50	24	43,9
17	Ammoniumsulfidmonohydrat (4,0 mol)	DMF 2,5 ml Wasser 1,3 ml	50	18	49,5
18	50 % bis 55 % wässrige Ammoniumbisulfitlösung (7,4 mol)	DMF 2,5 ml Wasser 1,0 ml	25	96	62,1
19	50 % bis 55 % wässrige Ammoniumbisulfitlösung (7,3 mol)	NMP 1,6 ml	25	72	65,9

Beispiel 20

Herstellung von 2-Brom-5-iod-4-nitroimidazol

[0093] Eine Mischung, die aus 2,5-Dibrom-4-nitroimidazol (108,3 g, 400 mmol), Ethanol (184 ml), Natriumiodid (120 g, 800 mmol) besteht, wurde in einem Argonstrom (65–70°C, 26 Stunden) bis zum Rückfluss erwärmt. Die Reaktionsmischung wurde auf Raumtemperatur abgekühlt und das ausgefällte anorganische Salz wurde durch Filtration entfernt. 78 % (234 ml) des Filtrats (300 ml) wurde konzentriert und unter vermindertem Druck (25–50°C) getrocknet. Der Rückstand (braunes Öl, 172 g) wurde in gekühltem Wasser (422 ml) suspendiert und konzentrierte Salzsäure (10 ml) wurde derart dazugegeben, dass der pH-Wert der Lösung 1 bis 2 wurde. Die so erhaltene Lösung wurde ferner unter Kühlen auf Eis für 2 Stunden gerührt. Anschließend wurden die ausgefällten Kristalle durch Filtration gesammelt und dann bei 50°C für 24 Stunden getrocknet.

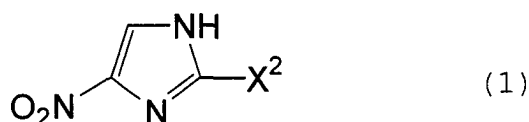
Ausbeute: 89,2 g (Ausbeute: 89,9 %), blassgelbe Kristalle

IR (KBr): 3218, 1537, 1456, 1386, 1336, 1288, 1250, 1156, 1048, 969, 829, 756, 731, 665 cm⁻¹

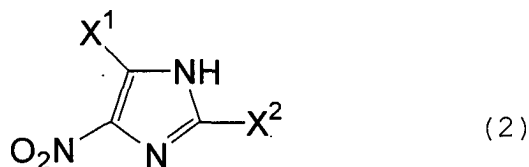
MS (70 eV) m/z (relative Intensität): 319 (80, M⁺), 317 (82), 154 (100), 106 (78).

Patentansprüche

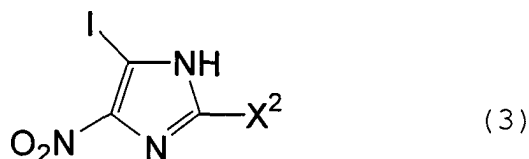
1. Verfahren zur Herstellung einer 4-Nitroimidazolverbindung, die durch die allgemeine Formel (1) dargestellt wird:



wobei X^2 ein Chloratom oder ein Bromatom darstellt,
umfassend Iodieren einer durch die allgemeine Formel (2) dargestellten 4-Nitroimidazolverbindung:



wobei jedes von X^1 und X^2 ein Chloratom oder ein Bromatom darstellen,
und dann Reduzieren der erhaltenen 5-Iod-4-nitroimidazolverbindung, die durch die allgemeine Formel (3) dargestellt wird:



wobei X^2 das gleiche wie oben definiert ist.

2. Herstellungsverfahren gemäß Anspruch 1, wobei ein iodierendes Mittel ein Halogenmolekül, Iodwasserstoffsäure oder ein Metallsalz der Iodwasserstoffsäure ist.

3. Herstellungsverfahren gemäß Anspruch 2, wobei das Metallsalz der Iodwasserstoffsäure Natriumiodid, Kaliumiodid, Lithiumiodid, Zinkiodid, Magnesiumiodid oder Aluminiumiodid ist.

4. Herstellungsverfahren gemäß Anspruch 3, wobei das iodierende Mittel auf die Verbindung (2) in einem molaren Verhältnis zwischen 1,5:1 und 15:1 angewendet wird und das iodierende Mittel Natriumiodid ist.

5. Herstellungsverfahren gemäß Anspruch 1, wobei die Reaktion in Gegenwart eines Phasentransferkatalysators durchgeführt wird.

6. Herstellungsverfahren gemäß Anspruch 5, wobei der Phasentransferkatalysator auf die Verbindung (2) in einem molaren Verhältnis zwischen 0,01:1 und 1:1 angewendet wird und der Phasentransferkatalysator ein quartäres Ammoniumsalz, Phosphoniumsalz oder Pyridiniumsalz ist.

7. Herstellungsverfahren gemäß Anspruch 1, wobei das Reduktionsmittel ein Hydrierungsreduktionsmittel ist und das Reduktionsmittel auf die Verbindung (3) in einem molaren Verhältnis zwischen 1:1 und 10:1 angewendet wird.

8. Herstellungsverfahren gemäß Anspruch 1, wobei das Reduktionsmittel ein katalytisches Hydrierungsreduktionsmittel ist und das Reduktionsmittel auf die Verbindung (3) in einem Gewichtsverhältnis zwischen 0,1 Gew.% und 40 Gew.% angewendet wird.

9. Herstellungsverfahren gemäß Anspruch 8, wobei die Reaktion in Gegenwart von Triethylamin, Trimethylamin oder N-Ethyl-diisopropylamin durchgeführt wird.

Es folgt kein Blatt Zeichnungen