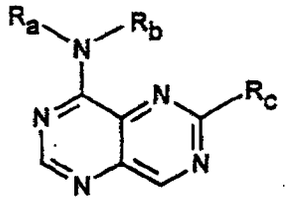
Pyrimido[5,4-d]pyrimidine, diese Verbindungen enthaltende Arzneimittel, deren Verwendung und Verfahren zu ihrer Herstellung

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Pyrimido[5,4-d]pyrimidine der allgemeinen Formel



, (I)

deren Tautomeren, deren Stereoisomere und deren Salze, insbesonders deren physiologisch verträgliche Salze mit anorganischen oder organischen Säuren oder Basen, welche wertvolle pharmakologische Eigenschaften aufweisen, insbesondere eine Hemmwirkung auf die durch Tyrosinkinasen vermittelte Signaltransduktion, deren Verwendung zur Behandlung von Krankheiten, insbesondere von Tumorerkrankungen, und deren Herstellung.

In der obigen allgemeinen Formel I bedeutet

R_a ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe,

R_b eine durch die Reste R_1 bis R_3 substituierte Phenylgruppe, wobei

R_1 und R_2, die gleich oder verschieden sein können, jeweils ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom,

eine C_{1-6}-Alkyl-, Hydroxy- oder C_{1-6}-Alkoxygruppe,

eine C_{3-7}-Cycloalkyl- oder C_{4-7}-Cycloalkoxygruppe, die jeweils durch eine oder zwei Alkylgruppen oder durch eine Arylgruppe substituiert sein können,

eine gegebenenfalls durch eine Arylgruppe substituierte C_{2-5}-Alkenyl- oder C_{3-5}-Alkenyloxygruppe, wobei der Vinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine gegebenenfalls durch eine Arylgruppe substituierte C_{2-5}-Alkinyl- oder C_{3-5}-Alkinyloxygruppe, wobei der Ethinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine Aryl-, Aryloxy-, Aralkyl-, Aralkoxy-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Alkylsulfonyloxy-, Trifluormethylsulfenyl-, Trifluormethylsulfinyl-, Trifluormethylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylsulfenyl-, Aralkylsulfinyl- oder Aralkylsulfonylgruppe,

eine durch 1 bis 3 Fluoratome substituierte Methyl- oder Methoxygruppe,

eine durch 1 bis 5 Fluoratome substituierte C_{2-4}-Alkyl- oder C_{2-4}-Alkoxygruppe,

eine Nitro-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, C_{3-7}-Cycloalkylamino-, N-Alkyl-C_{3-7}-cycloalkylamino-, Arylamino-, N-Alkyl-arylamino-, Aralkylamino- oder N-Alkyl-aralkylaminogruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 4- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 5- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen jeweils durch eine Carbonylgruppe oder in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkyl-

carbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein können,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte (Alkylenimino)carbonyl- oder (Alkylenimino)sulfonylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Arylcarbonylamino-, N-Alkyl-arylcarbonylamino-, Arylsulfonylamino-, N-Alkyl-arylsulfonylamino-, Aralkylcarbonylamino-, N-Alkyl-aralkylcarbonylamino-, Aralkylsulfonylamino-, N-Alkyl-aralkylsulfonylamino-, Perfluoralkylsulfonylamino-, N-Alkyl-perfluoralkylsulfonylamino-, Alkylcarbonyl-, Arylcarbonyl-, Aralkylcarbonyl-, Aryl-hydroxymethyl-, Aralkyl-hydroxymethyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aralkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Arylaminocarbonyl-, N-Alkyl-arylaminocarbonyl-, Aralkylaminocarbonyl-, N-Alkyl-aralkylaminocarbonyl-, N-Hydroxy-aminocarbonyl-, N-Hydroxy-alkylaminocarbonyl-, N-Alkoxy-aminocarbonyl-, N-Alkoxy-alkylaminocarbonyl-, Cyano-, Azido-, N-Cyano-amino- oder N-Cyano-alkylaminogruppe,

eine Sulfo-, Alkoxysulfonyl-, Aminosulfonyl-, Alkylaminosulfonyl-, Dialkylaminosulfonyl-, Arylaminosulfonyl-, N-Alkyl-arylaminosulfonyl-, Aralkylaminosulfonyl- oder N-Alkyl-aralkylaminosulfonylgruppe,

eine Phosphono-, O-Alkyl-phosphono-, O,O'-Dialkyl-phosphono-, O-Aralkyl-phosphono- oder O,O'-Diaralkyl-phosphonogruppe,

eine durch R_4 substituierte Alkyl-oder Alkoxygruppe, wobei

R_4 eine Hydroxy-, Alkoxy-, Aryloxy-, Aralkoxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylsulfenyl-, Aralkylsulfinyl-, Aralkylsulfonyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl- oder Cyanogruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 4- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 5- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen durch eine Carbonylgruppe oder in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein können, oder

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte (Alkylenimino)carbonylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann, darstellt,

R_3 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Alkyl-, Alkoxy- oder Trifluormethylgruppe oder

R_2 zusammen mit R_3, sofern diese an benachbarte Kohlenstoffatome gebunden sind, auch eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Alkylgruppen substituierte Methylendioxygruppe, eine gegebenenfalls durch ein oder zwei Alkylgruppen substituierte n-C_{3-6}-Alkylengruppe oder eine gegebenenfalls durch ein oder zwei

Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome, durch eine oder zwei Hydroxy-, Alkyl-, Alkoxy-, Trifluormethyl- oder Cyangruppen substituierte 1,3-Butadien-1,4-diylengruppe, wobei die Substituenten gleich oder verschieden sein können, oder

R_a zusammen mit R_1, sofern R_1 in o-Stellung zu dem durch R_a substituierten Stickstoffatom steht, auch eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Alkylgruppen substituierte n-C_{2-4}-Alkylengruppe darstellen, und

R_c ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom,

eine Alkyl-, C_{3-7}-Cycloalkyl-, C_{3-7}-Cycloalkyl-C_{1-3}-alkyl-, Aryl-, Aralkyl-, Hydroxy-, Aryloxy-, Aralkoxy-, Mercapto-, C_{1-8}-Alkylsulfenyl-, C_{1-8}-Alkylsulfinyl-, C_{1-8}-Alkylsulfonyl-, C_{4-7}-Cycloalkylsulfenyl-, C_{4-7}-Cycloalkylsulfinyl-, C_{4-7}-Cycloalkylsulfonyl-, C_{3-7}-Cycloalkyl-C_{1-3}-alkylsulfenyl-, C_{3-7}-Cycloalkyl-C_{1-3}-alkylsulfinyl-, C_{3-7}-Cycloalkyl-C_{1-3}-alkylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylsulfenyl-, Aralkylsulfinyl- oder Aralkylsulfonylgruppe,

eine C_{1-8}-Alkoxygruppe, die durch eine Alkoxycarbonyl-, Cyano-, Carboxy-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl- oder Dialkylaminocarbonylgruppe substituiert sein kann,

eine C_{2-8}-Alkoxygruppe, die durch eine Hydroxy-, Alkoxy-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-N-(alkylcarbonyl)amino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-N-(alkylsulfonyl)amino-, Alkoxycarbonylamino- oder N-Alkyl-N-(alkoxycarbonyl)aminogruppe, durch eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 5- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 5- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen jeweils durch eine Carbonylgruppe und zusätzlich in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff-

oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Formyl-imino-, N-Dialkylaminocarbonyl-imino-, N-Alkoxycarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann, substituiert ist,

eine durch zwei Hydroxy- oder Alkoxygruppen substituierte C_{3-8}-Alkoxygruppe,

eine durch eine C_{3-7}-Cycloalkylgruppe substituierte C_{1-8}-Alkoxygruppe, wobei der Cycloalkylteil jeweils durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituiert sein kann und wobei in den vorstehend erwähnten C_{4-7}-Cycloalkylteilen jeweils eine Methylengruppe durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkoxycarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Hydroxygruppen oder durch eine Alkoxy-, Alkoxycarbonyl-, Cyano-, Carboxy-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-N-(alkylcarbonyl)amino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-N-(alkylsulfonyl)amino-, Alkoxycarbonylamino- oder N-Alkyl-N-(alkoxycarbonyl)aminogruppe substituierte C_{4-7}-Cycloalkoxygruppe, wobei in den vorstehend erwähnten C_{5-7}-Cycloalkoxygruppen jeweils eine Methylengruppe durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkoxycarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine gegebenenfalls durch eine Arylgruppe oder C_{3-7}-Cycloalkylgruppe substituierte C_{3-8}-Alkenyloxygruppe, wobei der Vinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine gegebenenfalls durch eine Arylgruppe oder C_{3-7}-Cycloalkylgruppe substituierte C_{3-8}-Alkinyloxygruppe, wobei der Ethinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder 1 bis 2 Arylgruppen substituierte 4- bis 8-gliedrige Alkyleniminogruppe, die zusätzlich durch den Rest R_5 substituiert sein kann, wobei

R_5 eine Aryl-, Aralkyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Cyano-, Hydroxy-, Alkoxy-, Aryloxy-, Aralkoxy-, Alkylcarbonyloxy-, Arylcarbonyloxy-, Amino-, Alkylamino-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, Dialkylamino-, Cyanamino-, Formylamino-, N-(Alkyl)-N-(hydroxy-C_{2-4}-alkyl)amino- oder Bis-(hydroxy-C_{2-4}-alkyl)aminogruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte (Alkylenimino)carbonylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder eine Hydroxyalkylgruppe substituierte 4- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 5- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen durch eine Carbonylgruppe ersetzt sein können,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder eine Hydroxyalkylgruppe substituierte 6- oder 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung des Alkyleniminoteils durch ein Sauerstoff- oder

Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkylimino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Arylimino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt ist und zusätzlich im Alkyleniminoteil der vorstehend erwähnten Gruppen jeweils eine oder zwei der zu den Stickstoffatomen benachbarten Methylengruppen durch eine Carbonylgruppe ersetzt sein können,

eine durch eine Hydroxy-, Alkoxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-,Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino- oder eine Hydroxyalkylgruppe substituierte 4- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe,

eine Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Arylcarbonylamino-, N-Alkyl-arylcarbonylamino-, Arylsulfonylamino-, N-Alkyl-arylsulfonylamino-, Aralkylcarbonylamino-, N-Alkyl-aralkylcarbonylamino-, Aralkylsulfonylamino-, N-Alkyl-aralkylsulfonylamino-, Alkoxycarbonylamino-, N-Alkyl-alkoxycarbonylamino-, Aralkoxycarbonylamino- oder N-Alkyl-aralkoxycarbonylaminogruppe,

eine $(NR_7R_8)CONR_6$- oder $(NR_7R_8)SO_2NR_6$-Gruppe, in denen

R_6, R_7 und R_8, die gleich oder verschieden sein können, jeweils ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe oder R_6 und R_7 zusammen eine n-C_{2-4}-Alkylengruppe und R_8 ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe darstellen,

eine Carboxyalkyl-, Alkoxycarbonylalkyl-, Aminocarbonylalkyl-, Alkylaminocarbonylalkyl- oder Dialkylaminocarbonylalkylgruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte (Alkylenimino)carbonylalkylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Me-

thylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine (Carboxyalkyl)oxy-, (Alkoxycarbonylalkyl)oxy-, (Aminocarbonylalkyl)oxy-, (Alkylaminocarbonylalkyl)oxy- oder (Dialkylaminocarbonylalkyl)oxy-gruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte [(Alkylenimino)carbonylalkyl]oxy-gruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine Cyanoalkyl-, Hydroxyalkyl-, Alkoxyalkyl-, Aryloxyalkyl-, Aminoalkyl-, Alkylaminoalkyl- oder Dialkylaminoalkylgruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte (Alkylenimino)alkylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine Alkylcarbonylaminoalkyl-, N-Alkyl-alkylcarbonylaminoalkyl-, Alkylsulfonylaminoalkyl-, N-Alkyl-alkylsulfonylaminoalkyl-, Arylcarbonylaminoalkyl-, N-Alkyl-arylcarbonylaminoalkyl-, Arylsulfonylaminoalkyl-, N-Alkyl-arylsulfonylaminoalkyl-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylsulfenyl-, Aralkylsulfinyl-, Aralkylsulfonyl-, Alkylsulfenylalkyl-, Alkylsulfinylalkyl-, Alkylsulfonylalkyl-, Arylsulfenylalkyl-, Arylsulfinylalkyl- oder Arylsulfonylalkylgruppe oder

eine C_{3-7}-Cycloalkylgruppe, wobei in einer C_{5-7}-Cycloalkylgruppe eine Methylengruppe durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein kann, darstellt,

oder R_c eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder durch eine Arylgruppe substituierte 6- bis 8-gliedrige Alkyleniminogruppe, die zusätzlich durch den Rest R_5 substituiert sein kann, wobei in den vorstehend erwähnten Alkyleniminogruppen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, N-Oxido-N-alkylimino- oder R_9N-Gruppe ersetzt ist, wobei

R_9 ein Wasserstoffatom, eine Alkyl-, Hydroxy-C_{2-4}-alkyl-, Alkoxy-C_{2-4}-alkyl-, Amino-C_{2-4}-alkyl-, Alkylamino-C_{2-4}-alkyl-, Dialkylamino-C_{2-4}-alkyl-, (Hydroxy-C_{2-4}-alkoxy)-C_{2-4}-alkyl-, Aminocarbonylalkyl-, Alkylaminocarbonylalkyl-, Dialkylaminocarbonylalkyl-, Aryl-, Aralkyl-, Formyl-, Alkylcarbonyl-, Alkylsulfonyl-, Arylcarbonyl-, Aryl-sulfonyl-, Aralkylcarbonyl-, Aralkylsulfonyl-, Alkoxycarbonyl-, Cyano-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl- oder Dialkylaminocarbonylgruppe oder eine (Alkylenimino)carbonylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in einem 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteil eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein kann, darstellt,

oder R_c eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 1-Pyrrolidinylgruppe, in der zwei Wasserstoffatome am Kohlenstoffgerüst durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 2 bis 6 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 1 bis 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich an benachbarten Kohlen-

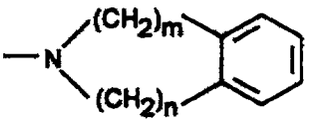
stoffatomen befinden, oder 2 bis 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Atom getrennt sind, wobei die vorstehend erwähnten 1-Pyrrolidinylgruppen zusätzlich durch den Rest R_5, der wie vorstehend erwähnt definiert ist, substituiert sein können,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 1-Piperidinyl- oder 1-Azacyclohept-1-yl-gruppe, in denen zwei Wasserstoffatome am Kohlenstoffgerüst durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 2 bis 6 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 1 bis 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Atom getrennt sind, oder 1 bis 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch zwei Atome getrennt sind, wobei die vorstehend erwähnten 1-Piperidinyl- und 1-Azacyclohept-1-yl-gruppen zusätzlich durch den Rest R_5, der wie vorstehend erwähnt definiert ist, substituiert sein können,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 1-Pyrrolidinylgruppe, in der zwei Wasserstoffatome in 3-Stellung durch eine $-O-CH_2CH_2-O-$ oder $-O-CH_2CH_2CH_2-O-$Gruppe substituiert sind,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 1-Piperidinyl- oder 1-Azacyclohept-1-yl-gruppe, in denen in 3-Stellung oder in 4-Stellung jeweils zwei Wasserstoffatome durch eine $-O-CH_2CH_2-O-$ oder $-O-CH_2CH_2CH_2-O-$Gruppe substituiert sind,

eine Gruppe der Formel



in der
m und n, die gleich oder verschieden sein können, die Zahlen 1 bis 3 oder
m die Zahl 0 und n die Zahl 2, 3 oder 4 bedeuten, wobei zusätzlich der obige Benzoteil durch Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome, durch Alkyl-, Trifluormethyl-, Hydroxy-, Alkoxy- oder Cyanogruppen und der obige gesättigte cyclische Iminoteil durch 1 oder 2 Alkylgruppen, wobei die Substituenten jeweils gleich oder verschieden sein können, mono- oder disubstituiert sein kann, oder

eine $(R_{10}NR_{11})$-Gruppe, in der

R_{10} und R_{11} die gleich oder verschieden sein können, jeweils ein Wasserstoffatom,

eine C_{1-16}-Alkylgruppe, die durch 1 oder 2 Aryl- oder C_{3-7}-Cycloalkylgruppen, durch eine Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylaminocarbonyl-, Cyano-, Hydroxy-, Alkoxy-, Aryloxy-, Aralkoxy-, C_{2-4}-Alkylendioxy-, Alkylcarbonyloxy-, Arylcarbonyloxy-, Formylamino-, Amino-, Alkylamino- oder Dialkylaminogruppe, durch eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte (Alkylenimino)carbonylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in einem 6- oder 7-gliedrigen Alkyleniminoteil jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

durch eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 4- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 6- oder 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl- oder R_9N-Gruppe ersetzt sein kann, wobei R_9 wie eingangs definiert ist, und zusätzlich in den vorstehend erwähnten 5- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine oder zwei zu den Stickstoffatomen benachbarte Methylengruppen durch eine Carbonylgruppe ersetzt sein können,

durch eine Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Arylcarbonylamino-, N-Alkyl-arylcarbonylamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Arylsulfonylamino-, N-Alkyl-arylsulfonylamino-, Aralkylcarbonylamino-, N-Alkyl-aralkylcarbonylamino-, Aralkylsulfonylamino-, N-Alkyl-aralkylsulfonylamino-, Alkoxycarbonylamino-, N-Alkyl-alkoxycarbonylamino-, Aralkoxycarbonylamino- oder N-Alkyl-aralkoxycarbonylaminogruppe, durch eine (R_8NR_7)-CO-NR_6- oder (R_8NR_7)-SO_2-NR_6-Gruppe, wobei R_6, R_7 und R_8 wie eingangs definiert sind, durch eine Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylsulfenyl-, Aralkylsulfinyl- oder Aralkylsulfonylgruppe, durch eine durch R_5 und gegebenenfalls zusätzlich durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte C_{4-7}-Cycloalkylgruppe, wobei R_5 wie eingangs definiert ist, durch eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, in der eine Methylengruppe durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl- oder NR_9-Gruppe ersetzt ist oder durch ein Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom substituiert sein kann,

eine durch 2 oder 3 Fluoratome substituierte C_{2-10}-Alkylgruppe,

eine durch 4 oder 5 Fluoratome substituierte C_{3-10}-Alkylgruppe,

eine durch eine 1,4,7,10-Tetraoxacyclododecyl-, 1,4,7,10,13-Pentaoxacyclopentadecyl- oder eine 1,4,7,10,13,16-Hexaoxacyclooctadecylgruppe substituierte Methylgruppe,

eine durch 2 bis 5 Hydroxy- oder Alkoxygruppen substituierte C_{3-10}-Alkylgruppe,

eine durch eine Arylgruppe und eine Hydroxygruppe substituierte C_{2-6}-Alkylgruppe, die zusätzlich durch eine Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert sein kann,

eine durch eine Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino- oder Alkoxycarbonylaminogruppe und zusätzlich durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituierte C_{3-6}-Alkylgruppe,

eine gegebenenfalls durch eine Arylgruppe oder C_{3-7}-Cycloalkylgruppe substituierte Alkenyl- oder Alkinylgruppe mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, wobei der Vinyl- oder Ethinylteil nicht mit dem Stickstoffatom verknüpft sein kann,

eine C_{2-4}-Alkylgruppe, die durch eine C_{2-4}-Alkoxygruppe substituiert ist, welche in ω-Position durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert ist,

eine Arylgruppe,

eine Cyclopropylgruppe, die durch 1 oder 2 Alkylgruppen, durch eine Aryl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl- oder Dialkylaminocarbonylgruppe oder durch eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte (Alkylenimino)carbonylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil substituiert sein kann, wobei in den vorstehend erwähnten 6- oder 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-

imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte C_{4-7}-Cycloalkylgruppe, die zusätzlich durch R_5, der wie eingangs definiert ist, substituiert sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 2 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, die zusätzlich durch eine N,N-Dialkyl-N-oxido-aminogruppe substituiert ist,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkenylgruppe, wobei der Vinylteil nicht mit dem Stickstoffatom der $(R_{11}NR_{10})$-Grupppe verknüpft sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte C_{4-7}-Cycloalkylgruppe, die zusätzlich durch R_5 substituiert sein kann, wobei in dem Cycloalkylteil eine Methylengruppe durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, N-Alkyl-N-oxido-imino- oder R_9N-Gruppe ersetzt ist, wobei R_5 und R_9 wie eingangs definiert sind,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte C_5-C_7-Cycloalkyl- oder C_5-C_7-Cycloalkylalkylgruppe, in denen jeweils eine Methylengruppe im Cycloalkylteil durch eine Carbonylgruppe ersetzt ist,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte Cyclopentyl- oder Cyclopentylalkylgruppe, in denen jeweils zwei Wasserstoffatome im Cyclopentylteil durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 2 bis 6 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 1 bis 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 bis 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Kohlenstoffatom getrennt sind, wobei

die vorstehend erwähnten Ringe zusätzlich durch den Rest R_5, der wie eingangs definiert ist, substituiert sein können,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte Cyclohexyl-, Cyclohexylalkyl-, Cycloheptyl- oder Cycloheptylalkylgruppe, in denen jeweils zwei Wasserstoffatome im Cycloalkylteil durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 2 bis 6 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 1 bis 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Kohlenstoffatom getrennt sind, oder 1 bis 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch zwei Kohlenstoffatome getrennt sind, wobei die vorstehend erwähnten Ringe zusätzlich durch den Rest R_5, der wie eingangs definiert ist, substituiert sein können,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 3-Cyclohexen-1-yl- oder 3-Cyclohexen-1-yl-alkylgruppe, in denen im Cyclohexenylteil zwei Wasserstoffatome in 2,5-Stellung durch eine n-C_{1-3}-Alkylenbrücke ersetzt sind,

eine 3-Chinuclidinyl-, 4-Chinuclidinyl-, 2-Chinuclidinylalkyl-, 3-Chinuclidinyl-alkyl-, 4-Chinuclidinyl-alkyl-, Azabicyclo[2.2.1]hept-4-yl-, Azabicyclo[2.2.1]hept-4-yl-alkyl- oder Adamantylgruppe, oder

R_{10} ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe und R_{11} eine Hydroxy-, Alkoxy- oder Cyanogruppe darstellen,

wobei, sofern nichts anderes erwähnt wurde,

unter den bei der Definition der vorstehend erwähnten Reste erwähnten Arylteilen eine Phenylgruppe zu verstehen ist, die jeweils durch R_{12} monosubstituiert, durch R_{13} mono-, di- oder

trisubstituiert oder durch R_{12} monosubstituiert und zusätzlich durch R_{13} mono- oder disubstituiert sein kann, wobei die Substituenten gleich oder verschieden sein können, und

R_{12} eine Cyano-, Carboxy-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Alkoxycarbonyl-, Alkylcarbonyl-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Alkylsulfonyloxy-, Perfluoralkyl-, Perfluoralkoxy-, Nitro-, Amino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, N-Alkyl-(hydroxy-C_{2-4}-alkyl)-amino-, Bis-(hydroxy-C_{2-4}-alkyl)amino-, Phenylalkylcarbonylamino-, Phenylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, Phenylalkylsulfonylamino-, Phenylsulfonylamino-, N-Alkyl-phenylalkylcarbonylamino-, N-Alkyl-phenylcarbonylamino-, N-Alkylalkylsulfonylamino-, N-Alkyl-phenylalkylsulfonylamino-, N-Alkyl-phenylsulfonylamino-, Aminosulfonyl-, Alkylaminosulfonyl-, Dialkylaminosulfonyl-, (R_8NR_7)-CO-NR_6- oder (R_8NR_7)-SO_2-NR_6-Gruppe, wobei R_6, R_7 und R_8 wie eingangs definiert sind,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder eine Hydroxyalkylgruppe substituierte 5- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder eine R_9N-Gruppe ersetzt sein kann, wobei R_9 wie eingangs definiert ist,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder eine Hydroxyalkylgruppe substituierte 5- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen jeweils durch eine Carbonylgruppe ersetzt ist, und

R_{13} eine Alkyl-, Hydroxy- oder Alkoxygruppe, ein Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom darstellen, wobei zwei Reste R_{13}, sofern diese an benachbarte Kohlenstoffatome gebunden sind, auch eine Alkylengruppe mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, eine

1,3-Butadien-1,4-diylengruppe oder eine Methylendioxygruppe darstellen können,

sowie, soweit nichts anderes erwähnt wurde, die vorstehend erwähnten Alkyl-, Alkylen- und Alkoxyteile jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten,

insbesondere diejenigen der vorstehend erwähnten Verbindungen der allgemeinen Formel I mit der Maßgabe, daß, sofern nichts anderes erwähnt wurde, jedes Kohlenstoffatom in den vorstehend erwähnten Alkylen- oder Cycloalkylenteilen, das an ein Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom gebunden ist, an kein weiteres Halogen-, Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom gebunden sein kann.

Bevorzugte Verbindungen der obigen allgemeinen Formel I sind diejenigen, in denen

R_a ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe,

R_b eine durch die Reste R_1 bis R_3 substituierte Phenylgruppe, wobei

R_1 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom,

eine C_{1-6}-Alkyl-, Hydroxy- oder C_{1-6}-Alkoxygruppe,

eine C_{3-6}-Cycloalkyl- oder C_{5-6}-Cycloalkoxygruppe,

eine C_{2-5}-Alkenyl- oder C_{3-5}-Alkenyloxygruppe, wobei der Vinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine C_{2-5}-Alkinyl- oder C_{3-5}-Alkinyloxygruppe, wobei der Ethinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine Aryl-, Aryloxy-, Aralkyl-, Aralkoxy-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Alkylsulfonyloxy-, Trifluormethylsulfenyl-, Trifluormethylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylsulfenyl-, Aralkylsulfinyl- oder Aralkylsulfonylgruppe,

eine durch 1 bis 3 Fluoratome substituierte Methyl- oder Methoxygruppe,

eine durch 1 bis 5 Fluoratome substituierte C_{2-4}-Alkyl- oder C_{2-4}-Alkoxygruppe,

eine Nitro-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, C_{3-6}-Cycloalkylamino-, N-Alkyl-C_{3-6}-cycloalkylamino-, Arylamino-, N-Alkyl-arylamino-, Aralkylamino- oder N-Alkyl-aralkylaminogruppe,

eine 5- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen jeweils durch eine Carbonylgruppe oder in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom, durch eine Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein können,

eine (Alkylenimino)carbonyl- oder (Alkylenimino)sulfonylgruppe mit jeweils 5 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom, durch eine Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Arylcarbonylamino-, N-Alkyl-arylcarbonylamino-, Arylsulfonylamino-, N-Alkyl-arylsulfonylamino-, Aralkylcarbonylamino-, N-Alkyl-aralakylcarbonylamino-, Aralkylsulfonylamino-, N-Alkyl-aralkylsulfonylamino-, Trifluormethylsulfonylamino-, N-Alkyl-trifluorme-

thylsulfonylamino-, Alkylcarbonyl-, Arylcarbonyl-, Aralkylcarbonyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Arylaminocarbonyl-, N-Alkyl-arylaminocarbonyl-, Aralkylaminocarbonyl-, N-Alkyl-aralkyl-aminocarbonyl-, N-Hydroxy-aminocarbonyl-, N-Hydroxy-alkyl-aminocarbonyl-, N-Alkoxy-aminocarbonyl-, N-Alkoxy-alkylaminocarbonyl-, Cyano-, Azido-, N-Cyano-amino- oder N-Cyano-alkylaminogruppe,

eine Sulfo-, Aminosulfonyl-, Alkylaminosulfonyl-, Dialkylaminosulfonyl-, Arylaminosulfonyl-, N-Alkyl-arylaminosulfonyl-, Aralkylaminosulfonyl- oder N-Alkyl-aralkylaminosulfonylgruppe,

eine Phosphono-, O-Alkyl-phosphono-, O,O'-Dialkyl-phosphono- oder O,O'-Diaralkyl-phosphonogruppe,

eine durch R_4 substituierte Alkyl- oder Alkoxygruppe, wobei

R_4 eine Hydroxy-, Alkoxy-, Aryloxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl- oder Cyanogruppe oder

eine (Alkylenimino)carbonylgruppe mit jeweils 5 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom, durch eine Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein kann, darstellt,

R_2 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Alkyl-, Trifluormethyl-, Hydroxy-, Alkoxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Trifluormethylsulfonylamino-, N-Alkyl-trifluormethylsulfonylamino- oder Cyanogruppe und

R_3 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Alkyl-, Trifluormethyl- oder Alkoxygruppe oder

R_2 zusammen mit R_3, sofern diese an benachbarte Kohlenstoffatome gebunden sind, auch eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Alkylgruppen substituierte Methylendioxygruppe, eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Alkylgruppen substituierte n-C_{3-6}-Alkylengruppe oder eine gegebenenfalls durch ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, durch eine Hydroxy-, Alkyl-, Alkoxy-, Trifluormethyl- oder Cyangruppe substituierte 1,3-Butadien-1,4-diylengruppe oder

R_a zusammen mit R_1, sofern R_1 in o-Stellung zu dem durch R_a substituierten Stickstoffatom steht, auch eine n-C_{2-3}-Alkylengruppe darstellen, und

R_c ein Wasserstoff- oder Chloratom,

eine Alkyl-, Aryl-, Aralkyl-, Mercapto-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl- oder Alkylsulfonylgruppe,

eine Hydroxy-, Aryloxy- oder Aralkoxygruppe,

eine C_{1-6}-Alkoxygruppe, die durch eine Alkoxycarbonyl-, Cyano-, Carboxy-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl- oder Dialkylaminocarbonylgruppe substituiert sein kann,

eine C_{2-6}-Alkoxygruppe, die durch eine Hydroxy-, Alkoxy-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino- oder Alkoxycarbonylaminogruppe, durch eine gegebenenfalls durch 1 bis 2 Alkylgruppen substituierte 5- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 5- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen jeweils durch eine Carbonylgruppe oder in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkylenimino-

gruppen eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder durch eine Carbonyl-, Imino-, Alkyl-imino-, Alkylcarbonyl-imino-, Alkoxycarbonyl-imino-, Alkylsulfonyl-imino-, Formyl-imino-, Dialkylaminocarbonyl-imino-, Aryl-imino- oder Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann, substituiert ist,

eine durch zwei Hydroxy- oder Alkoxygruppen substituierte C_{3-6}-Alkoxygruppe,

eine durch eine C_{3-7}-Cycloalkylgruppe substituierte Alkoxygruppe, wobei der Cycloalkylteil jeweils durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituiert sein kann und wobei in den vorstehend erwähnten C_{4-7}-Cycloalkylteilen jeweils eine Methylengruppe durch ein Sauerstoffatom, durch eine Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkoxycarbonyl-imino- oder N-Aryl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine gegebenenfalls durch eine Hydroxy-, Alkoxy-, Alkoxycarbonyl-, Cyano-, Carboxy-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino- oder Alkoxycarbonylaminogruppe substituierte C_{4-7}-Cycloalkoxygruppe,

eine C_{5-7}-Cycloalkoxygruppe, wobei in der vorstehend erwähnten Cyclopentyloxygruppe jeweils eine Methylengruppe in 3-Stellung, in den vorstehend erwähnten C_{6-7}-Cycloalkoxygruppen jeweils eine Methylengruppe in 3- oder 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder durch eine Imino-, Alkyl-imino-, Alkylcarbonyl-imino-, Alkoxycarbonyl-imino-, Alkylsulfonyl-imino-, Aryl-imino- oder Aralkyl-iminogruppe ersetzt ist,

eine C_{3-6}-Alkenyloxygruppe, wobei der Vinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine C_{3-6}-Alkinyloxygruppe, wobei der Ethinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder eine Arylgruppe substituierte 4- bis 8-gliedrige Alkyleniminogruppe, die zusätzlich durch den Rest R_5 substituiert sein kann, wobei

R_5 eine Aryl-, Aralkyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Piperazinocarbonyl-, 4-Alkyl-piperazinocarbonyl-, Cyano-, Hydroxy-, Alkoxy-, Aryloxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, N-Alkyl-hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, Di(hydroxy-C_{2-4}-alkyl)amino-, Formylamino-, Cyanamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkoxycarbonylamino-, N-Alkyl-alkoxycarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Arylcarbonylamino-, N-Alkyl-arylcarbonylamino-, Arylsulfonylamino-, N-Alkyl-arylsulfonylamino-, Carboxyalkyl-, Alkoxycarbonylalkyl-, Aminocarbonylalkyl-, Alkylaminocarbonylalkyl-, Dialkylaminocarbonylalkyl-, Pyrrolidinocarbonylalkyl-, Piperidinocarbonylalkyl-, Morpholinocarbonylalkyl-, Piperazinocarbonylalkyl-, 4-Alkyl-piperazinocarbonylalkyl-, Cyanoalkyl-, Hydroxyalkyl-, Alkoxyalkyl-, Aryloxyalkyl-, Aminoalkyl-, Alkylaminoalkyl-, Dialkylaminoalkyl-, Alkylcarbonylaminoalkyl-, N-Alkyl-alkylcarbonylaminoalkyl-, Alkylsulfonylaminoalkyl-, N-Alkyl-alkylsulfonylaminoalkyl-, Arylcarbonylaminoalkyl-, N-Alkyl-arylcarbonylaminoalkyl-, Arylsulfonylaminoalkyl-, N-Alkyl-arylsulfonylaminoalkyl-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Alkylsulfenylalkyl-, Alkylsulfinylalkyl-, Alkylsulfonylalkyl-, Arylsulfenylalkyl-, Arylsulfinylalkyl-, Arylsulfonylalkyl-, Carboxyalkoxy-, Alkoxycarbonylalkoxy-, Aminocarbonylalkoxy-, Alkylaminocarbonylalkoxy-, Dialkylaminocarbonylalkoxy-, Pyrrolidinocarbonylalkoxy-, Piperidinocarbonylalkoxy-, Morpholinocarbonylalkoxygruppe oder eine (R_8NR_7)-CO-NR_6-Gruppe, wobei

R_6, R_7 und R_8, die gleich oder verschieden sein können, jeweils ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe oder R_6 und R_7 zusammen eine n-C_{2-3}-Alkylengruppe und R_8 ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe darstellen,

eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Alkylgruppen oder eine Hydroxymethylgruppe substituierte Pyrrolidino-, Piperidino-, Morpholino-, Piperazino-, 4-Alkylpiperazino- oder 4-Alkylcarbonylpiperazinogruppe, wobei im heterocyclischen Teil der vorstehend erwähnten Gruppen jeweils eine oder zwei der zu den Stickstoffatomen benachbarten Methylengruppen durch eine Carbonylgruppe ersetzt sein können,

oder R_C eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder durch eine Arylgruppe substituierte 6- bis 8-gliedrige Alkyleniminogruppe, die zusätzlich durch den Rest R_5 substituiert sein kann, wobei in den vorstehend erwähnten Alkyleniminogruppen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, N-Oxido-N-alkylimino- oder R_9N-Gruppe ersetzt ist, wobei

R_9 ein Wasserstoffatom, eine Alkyl-, Hydroxy-C_{2-4}-alkyl-, Alkoxy-C_{2-4}-alkyl-, Hydroxy-C_{2-4}-alkoxy-C_{2-4}-alkyl-, Aminocarbonylalkyl-, Alkylaminocarbonylalkyl-, Dialkylaminocarbonylalkyl-, Amino-C_{2-4}-alkyl-, Alkylamino-C_{2-4}-alkyl-, Dialkylamino-C_{2-4}-alkyl-, Aryl-, Aralkyl-, Formyl-, Alkylcarbonyl-, Alkylsulfonyl-, Arylcarbonyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylcarbonyl-, Aralkylsulfonyl-, Alkoxycarbonyl-, Cyano-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl- oder Dialkylaminocarbonylgruppe darstellt,

oder R_C eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte 1-Pyrrolidinylgruppe, in der zwei Wasserstoffatome am Kohlenstoffgerüst durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 4 oder 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlen-

stoffatom befinden, oder 3 oder 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 oder 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Atom getrennt sind,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte 1-Piperidinyl- oder 1-Azacyclohept-1-yl-gruppe, in denen zwei Wasserstoffatome am Kohlenstoffgerüst durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 4 oder 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 3 oder 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 oder 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Atom getrennt sind, oder 1 oder 2 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch zwei Atome getrennt sind,

eine 1-Pyrrolidinylgruppe, in der zwei Wasserstoffatome in 3-Stellung durch eine $-O-CH_2CH_2-O-$ oder $-O-CH_2CH_2CH_2-O-$Gruppe ersetzt sind,

eine 1-Piperidinyl- oder 1-Azacyclohept-1-yl-gruppe, in denen zwei Wasserstoffatome in 3-Stellung oder in 4-Stellung durch eine $-O-CH_2CH_2-O-$ oder $-O-CH_2CH_2CH_2-O-$Gruppe ersetzt sind,

eine 2-Isoindolinyl-, 1,2,3,4-Tetrahydro-isochinolin-2-yl- oder 2,3,4,5-Tetrahydro-1H-3-benzazepin-3-yl-Gruppe, wobei der Benzoteil der vorstehend erwähnten Gruppen jeweils durch ein Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom, durch eine Trifluormethylgruppe oder durch eine oder zwei Alkyl- oder Alkoxygruppen substituiert sein kann, oder

eine $(R_{10}NR_{11})$-Gruppe darstellt, in der

R_{10} ein Wasserstoffatom oder eine C_{1-8}-Alkylgruppe, die ab Position 2 durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert sein kann,

R_{11} ein Wasserstoffatom,

eine C_{1-10}-Alkylgruppe, die durch eine Aryl-, C_{3-7}-Cycloalkyl-, Hydroxy-, Alkoxy-, Aryloxy-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylaminocarbonyl-, Cyano-, Formylamino-, Amino-, Alkylamino- oder Dialkylaminogruppe, durch eine Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Piperazinocarbonyl- oder 4-Alkyl-piperazinocarbonylgruppe,

durch eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte 5- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 6- oder 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl- oder R_9N-Gruppe ersetzt sein kann, wobei R_9 wie eingangs definiert ist,

durch eine Pyrrolidino-, Piperidino-, Piperazino- oder 4-Alkylpiperazinogruppe, wobei jeweils eine oder zwei der zu den Stickstoffatomen benachbarten Methylengruppen durch eine Carbonylgruppe ersetzt sind,

durch eine Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Arylcarbonylamino-, N-Alkyl-arylcarbonylamino-, Arylsulfonylamino-, N-Alkyl-arylsulfonylamino-, Aralkylcarbonylamino-, N-Alkyl-aralkylcarbonylamino-, Aralkylsulfonylamino-, N-Alkyl-aralkylsulfonylamino-, Alkoxycarbonylamino- oder N-Alkyl-alkoxycarbonylaminogruppe, durch eine (R_8NR_7)-CO-NR_6-Gruppe, wobei R_6 bis R_8 wie eingangs definiert sind, durch eine Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylsulfenyl-, Aralkylsulfinyl- oder Aralkylsulfonylgruppe oder durch eine C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, in der

eine Methylengruppe durch ein Sauerstoffatom oder durch eine Imino- oder Alkyliminogruppe ersetzt ist, substituiert sein kann,

eine durch ein Chloratom oder ein bis drei Fluoratome substituierte C_{2-4}-Alkylgruppe,

eine durch eine 1,4,7,10-Tetraoxacyclododecyl-, 1,4,7,10,13-Pentaoxacyclopentadecyl- oder eine 1,4,7,10,13,16-Hexaoxacyclooctadecylgruppe substituierte Methylgruppe,

eine durch 2 bis 5 Hydroxygruppen substituierte C_{3-10}-Alkylgruppe,

eine durch eine Hydroxy- und zusätzlich durch eine Arylgruppe substituierte C_{2-6}-Alkylgruppe, die gegebenenfalls zusätzlich durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert sein kann,

eine durch eine Hydroxy- und zusätzlich durch eine Amino-, Alkylamino- oder Dialkylaminogruppe substituierte C_{3-6}-Alkylgruppe,

eine gegebenenfalls durch eine Arylgruppe substituierte Alkenyl- oder Alkinylgruppe mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, wobei der Vinyl- oder Ethinylteil nicht mit dem Stickstoffatom verknüpft sein kann,

eine C_{2-4}-Alkylgruppe, die durch eine C_{2-4}-Alkoxygruppe substituiert ist, welche in ω-Position durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert ist,

eine Arylgruppe,

eine Cyclopropylgruppe, die durch 1 oder 2 Alkylgruppen, durch eine Aryl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-,

Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Piperazinocarbonyl- oder 4-Alkyl-piperazinocarbonylgruppe substituiert sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte C_{4-7}-Cycloalkylgruppe, die zusätzlich durch R_5 substituiert sein kann, wobei R_5 wie eingangs definiert ist,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, die zusätzlich durch eine N,N-Dialkyl-N-oxido-aminogruppe substituiert ist,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkenylgruppe, wobei der Vinylteil nicht mit dem Stickstoffatom der $(R_{11}NR_{10})$-Grupppe verknüpft sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, wobei in dem Cycloalkylteil jeweils eine Methylengruppe durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, N-Alkyl-N-oxido-imino- oder R_9N-Gruppe ersetzt ist, wobei R_9 wie eingangs definiert ist,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, in denen jeweils eine Methylengruppe durch eine Carbonylgruppe ersetzt ist,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte C_{4-7}-Cycloalkylmethylgruppe, die im Cycloalkylteil zusätzlich durch R_5 substituiert ist, wobei R_5 wie vorstehend erwähnt definiert ist,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte Cyclopentyl- oder Cyclopentylalkylgruppe, in denen jeweils zwei Wasserstoffatome im Cyclopentylteil durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 4 oder 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 3 oder 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten

Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 oder 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Kohlenstoffatom getrennt sind,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte Cyclohexyl-, Cyclohexylalkyl-, Cycloheptyl- oder Cycloheptylalkylgruppe, in denen jeweils zwei Wasserstoffatome im Cycloalkylteil durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 4 oder 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 3 oder 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 oder 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Kohlenstoffatom getrennt sind, oder 1 oder 2 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch zwei Kohlenstoffatome getrennt sind,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 5-Norbornen-2-yl- oder 5-Norbornen-2-yl-alkylgruppe,

eine 3-Chinuclidinyl-, 4-Chinuclidinyl-, 3-Chinuclidinyl-alkyl-, 4-Chinuclidinyl-alkyl-, Azabicyclo[2.2.1]hept-4-yl-, Azabicyclo[2.2.1]hept-4-yl-alkyl- oder Adamantylgruppe, oder

R_{10} ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe und R_{11} eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe darstellen,

deren Tautomere, deren Stereoisomere und deren Salze,

wobei, sofern nichts anderes erwähnt wurde,

unter den bei der Definition der vorstehend erwähnten Reste erwähnten Arylteilen eine Phenylgruppe zu verstehen ist, die jeweils durch R_{12} monosubstituiert, durch R_{13} mono-, di- oder trisubstituiert oder durch R_{12} monosubstituiert und zusätzlich

durch R_{13} mono- oder disubstituiert sein kann, wobei die Substituenten gleich oder verschieden sein können, und

R_{12} eine Cyano-, Carboxy-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Alkoxycarbonyl-, Alkylcarbonyl-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Alkylsulfonyloxy-, Perfluoralkyl-, Perfluoralkoxy-, Nitro-, Amino-, Alkylamino-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, N-Alkyl-hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, Di(hydroxy-C_{2-4}-alkyl)amino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, Phenylalkylcarbonylamino-, Phenylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, Phenylalkylsulfonylamino-, Phenylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-phenylalkylcarbonylamino-, N-Alkyl-phenylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-phenylalkylsulfonylamino-, N-Alkyl-phenylsulfonylamino-, Aminosulfonyl-, Alkylaminosulfonyl- oder Dialkylaminosulfonylgruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 2 Alkylgruppen oder eine Hydroxyalkylgruppe substituierte 5- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder eine R_9N-Gruppe ersetzt sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 2 Alkylgruppen oder eine Hydroxyalkylgruppe substituierte 5- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen durch jeweils eine Carbonylgruppe ersetzt sind,

eine (R_8NR_7)-CO-NR_6-Gruppe, wobei R_6 bis R_8 wie vorstehend erwähnt definiert sind,

R_{13} eine Alkyl-, Hydroxy- oder Alkoxygruppe, ein Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom darstellen, wobei zwei Reste R_{13} sofern diese an benachbarte Kohlenstoffatome gebunden sind, auch eine Alkylengruppe mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, eine

1,3-Butadien-1,4-diylengruppe oder eine Methylendioxygruppe darstellen können,

sowie, soweit nichts anderes erwähnt wurde, die vorstehend erwähnten Alkyl-, Alkylen- und Alkoxyteile jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten sowie, sofern nichts anderes erwähnt wurde, jedes Kohlenstoffatom in den vorstehend erwähnten Alkylen- oder Cycloalkylenteilen, das an ein Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom gebunden ist, an kein weiteres Halogen-, Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom gebunden sein kann.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind diejenigen, in denen

R_a ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe,

R_b eine durch die Reste R_1 bis R_3 substituierte Phenylgruppe, wobei

R_1 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom,

eine Alkyl-, Hydroxy-, Alkoxy-, C_{3-6}-Cycloalkyl- oder C_{5-6}-Cycloalkoxygruppe,

eine in 2-Stellung durch eine Hydroxy-, Alkoxy- oder Phenoxygruppe substituierte Ethoxygruppe,

eine C_{2-5}-Alkenyl- oder C_{3-5}-Alkenyloxygruppe, wobei der Vinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine C_{2-5}-Alkinyl- oder C_{3-5}-Alkinyloxygruppe, wobei der Ethinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine Phenyl-, Phenoxy-, Phenylalkyl-, Phenylalkoxy-, Alkoxyalkyl-, Phenoxyalkyl-, Carboxyalkyl-, Alkoxycarbonylalkyl-, Aminocarbonylalkyl-, Alkylaminocarbonylalkyl-, Dialkylaminocarbo-

nylalkyl-, Cyanoalkyl-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Alkylsulfonyloxy-, Trifluormethylsulfenyl-, Trifluormethylsulfonyl-, Nitro-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Pyrrolidino-, Piperidino-, Morpholino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Trifluormethylsulfonylamino-, N-Alkyl-trifluormethylsulfonylamino-, Alkylcarbonyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl- oder Cyanogruppe,

eine durch 1 bis 3 Fluoratome substituierte Methyl- oder Methoxygruppe,

eine durch 1 bis 5 Fluoratome substituierte Ethyl- oder Ethoxygruppe,

R_2 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Alkyl-, Trifluormethyl-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, Trifluormethylsulfonylamino-, Hydroxy- oder Alkoxygruppe,

R_3 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor- oder Bromatom oder eine Alkylgruppe, oder

R_2 zusammen mit R_3, sofern diese an benachbarte Kohlenstoffatome gebunden sind, auch eine Methylendioxy- oder n-C_{3-6}-Alkylengruppe oder eine gegebenenfalls durch ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, durch eine Alkyl-, Alkoxy- oder Trifluormethylgruppe substituierte 1,3-Butadien-1,4-diylengruppe darstellen, bedeuten, und

R_c ein Wasserstoff- oder Chloratom,

eine Alkyl-, Phenyl-, Mercapto-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl- oder Alkylsulfonylgruppe,

eine Hydroxy-, Phenoxy- oder Phenyl-C_{1-2}-alkoxygruppe,

eine Alkoxygruppe,

eine C_{2-4}-Alkoxygruppe, die durch eine Hydroxy-, Alkoxy-, (2-Hydroxyethyl)amino-, Dialkylamino-, Morpholino-, 1-Pyrrolidinyl-, 1-Piperidinyl-, 4-Methyl-1-piperazinyl-, 4-Acetyl-1-piperazinyl-, 4-Methylsulfonyl-1-piperazinyl-, 4-Methoxycarbonyl-1-piperazinyl-, 4-Formyl-1-piperazinyl- oder 4-Dimethylaminocarbonyl-1-piperazinylgruppe substituiert ist,

eine C_{3-4}-Alkoxygruppe, die durch zwei Hydroxygruppen substituiert ist,

eine C_{1-2}-Alkoxygruppe, die durch eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Methylgruppen substituierte C_{3-7}-Cycloalkylgruppe substituiert ist, wobei in den vorstehend erwähnten C_{4-6}-Cycloalkylgruppen jeweils eine Methylengruppe durch ein Sauerstoffatom ersetzt sein kann,

eine gegebenenfalls durch eine Hydroxy-, Dialkylamino-, Alkoxy-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino- oder Alkoxycarbonylaminogruppe substituierte C_{4-6}-Cycloalkoxygruppe,

eine Cyclopentyloxygruppe, in der die Methylengruppe in 3-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder durch eine Alkyliminogruppe ersetzt ist,

eine Cyclohexyloxygruppe, in der die Methylengruppe in 3- oder 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder durch eine Alkylimino-, Alkylcarbonyl-imino-, Alkoxycarbonyl-imino- oder Alkylsulfonyl-iminogruppe ersetzt ist,

eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Methylgruppen substituierte Allyloxy- oder Propargyloxygruppe,

eine 1-Azetidinylgruppe,

eine 1-Pyrrolidinylgruppe, die durch 1 bis 2 Alkylgruppen, durch eine Phenyl-, Carboxy-, Hydroxyalkyl-, Aminoalkyl-, Alkylaminoalkyl-, Dialkylaminoalkyl-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Piperazinocarbonyl- oder 4-Alkyl-piperazinocarbonyl-Gruppe oder in 3-Stellung auch durch eine Hydroxy-, Alkoxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, Alkoxycarbonylamino-, Formylamino-, Cyanamino-, Alkylsulfonylamino-, Dialkylaminocarbonylamino-, N-Alkyl-dialkylaminocarbonylamino-, N-Alkyl-dialkylaminocarbonylamino- oder Cyanogruppe substituiert sein kann,

eine 1-Pyrrolidinylgruppe, in der zwei Wasserstoffatome am Kohlenstoffgerüst durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 4 oder 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 3 oder 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 oder 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Atom getrennt sind,

eine 1-Piperidinylgruppe, die durch 1 bis 4 Alkylgruppen, durch eine Phenyl-, Hydroxyalkyl-, Aminoalkyl-, Alkylaminoalkyl-, Dialkylaminoalkyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Piperazinocarbonyl- oder 4-Alkyl-piperazinocarbonyl-Gruppe oder in 3- oder 4-Stellung auch durch eine Hydroxy-, Alkoxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, Alkoxycarbonylamino-, Formylamino-, Cyanamino-, Alkylsulfonylamino-, Dialkylaminocarbonylamino-, N-Alkyl-dialkylaminocarbonylamino- oder Cyanogruppe substituiert sein kann,

eine 1-Piperidinylgruppe, die durch 1 bis 2 Alkylgruppen oder eine Phenylgruppe und zusätzlich durch eine Hydroxygruppe substituiert ist,

eine 1-Piperidinylgruppe, in der in 3-Stellung oder in 4-Stellung zwei Wasserstoffatome durch eine $-O-CH_2CH_2-O-$ oder $-O-CH_2CH_2CH_2-O-$-Gruppe ersetzt sind,

eine 1-Piperidinylgruppe, in der zwei Wasserstoffatome am Kohlenstoffgerüst durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 4 oder 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 3 oder 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 oder 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Atom getrennt sind, oder 1 oder 2 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch zwei Atome getrennt sind,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte 1-Piperidinylgruppe, in der die Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, Alkyl-imino-, Hydroxy-C_{2-4}-alkyl-imino-, Alkoxy-C_{2-4}-alkyl-imino-, Aminocarbonylalkyl-imino-, Alkylaminocarbonylalkyl-imino-, Dialkylaminocarbonylalkyl-imino-, Amino-C_{2-4}-alkyl-imino-, Alkylamino-C_{2-4}-alkyl-imino-, Dialkylamino-C_{2-4}-alkyl-imino-, Hydroxy-C_{2-4}-alkoxy-C_{2-4}-alkyl-imino-, Phenyl-imino-, Phenylalkyl-imino-, Alkylcarbonyl-imino-, Alkylsulfonyl-imino-, Phenylcarbonyl-imino-, Phenylsulfonyl-imino- oder N-Oxido-N-alkyl-imino-Gruppe ersetzt ist,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte 1-Azacyclohept-1-yl-Gruppe, in der jeweils die Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom, durch eine Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Phenyl-imino-, N-Phenylalkyl-imino-,

N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Phenylcarbonyl-imino- oder N-Phenylsulfonyl-imino-Gruppe ersetzt sein kann oder zwei Wasserstoffatome in 3,6-Stellung durch eine $-CH_2CH_2-$-Gruppe ersetzt sein können,

eine 2-Isoindolinyl-, 1,2,3,4-Tetrahydro-isochinolin-2-yl- oder 2,3,4,5-Tetrahydro-1H-3-benzazepin-3-yl-Gruppe, die jeweils im Benzoteil durch ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, durch eine Alkyl-, Trifluormethyl- oder Alkoxygruppe substituiert sein können, oder

eine $(R_{10}NR_{11})$-Gruppe darstellen, in der

R_{10} ein Wasserstoffatom oder eine C_{1-6}-Alkylgruppe, die ab Position 2 durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert sein kann, und

R_{11} ein Wasserstoffatom,

eine C_{1-8}-Alkylgruppe, die durch eine Phenyl-, C_{3-6}-Cycloalkyl-, Hydroxy-, Alkoxy-, Cyano-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, (2-Hydroxyethyl)aminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, 1-Piperazinylcarbonyl-, 4-Alkyl-1-piperazinylcarbonyl-, Amino-, Formylamino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkoxycarbonylamino-, N-Alkyl-alkoxycarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Phenylcarbonylamino-, N-Alkyl-phenylcarbonylamino-, Phenylsulfonylamino-, N-Alkyl-phenylsulfonylamino-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, 1-Pyrrolidinyl-, 2-Oxo-1-pyrrolidinyl-, 1-Piperidinyl-, 2-Oxo-1-piperidinyl-, Morpholino-, 1-Piperazinyl-, 4-Alkyl-1-piperazinyl-, 4-Alkylcarbonyl-1-piperazinyl-, 4-Alkylsulfonyl-1-piperazinyl-, 4-Alkoxycarbonyl-1-piperazinyl-, 4-Cyano-1-piperazinyl-, 4-Formyl-1-piperazinyl-, 4-Aminocarbonyl-1-piperazinyl-, 4-Alkylaminocarbonyl-

1-piperazinyl- oder 4-Dialkylaminocarbonyl-1-piperazinyl- oder eine (R_8NR_7)-CO-NR_6-Gruppe substituiert sein kann, wobei

R_6 und R_7 zusammen eine n-C_{2-3}-Alkylenbrücke und
R_8 ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe darstellen,

eine durch eine 1,4,7,10-Tetraoxacyclododecyl-, 1,4,7,10,13-Pentaoxacyclopentadecyl- oder eine 1,4,7,10,13,16-Hexaoxacyclooctadecylgruppe substituierte Methylgruppe,

eine 2,2,2-Trifluorethylgruppe,

eine durch 2 bis 5 Hydroxygruppen substituierte C_{3-10}-Alkylgruppe,

eine durch eine Hydroxy- und zusätzlich durch eine Aminogruppe substituierte C_{3-5}-Alkylgruppe,

eine durch eine Phenylgruppe und zusätzlich durch eine Hydroxygruppe substituierte C_{2-4}-Alkylgruppe, die gegebenenfalls zusätzlich durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert sein kann,

eine gegebenenfalls durch eine Phenylgruppe substituierte Alkenyl- oder Alkinylgruppe mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, wobei der Vinyl- oder Ethinylteil nicht mit dem Stickstoffatom verknüpft sein kann,

eine C_{2-4}-Alkylgruppe, die durch eine C_{2-4}-Alkoxygruppe substituiert ist, welche in ω-Position durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert ist,

eine Phenylgruppe,

eine Phenylgruppe, die durch eine Alkylcarbonylamino-, N-Alkylalkylcarbonylamino-, (2-Hydroxyethyl)amino-, Di-(2-hydroxyethyl)amino-, N-Alkyl-(2-hydroxyethyl)amino-, Amino-, Alkyl-

amino- oder Dialkylaminogruppe oder durch eine (R_8NR_7)-CO-NR_6-Gruppe substituiert ist, wobei R_6 bis R_8 wie vorstehend erwähnt definiert sind,

eine Phenylgruppe, die durch eine Pyrrolidino-, Piperidino-, 2-Oxo-pyrrolidino-, 2-Oxo-piperidino-, Morpholino-, 1-Piperazinyl- oder 4-Alkyl-1-piperazinyl-Gruppe substituiert ist, wobei die vorstehend erwähnten heterocyclischen Teile am Kohlenstoffgerüst jeweils durch 1 oder 2 Alkylgruppen oder durch eine Hydroxyalkylgruppe substituiert sein können,

eine C_{3-7}-Cycloalkylgruppe, die durch 1 oder 2 Alkylgruppen, durch eine Phenyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Piperazinocarbonyl- oder 4-Alkyl-piperazinocarbonylgruppe substituiert sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, die durch eine Hydroxymethyl-, Cyano-, Hydroxy-, Alkoxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, 2-Hydroxyethylamino-, Di-(2-hydroxyethyl)amino-, N-Alkyl-2-hydroxyethylamino-, N,N-Dialkyl-N-oxido-amino-, Alkoxycarbonylamino-, N-Alkyl-alkoxycarbonylamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Phenylcarbonylamino-, N-Alkyl-phenylcarbonylamino-, Phenylsulfonylamino-, N-Alkylphenylsulfonylamino- oder durch eine (R_8NR_7)-CO-NR_6-Gruppe substituiert ist, wobei R_6 bis R_8 wie vorstehend erwähnt definiert sind,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, die durch eine Pyrrolidino-, Piperidino-, 2-Oxo-pyrrolidino-, 2-Oxo-piperidino-, Morpholino-, 1-Piperazinyl-, 4-Alkyl-1-piperazinyl- oder 4-Alkylcarbonyl-1-piperazinyl-Gruppe substituiert ist, wobei die vorstehend erwähnten heterocyclischen Teile am Kohlenstoffgerüst jeweils

durch 1 oder 2 Alkylgruppen oder durch eine Hydroxymethylgruppe substituiert sein können,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkenylgruppe, wobei der Vinylteil nicht an das Stickstoffatom der $(R_{11}NR_{10})$-Gruppe gebunden sein kann,

eine Tetrahydrofurfurylgruppe,

eine Cyclopentylgruppe, in der die Methylengruppe in 3-Stellung durch ein Sauerstoffatom, eine Imino-, Alkylimino-, Alkylcarbonylimino-, Formylimino-, Aminocarbonylimino-, Alkylaminocarbonylimino-, Alkoxycarbonylimino-, Alkylsulfonylimino-, Dialkylaminocarbonylimino- oder Cyaniminogruppe ersetzt ist,

eine Cyclohexylgruppe, in der die Methylengruppe in 3-Stellung durch eine Imino-, Alkyl-imino-, Alkylcarbonyl-imino-, Alkoxycarbonyl-imino- oder Alkylsulfonyl-imino-Gruppe ersetzt ist,

eine Cyclohexylgruppe, in der die Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom, eine Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Phenyl-imino-, N-Phenylalkyl-imino-, N-Formyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Phenylcarbonyl-imino-, N-Alkoxycarbonyl-imino-, N-Cyan-imino-, N-Aminocarbonyl-imino-, N-Alkylaminocarbonyl-imino-, N,N-Dialkylaminocarbonyl-imino-, N-Alkyl-N-oxido-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino- oder N-Phenylsulfonyl-imino-Gruppe ersetzt ist,

eine Cyclohexylgruppe, in der eine Methylengruppe durch eine Carbonylgruppe ersetzt ist,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 2 Methylgruppen substituierte Cyclopentyl- oder Cyclohexylgruppe, die durch eine Carboxyalkoxy-, Alkoxycarbonylalkoxy-, Aminocarbonylalkoxy-, Alkylaminocarbonylalkoxy-, Dialkylaminocarbonylalkoxy-, Pyrrolidinocarbonylalkoxy-, Piperidinocarbonylalkoxy-, Morpholinocarbonylalkoxy-, Carboxyalkyl-, Alkoxycarbonylalkyl-, Amino-

carbonylalkyl-, Alkylaminocarbonylalkyl-, Dialkylaminocarbonylalkyl-, Pyrrolidinocarbonylalkyl-, Piperidinocarbonylalkyl- oder Morpholinocarbonylalkylgruppe substituiert ist,

eine Cyclohexylmethylgruppe, wobei der Cyclohexylteil durch eine Carboxy-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Alkoxycarbonyl- oder Hydroxymethylgruppe substituiert ist,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 3 Methylgruppen substituierte Cyclohexyl- oder Cyclohexylmethylgruppe, in denen jeweils im Cyclohexylteil zwei Wasserstoffatome durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 4 oder 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 3 oder 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 oder 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Kohlenstoffatom getrennt sind, oder 1 oder 2 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch zwei Kohlenstoffatome getrennt sind,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 3 Methylgruppen substituierte 5-Norbornen-2-yl- oder 5-Norbornen-2-yl-methylgruppe,

eine 3-Chinuclidinyl-, 4-Chinuclidinyl- oder Adamantylgruppe bedeuten, oder

R_{10} ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe und R_{11} eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe bedeuten,

deren Tautomere, deren Stereoisomere und deren Salze,

wobei die vorstehend erwähnten Phenylreste jeweils durch ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, durch eine Nitro-, Alkyl-, Alk-

oxy-, Trifluormethyl- oder Hydroxygruppe substituiert sein können und, sofern nichts anderes erwähnt wurde, die vorstehend erwähnten Alkyl-, Alkylen- und Alkoxyteile jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten sowie, sofern nichts anderes erwähnt wurde, jedes Kohlenstoffatom in den vorstehend erwähnten Alkylen- oder Cycloalkylenteilen, das an ein Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom gebunden ist, an kein weiteres Halogen-, Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom gebunden sein kann.

Ganz besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind diejenigen, in denen

R_a ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe,

R_b eine 2-Naphthyl-, 1,2,3,4-Tetrahydro-6-naphthyl- oder 5-Indanylgruppe oder eine durch die Reste R_1 bis R_3 substituierte Phenylgruppe, wobei

R_1 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom,

eine C_{1-4}-Alkyl-, C_{1-4}-Alkoxy-, C_{3-6}-Cycloalkyl-, C_{5-6}-Cycloalkoxy-, Cyano-, Methoxycarbonyl-, Ethoxycarbonyl-, Ethinyl- oder Nitrogruppe,

eine durch 1 bis 3 Fluoratome substituierte Methyl- oder Methoxygruppe,

eine durch 1 bis 5 Fluoratome substituierte Ethyl- oder Ethoxygruppe,

R_2 ein Wasserstoff-, Fluor- oder Chloratom, eine Methyl-, Hydroxy-, Methoxy-, Amino-, C_{1-2}-Alkylamino-, Di-C_{1-2}-alkylamino-, C_{1-2}-Alkylcarbonylamino-, C_{1-2}-Alkylsulfonylamino-, Trifluormethylsulfonylamino- oder Trifluormethylgruppe,

R_3 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor- oder Bromatom oder eine Methylgruppe und

R_C ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, Phenyl-, 4-Methoxyphenyl-, Methylsulfenyl-, Methylsulfinyl- oder Methylsulfonylgruppe,

eine Hydroxygruppe,

eine C_{1-4}-Alkoxygruppe,

eine Ethoxygruppe, die in 2-Stellung durch eine Hydroxy-, Methoxy-, Morpholino- oder (2-Hydroxyethyl)aminogruppe substituiert ist,

eine 2-Propyloxygruppe, die in 1-Stellung durch eine Methoxy- oder Dimethylaminogruppe substituiert ist,

eine Methoxygruppe, die durch eine 2-Tetrahydrofuryl-, 2-Tetrahydropyranyl- oder 3-Methyl-3-oxetanylgruppe substituiert ist,

eine Cyclobutyloxygruppe,

eine gegebenenfalls in 3-Stellung durch eine Hydroxygruppe substituierte Cyclopentyloxygruppe,

eine Cyclopentyloxygruppe, in der die Methylengruppe in 3-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder durch eine Methyl-iminogruppe ersetzt ist,

eine Cyclohexyloxygruppe, die in 2-,3- oder 4-Stellung durch eine Hydroxygruppe oder in 4-Stellung auch durch eine Di-(C_{1-2}-alkyl)amino-, Methoxy-, Carboxy-, Methoxycarbonyl-, Dimethylaminocarbonyl-, Methylaminocarbonyl-, Aminocarbonyl-, Acetylamino-, Methylsulfonylamino-, Methoxycarbonylamino-oder tert.Butyloxycarbonylaminogruppe substituiert sein kann,

eine Cyclohexyloxygruppe, in der die Methylengruppe in 3-Stellung durch eine Methyl-iminogruppe oder die Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder durch eine Methyl-imino-, Acetyl-imino-, tert.Butyloxycarbonyl-imino-, Methoxycarbonyl-imino- oder Methylsulfonyl-iminogruppe ersetzt ist,

eine Allyloxygruppe,

eine 1-Azetidinylgruppe,

eine 1-Pyrrolidinylgruppe, die durch 1 oder 2 Methylgruppen, durch eine Carboxy-, Methoxycarbonyl-, Ethoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl- oder Di-(C_{1-2})-alkylaminocarbonylgruppe oder in 3-Stellung durch eine Amino-, C_{1-2}-Alkylamino-, Di-(C_{1-2}-alkyl)amino-, C_{1-2}-Alkoxycarbonylamino-, C_{1-2}-Alkylcarbonylamino-, C_{1-2}-Alkylsulfonylamino-, Cyanamino-, Formylamino- oder Dimethylaminocarbonylaminogruppe substituiert sein kann,

eine 1-Pyrrolidinylgruppe, in der in 3-Stellung zwei Wasserstoffatome durch eine n-C_{4-5}-Alkylenbrücke ersetzt sind,

eine 1-Piperidinylgruppe, die durch 1 bis 4 Methylgruppen, durch eine Phenyl-, Hydroxy-C_{1-2}-alkyl-, Carboxy-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-, Di-(C_{1-2})-alkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl- oder Morpholinocarbonylgruppe oder in 3- oder 4-Stellung durch eine Hydroxy-, C_{1-2}-Alkoxy-, Amino-, C_{1-2}-Alkylamino-, Di-(C_{1-2})-Alkylamino-, C_{1-2}-Alkylcarbonylamino-, C_{1-2}-Alkoxycarbonylamino-, Formylamino-, Cyanamino-, Di-(C_{1-2}-alkyl)aminocarbonylamino-, C_{1-2}-Alkylsulfonylamino- oder Cyanogruppe substituiert sein kann,

eine 1-Piperidinylgruppe, in der in 3-Stellung oder in 4-Stellung zwei Wasserstoffatome durch eine n-C_{4-5}-Alkylenbrücke oder durch eine -O-CH_2CH_2-O-Brücke ersetzt sind,

eine 1-Piperidinylgruppe, die durch 1 oder 2 Methylgruppen oder eine Phenylgruppe und zusätzlich in 3- oder 4-Stellung durch eine Hydroxygruppe substituiert ist,

eine 1-Piperidinylgruppe, in der in 2,5-Stellung zwei Wasserstoffatome durch eine $-CH_2-$ oder $-CH_2CH_2$-Brücke ersetzt sind,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 2 Methylgruppen substituierte 1-Piperidinylgruppe, in der die Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, C_{1-2}-Alkyl-imino-, (2-Hydroxyethyl)-imino-, 2-(2-Hydroxyethoxy)ethyl-imino-, (2-Aminoethyl)-imino-, C_{1-3}-Alkylaminocarbonylmethyl-imino-, N-Oxido-N-C_{1-2}-alkylimino-, Phenyl-imino-, Benzyl-imino-, Acetyl-imino- oder Methansulfonyl-iminogruppe ersetzt ist,

eine 1-Azacyclohept-1-yl-Gruppe, in der zwei Wasserstoffatome in 3,6-Stellung durch eine $-CH_2CH_2$-Gruppe ersetzt sein können,

eine 1,2,3,4-Tetrahydro-isochinolin-2-yl- oder 2,3,4,5-Tetrahydro-1H-3-benzazepin-3-yl-Gruppe oder

eine ($R_{10}NR_{11}$)-Gruppe darstellen, in der

R_{10} ein Wasserstoffatom, eine C_{1-4}-Alkylgruppe oder eine 2-Hydroxyethylgruppe und

R_{11} ein Wasserstoffatom,

eine C_{1-6}-Alkyl-, C_{3-6}-Cycloalkyl-methyl- oder Phenyl-C_{1-3}-alkylgruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methylgruppen substituierte C_{3-6}-Cycloalkyl-, Allyl- oder Propargylgruppe,

eine Phenylgruppe, die durch eine Hydroxy- oder Methylgruppe oder in 4-Stellung durch eine N-C_{1-2}-Alkyl-C_{1-2}-alkylcarbonyl-

amino-, N-C_{1-2}-Alkyl-(2-hydroxyethyl)amino-, Di-(2-hydroxyethyl)amino-, 1-Pyrrolidinyl-, 2-Oxo-1-pyrrolidinyl-, 2-Hydroxymethyl-1-pyrrolidinyl-, 2-Oxo-1-imidazolidinyl-, 3-Methyl-2-oxo-1-imidazolidinyl- oder Morpholinogruppe substituiert sein kann,

eine durch eine Carboxy-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-, Di-C_{1-2}-alkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl- oder Morpholinocarbonylgruppe substituierte Methylgruppe,

eine gegebenenfalls durch eine Methylgruppe substituierte Ethylgruppe, die in 2-Stellung durch eine Hydroxy-, C_{1-2}-Alkoxy-, Amino-, C_{1-2}-Alkylamino-, Di-C_{1-2}-alkylamino-, Acetylamino-, 1-Pyrrolidinyl-, Morpholino-, 1-Piperazinyl-, 4-Methyl-1-piperazinyl-, 4-Acetyl-1-piperazinyl-, 4-Aminocarbonyl-1-piperazinyl-, 4-Dimethylaminocarbonyl-1-piperazinyl-, 4-Methylaminocarbonyl-1-piperazinyl-, 4-Methylsulfonyl-1-piperazinyl-, 4-Methoxycarbonyl-1-piperazinyl-oder 4-Cyano-1-piperazinylgruppe substituiert ist,

eine 2-Hydroxyethylgruppe, die im Ethylteil durch eine Phenyl-, 3-Hydroxyphenyl-, 4-Hydroxyphenyl-, 4-Nitrophenyl- oder Benzylgruppe substituiert ist, wobei der Ethylteil der vorstehend erwähnten Gruppen zusätzlich durch eine Methyl-, Hydroxymethyl- oder Methoxymethylgruppe substituiert sein kann,

eine durch eine 1,4,7,10-Tetraoxacyclododecyl-, 1,4,7,10,13-Pentaoxacyclopentadecyl- oder eine 1,4,7,10,13,16-Hexaoxacyclooctadecylgruppe substituierte Methylgruppe,

eine 2,2,2-Trifluorethylgruppe,

eine in 3-Stellung durch eine Hydroxy-, Cyano-, Carboxy-, Aminocarbonyl-, Methylaminocarbonyl-, Dimethylaminocarbonyl-, Formylamino, Methoxycarbonylamino-, Morpholino- oder 2-Oxo-1-pyrrolidinylgruppe substituierte Propylgruppe,

eine in 4-Stellung durch eine Hydroxygruppe substituierte Butylgruppe,

eine in 1-Stellung durch eine Hydroxygruppe und zusätzlich in 3-Stellung durch eine Methylgruppe substituierte 3-Butylgruppe,

eine in 1-Stellung durch eine Hydroxygruppe und zusätzlich in 3-Stellung durch eine Methylgruppe substituierte 2-Butylgruppe,

eine in 1-Stellung durch eine Hydroxygruppe und zusätzlich in 4-Stellung durch eine Methylgruppe substituierte 4-Pentylgruppe,

eine 2,3-Dihydroxypropyl-, 3-Amino-2-hydroxy-propyl-, Tris-(3-hydroxypropyl)methyl-, 1,3-Dihydroxy-2-propyl-, 1,3-Dihydroxy-2-methyl-2-propyl- oder Tris-(hydroxymethyl)methylgruppe,

eine 2-Propylgruppe, die in 2-Stellung durch eine Hydroxymethyl-, C_{1-2}-Alkoxymethyl-, Carboxy-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, N-C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-, N,N-Di-C_{1-2}-alkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl- oder (2-Hydroxyethyl)aminocarbonylgruppe substituiert ist,

eine 4-Tetrahydropyranyl-, Tetrahydrofurfuryl-, 1-Desoxy-1-D-sorbityl- oder 2-(2-Hydroxyethyloxy)ethylgruppe,

eine in 2- oder 3-Stellung durch eine Hydroxygruppe oder in 1-Stellung durch eine Hydroxymethylgruppe substituierte Cyclopentylgruppe,

eine in 2-, 3- oder 4-Stellung durch eine Hydroxymethyl-, Hydroxy-, C_{1-2}-Alkoxy-, (C_{1-4}-Alkoxy)carbonylamino-, Amino-, C_{1-2}-Alkylamino-, Di-C_{1-2}-alkylamino-, Carboxy-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-, Di-C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-, N-Oxido-di-C_{1-2}-alkylamino-, Pyrrolidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, C_{1-2}-Alkylcarbonyl-

amino- oder C_{1-2}-Alkylsulfonylaminogruppe substituierte Cyclohexylgruppe, die zusätzlich durch eine Methylgruppe substituiert sein kann,

eine Cyclohexylgruppe, die in 4-Stellung durch eine 1-Pyrrolidinyl-, 2-Oxo-1-pyrrolidinyl-, 2-Hydroxymethyl-1-pyrrolidinyl-, N-C_{1-2}-Alkyl-(2-hydroxyethyl)amino-, Di-(2-hydroxyethyl)amino-, N-C_{1-2}-Alkyl-C_{1-2}-alkylcarbonylamino-, Morpholino-, 2-Oxo-1-imidazolidinyl-, 3-Methyl-2-oxo-1-imidazolidinyl-, Carboxy-C_{1-2}-alkyl-, Carboxy-C_{1-2}-alkoxy-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-C_{1-2}-alkyl-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-C_{1-2}-alkoxy-, Aminocarbonyl-C_{1-2}-alkyl-, Aminocarbonyl-C_{1-2}-alkoxy-, C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-C_{1-2}-alkyl-, C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-C_{1-2}-alkoxy-, Di-C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-C_{1-2}-alkyl-, Di-C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-C_{1-2}-alkoxy-, Pyrrolidinocarbonyl-C_{1-2}-alkyl-, Pyrrolidinocarbonyl-C_{1-2}-alkoxy-, Morpholinocarbonyl-C_{1-2}-alkyl-, Morpholinocarbonyl-C_{1-2}-alkoxy-, Piperidinocarbonyl-C_{1-2}-alkyl- oder Piperidinocarbonyl-C_{1-2}-alkoxygruppe substituiert ist,

eine Cyclohexylgruppe, in der zwei Wasserstoffatome in 4-Stellung durch eine Oxo-Gruppe oder eine n-C_{4-5}-Alkylenbrücke ersetzt sind,

eine Cyclohexylgruppe, in der die Methylengruppe in 4-Stellung durch eine Imino-, C_{1-2}-Alkyl-imino-, Phenyl-C_{1-2}-alkyl-imino-, N-Methyl-N-oxido-imino-, Formyl-imino-, C_{1-2}-Alkylcarbonyl-imino-, C_{1-2}-Alkylsulfonyl-imino-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-imino-, Cyan-imino-, Aminocarbonyl-imino-, C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-imino- oder N,N-Di-C_{1-2}-alkylaminocarbonyliminogruppe ersetzt ist,

eine Cyclohexylgruppe, in der die Methylengruppe in 3-Stellung durch eine Imino-, C_{1-2}-Alkyl-imino-, C_{1-2}-Alkylcarbonyl-imino-, C_{1-2}-Alkylsulfonyl-imino- oder C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-iminogruppe ersetzt ist,

eine Cyclopentylgruppe, in der die Methylengruppe in 3-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder eine Imino-, C_{1-2}-Alkyl-imino-, Formyl-imino-, C_{1-2}-Alkylcarbonyl-imino-, C_{1-2}-Alkylsulfonyl-imino-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-imino-, Cyan-imino- oder N,N-Di-C_{1-2}-alkylaminocarbonyliminogruppe ersetzt ist,

eine Cyclohexylmethylgruppe, wobei der Cyclohexylteil in 4-Stellung durch eine Carboxy-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-, N,N-Di-C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl- oder Morpholinocarbonylgruppe substituiert ist,

eine Norbornan-2-yl-, Norbornan-2-yl-methyl-, 5-Norbornen-2-yl-methyl-, Bornyl-, 3-Chinuclidinyl- oder Adamantylgruppe oder

R_{10} ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe und R_{11} eine Hydroxy- oder Methoxygruppe bedeuten,

insbesondere diejenigen Verbindungen, in denen

R_a ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe,

R_b eine 2-Naphthyl- oder 5-Indanylgruppe oder eine durch die Reste R_1 bis R_3 substituierte Phenylgruppe, wobei

R_1 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom, eine Methyl-, Ethyl-, tert.Butyl-, Trifluormethyl-, Ethinyl-, Methoxy-, Cyclopropyl-, Trifluormethoxy-, Cyano-, Ethoxycarbonyl- oder Nitrogruppe,

R_2 ein Wasserstoff-, Fluor- oder Chloratom, eine Amino-, Methyl- oder Trifluormethylgruppe und

R_3 ein Wasserstoff-, Chlor- oder Bromatom darstellen, und

R_c ein Wasserstoffatom, eine Hydroxy-, Methoxy-, Butyloxy-, Cyclopentyloxy-, 2-[(2-Hydroxyethyl)amino]-ethoxy-, Methylsulfenyl-, Methylsulfinyl- oder Methylsulfonylgruppe,

eine 1-Azetidinyl- oder eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Methylgruppen substituierte 1-Pyrrolidinylgruppe,

eine durch eine Hydroxymethylgruppe substituierte 1-Piperidinylgruppe,

eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Methylgruppen substituierte 1-Piperidinylgruppe, in der die Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, Methyl-imino-, N-Oxido-N-methyl-imino-, 2-Propylaminocarbonyl-methyl-imino-, Phenyl-imino-, Benzyl-imino-, Acetyl-imino- oder Methylsulfonyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine in 3-Stellung durch eine Hydroxy- oder Diethylaminocarbonylgruppe oder in 4-Stellung durch eine Hydroxy-, Carboxy-, Methoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Methylaminocarbonyl-, Dimethylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Amino-, Acetylamino-, Methoxycarbonylamino-, Formylamino-, Cyanamino-, Dimethylaminocarbonylamino-, Methylsulfonylamino- oder Phenylgruppe substituierte 1-Piperidinylgruppe,

eine 4-Hydroxy-4-phenyl-1-piperidinylgruppe,

eine 1,2,3,4-Tetrahydro-isochinolin-2-yl- oder 2,3,4,5-Tetrahydro-1H-3-benzazepin-3-yl-Gruppe,

eine 1-Piperidinylgruppe, in der in 4-Stellung zwei Wasserstoffatome durch eine $-OCH_2CH_2-O-$-Brücke ersetzt sind,

eine 1-Azacyclohept-1-yl-Gruppe, in der zwei Wasserstoffatome in 3- und 6-Stellung durch eine $-CH_2-CH_2-$Gruppe ersetzt sind, oder

eine $(R_{10}NR_{11})$-Gruppe darstellen, in der

R_{10} ein Wasserstoffatom, eine C_{1-4}-Alkylgruppe oder eine 2-Hydroxyethylgruppe und

R_{11} ein Wasserstoffatom,

eine gegebenenfalls durch eine Methylgruppe substituierte Phenylgruppe,

eine Phenylgruppe, die in 4-Stellung durch eine Morpholino- oder 2-(Hydroxymethyl)-1-pyrrolidinylgruppe substituiert ist,

eine C_{1-6}-Alkyl-, C_{3-6}-Cycloalkyl-, Phenyl-C_{1-3}-alkyl-, Cyclopropylmethyl-, Allyl-, Propargyl-, 2-Hydroxyethyl-, 1-Hydroxy-2-propyl-, 3-Hydroxypropyl-, 4-Hydroxybutyl-, 2-Methoxyethyl-, 1-Adamantyl-, Norbornan-2-yl-, Aminocarbonylmethyl-, 2-(Dimethylamino)ethyl-, 3-Chinuclidinyl-, 2,2,2-Trifluorethyl-, 4-Piperidinyl-, 1-Methyl-4-piperidinyl-, 1-Methyl-1-oxido-4-piperidinyl-, 1-Ethoxycarbonyl-4-piperidinyl-, 1-Benzyl-4-piperidinyl-, 2-(2-Hydroxyethoxy)ethyl-, 4-Tetrahydropyranyl-, 1-Hydroxy-2-methyl-2-propyl-, 1-Methoxy-2-methyl-2-propyl-, 2-(Methylaminocarbonyl)-2-propyl-, 2,3-Dihydroxy-1-propyl-, 2-(Morpholino)ethyl-, 1-Desoxy-1-D-sorbityl-, 3-(2-Oxo-1-pyrrolidinyl)-propyl-, Tris-(hydroxymethyl)methyl-, 1,3-Dihydroxy-2-propyl-, 1,3-Dihydroxy-2-methyl-2-propyl- oder Bornylgruppe,

eine 2-Hydroxyethylgruppe, die in 2-Stellung durch eine Phenylgruppe und in 1-Stellung zusätzlich durch eine Methyl- oder Hydroxymethylgruppe substituiert ist,

eine Methylcyclohexyl-, 4-Carboxy-cyclohexyl-, 4-Methoxycarbonyl-cyclohexyl-, 4-Dimethylaminocarbonyl-cyclohexyl-, 4-(1-Pyrrolidinylcarbonyl)-cyclohexyl-, 4-(Morpholinocarbonyl)-cyclohexyl-, 4-[2-(Methoxycarbonyl)ethyl]cyclohexyl-, 4-(2-Carboxy-ethyl)cyclohexyl-, 4-(tert.Butyloxycarbonylamino)-cyclohexyl-, 4-Methoxycyclohexyl-, 4-Aminocyclohexyl-, 4-(Dimethylamino)cyclohexyl-, 4-(N,N-Dimethyl-N-oxido-amino)cyclo-

hexyl-, 4-(Acetylamino)-cyclohexyl-, 4-(Methylsulfonylamino)-cyclohexyl-, 2-Hydroxycyclohexyl-, 4-Hydroxycyclohexyl-, 4-(Hydroxymethyl)-cyclohexyl-, 4-Hydroxy-4-methyl-cyclohexyl- oder 4-Oxocyclohexylgruppe,

eine durch eine 1,4,7,10,13-Pentaoxacyclopentadecyl- oder eine 1,4,7,10,13,16-Hexaoxacyclooctadecylgruppe substituierte Methylgruppe, oder

R_{10} eine Methylgruppe und R_{11} eine Methoxygruppe darstellen, bedeuten,

deren Tautomere, deren Stereoisomere und deren Salze.

Als besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I seien folgende erwähnt:

(1) 4-[(3,4-Dichlorphenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(2) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(3) 4-[(3-Bromphenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(4) 4-[(3-Chlorphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin,

(5) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-amino-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(6) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(trans-4-aminocyclohexyl)-amino]pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(7) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(N-(trans-4-hydroxycyclohexyl)-N-methyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(8) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-methoxycarbonylamino-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(9) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[trans-4-(morpholinocarbonyl)-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(10) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[trans-4-(pyrrolidinocarbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(11) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[N-(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)-N-methyl-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(12) 4-[(4-Amino-3,5-dichlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(13) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-(morpholino)-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(14) 4-[(4-Amino-3,5-dibrom-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(15) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-morpholino-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin,

(16) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(17) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-propyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(18) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(19) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-amino-1-piperidin-yl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(20) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(21) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-formylamino-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(22) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-ethoxycarbonyl-4-piperidinyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(23) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(3-chinuclidinyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(24) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(4-amino-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(25) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(26) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(morpholino-carbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(27) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(pyrrolidinocarbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(28) 4-[(4-Fluorphenyl)amino)-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin,

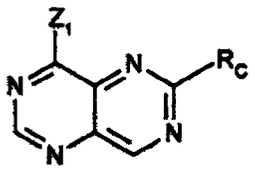
(29) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin und

(30) 4-[(3,4-Dichlorphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

sowie deren Salze.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel I lassen sich beispielsweise nach folgenden Verfahren herstellen:

a) Umsetzung einer Verbindung der allgemeinen Formel



, (II)

in der
R_c wie eingangs definiert ist und
Z_1 eine Austrittsgruppe wie ein Halogenatom, z.B. ein Chlor- oder Bromatom oder eine Methylsulfonyl- oder eine Hydroxygruppe darstellt, mit einem Amin der allgemeinen Formel

$$H-(R_aNR_b) \quad , (III)$$

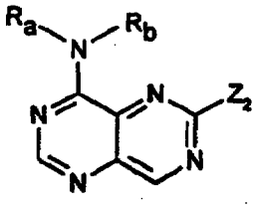
in der
R_a und R_b wie eingangs definiert sind.

Die Umsetzung wird zweckmäßigerweise in einem Lösungsmittel wie Isopropanol, Butanol, Tetrahydrofuran, Dioxan, Toluol, Chlorbenzol, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, Ethylenglycolmonomethylether, Ethylenglycoldiethylether oder Sulfolan gegebenenfalls in Gegenwart einer anorganischen Base, z.B. Natriumcarbonat oder Kaliumhydroxid, oder einer tertiären organischen Base, z.B. Triethylamin oder Pyridin, wobei letztere gleichzeitig auch als Lösungsmittel dienen können, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionsbeschleunigers wie eines Kupfersalzes, eines entsprechenden Amin-hydrohalogenids oder Alkalihalogenids bei Temperaturen zwischen 0 und 200°C, vorzugsweise jedoch bei Temperaturen zwischen 60 und 150°C, durchgeführt. Die Umsetzung kann jedoch auch ohne Lösungsmittel oder in einem Überschuß der eingesetzten Verbindung der allgemeinen Formel III durchgeführt werden.
Handelt es sich bei Z_1 um eine Hydroxygruppe, so wird die Umsetzung zweckmäßigerweise in Gegenwart von Hexamethyldisilazan, vorzugsweise ohne weitere Lösungsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionsbeschleunigers wie einer organischen

Säure wie z.B. Toluolsulfonsäure bei Temperaturen zwischen 0 und 200°C, vorzugsweise jedoch bei Temperaturen zwischen 60 und 180°C, durchgeführt.

b) Zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel I, in der R_c einen der für R_c eingangs erwähnten über ein Sauerstoff- oder Stickstoffatom, über eine Mercapto- oder Sulfenylgruppe mit dem Pyrimido[5,4-d]pyrimidin verknüpften Reste darstellt:

Umsetzung einer Verbindung der allgemeinen Formel



, (IV)

in der
R_a und R_b wie eingangs definiert sind und
Z_2 eine Austrittsgruppe wie ein Halogenatom, eine substituierte Hydroxy-, Mercapto-, Sulfinyl- oder Sulfonylgruppe wie ein Chlor- oder Bromatom, eine Methoxy-, Ethoxy-, Phenoxy-, Methylsulfinyl-, Ethylsulfinyl-, Methylsulfonyl- oder Ethylsulfonylgruppe darstellt, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel

$$X_1 - H \qquad , (V)$$

in der
X_1 einen der für R_c eingangs erwähnten über ein Sauerstoff- oder Stickstoffatom, über eine Mercapto- oder Sulfenylgruppe mit dem Pyrimido[5,4-d]pyrimidin verknüpften Reste darstellt.

Die Umsetzung wird zweckmäßigerweise in einem Lösungsmittel wie Isopropanol, Butanol, Tetrahydrofuran, Dioxan, Toluol, Chlorbenzol, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, Ethylenglycolmonomethylether, Ethylenglycoldiethylether oder Sulfolan gegebenenfalls in Gegenwart einer anorganischen Base, z.B. Na-

triumcarbonat oder Kaliumhydroxid, oder einer tertiären organischen Base, z.B. Triethylamin oder Pyridin, wobei letztere gleichzeitig auch als Lösungsmittel dienen können, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionsbeschleunigers wie eines Kupfersalzes, eines entsprechenden Amin-hydrohalogenids oder Alkalihalogenids bei Temperaturen zwischen 0 und 150°C, vorzugsweise jedoch bei Temperaturen zwischen 20 und 120°C, durchgeführt. Die Umsetzung kann jedoch auch ohne Lösungsmittel oder in einem Überschuß der eingesetzten Verbindung der allgemeinen Formel V durchgeführt werden.

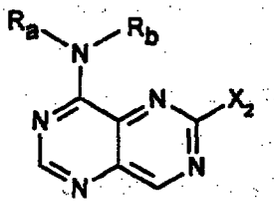
Mit einem Alkohol der allgemeinen Formel V wird die Umsetzung vorzugsweise in einem entsprechenden Alkohol und gegebenenfalls in Gegenwart einer organischen oder anorganischen Base wie mit dem entsprechenden Alkalimetallalkoholat bei Temperaturen zwischen 0 und 100°C durchgeführt.

Mit einer Mercaptoverbindung der allgemeinen Formel V wird die Umsetzung vorzugsweise in einem Lösungsmittel mit dem entsprechenden Alkalimetallthiolat oder dem entsprechenden Thiol und einer organischen oder anorganischen Base bei Temperaturen zwischen 0 und 80°C durchgeführt.

Mit Wasser wird die Umsetzung vorzugsweise in Wasser oder in einem Gemisch aus Wasser und einem organischen Lösungsmittel in Gegenwart eines Alkalihydroxids oder einer Mineralsäure wie Salzsäure oder Schwefelsäure bei Temperaturen zwischen 20 und 100°C durchgeführt.

c) Zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel I, in der R_C einen der für R_C eingangs erwähnten über eine Sulfinyl- oder Sulfonylgruppe mit dem Pyrimido[5,4-d]pyrimidin verknüpften Reste darstellt:

Oxidation einer Verbindung der allgemeinen Formel



, (VI)

in der
R_a und R_b wie eingangs definiert sind und
X_2 einen der für R_c eingangs erwähnten über ein Schwefelatom mit dem Pyrimido[5,4-d]pyrimidin verknüpften Reste darstellt.

Die Oxidation wird vorzugsweise in einem Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch, z.B. in Wasser, Wasser/Pyridin, Aceton, Methylenchlorid, Eisessig, Eisessig/Acetanhydrid, verdünnter Schwefelsäure oder Trifluoressigsäure, je nach dem verwendeten Oxidationsmittel zweckmäßigerweise bei Temperaturen zwischen -80 und 100°C durchgeführt.

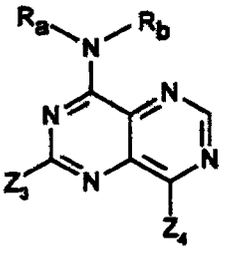
Zur Herstellung einer entsprechenden Sulfinylverbindung der allgemeinen Formel I wird die Oxidation zweckmäßigerweise mit einem Äquivalent des verwendeten Oxidationsmittels durchgeführt, z.B. mit Wasserstoffperoxid in Eisessig, Trifluoressigsäure oder Ameisensäure bei 0 bis 20°C oder in Aceton bei 0 bis 60°C, mit einer Persäure wie Perameisensäure in Eisessig oder Trifluoressigsäure bei 0 bis 50°C oder mit m-Chlorperbenzoesäure in Methylenchlorid, Chloroform oder Dioxan bei -20 bis 80°C, mit Natriummetaperjodat in wäßrigem Methanol oder Ethanol bei -15 bis 25°C, mit Brom in Eisessig oder wäßriger Essigsäure gegebenenfalls in Gegenwart einer schwachen Base wie Natriumacetat, mit N-Bromsuccinimid in Ethanol, mit tert.Butylhypochlorit in Methanol bei -80 bis -30°C, mit Jodbenzodichlorid in wäßrigem Pyridin bei 0 bis 50°C, mit Salpetersäure in Eisessig bei 0 bis 20°C, mit Chromsäure in Eisessig oder in Aceton bei 0 bis 20°C und mit Sulfurylchlorid in Methylenchlorid bei -70°C, der hierbei erhaltene Thioether-Chlor-Komplex wird zweckmäßigerweise mit wäßrigem Ethanol hydrolysiert.

Zur Herstellung einer Sulfonylverbindung der allgemeinen Formel I wird die Oxidation ausgehend von einer entsprechenden Sulfinylverbindung zweckmäßigerweise mit einem oder mehr Äquivalenten des verwendeten Oxidationsmittels oder ausgehend von einer entsprechenden Sulfenylverbindung zweckmäßigerweise mit zwei oder mehr Äquivalenten des verwendeten Oxidationsmittels durchgeführt, z.B. mit Wasserstoffperoxid in Eisessig/-Acetanhydrid, Trifluoressigsäure oder in Ameisensäure bei 20 bis 100°C oder in Aceton bei 0 bis 60°C, mit einer Persäure wie Perameisensäure oder m-Chlorperbenzoesäure in Eisessig, Trifluoressigsäure, Methylenchlorid oder Chloroform bei Temperaturen zwischen 0 und 60°C, mit Salpetersäure in Eisessig bei 0 bis 20°C, mit Chromsäure oder Kaliumpermanganat in Eisessig, Wasser/Schwefelsäure oder in Aceton bei 0 bis 20°C.

Zur Herstellung von Gemischen aus einer Sulfinyl- und Sulfonylverbindung der allgemeinen Formel I wird die Oxidation ausgehend von einer entsprechenden Sulfenylverbindung vorzugsweise in Methylenchlorid durch Behandlung mit einer entsprechenden Menge von m-Chlorperbenzoesäure bei Temperaturen zwischen 20°C und der Rückflußtemperatur des Reaktionsgemisches durchgeführt.

d) Zur Herstellung einer Verbindung der allgemeinen Formel I, in der R_C ein Wasserstoffatom darstellt:

Enthalogenierung einer Verbindung der allgemeinen Formel



, (VII)

in der
R_a und R_b wie eingangs definiert sind,

Z_3 und Z_4, die gleich oder verschieden sein können, jeweils ein Halogenatom wie ein Chlor- oder Bromatom darstellen.

Die Enthalogenierung wird mit Jodwasserstoffsäure und Diphosphortetrajodid, wobei die Jodwasserstoffsäure gleichzeitig als Lösungsmittel dienen kann, bei Temperaturen zwischen 20 und 100°C, vorzugsweise bei 50°C, und durch anschließendes Erhitzen mit einem Hydrierungskatalysator wie Palladium/Kohle in einem geeigneten Lösungsmittel wie Dioxan, Essigester oder Ethylglycoldiethylether auf 70 bis 125°C, vorzugsweise auf die Rückflußtemperatur des verwendeten Lösungsmittels, durchgeführt.

Erhält man erfindungsgemäß eine Verbindung der allgemeinen Formel I, die eine Amino-, Alkylamino- oder Iminogruppe enthält, so kann diese mittels Acylierung oder Sulfonylierung in eine entsprechende Acyl- oder Sulfonylverbindung der allgemeinen Formel I übergeführt werden oder

eine Verbindung der allgemeinen Formel I, die eine Amino-, Alkylamino- oder Iminogruppe enthält, so kann diese mittels Alkylierung oder reduktiver Alkylierung in eine entsprechende Alkylverbindung der allgemeinen Formel I übergeführt werden oder

eine Verbindung der allgemeinen Formel I, die eine Carboxygruppe enthält, so kann diese mittels Veresterung in einen entsprechenden Ester der allgemeinen Formel I übergeführt werden oder

eine Verbindung der allgemeinen Formel I, die eine Carboxy- oder Estergruppe enthält, so kann diese mittels Amidierung in ein entsprechendes Amid der allgemeinen Formel I übergeführt werden oder

eine Verbindung der allgemeinen Formel I, die eine primäre oder sekundäre Hydroxygruppe enthält, so kann diese mittels

Oxidation in eine entsprechende Carbonylverbindung der allgemeinen Formel I übergeführt werden.

Die nachträgliche Veresterung wird gegebenenfalls in einem Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch wie Methylenchlorid, Dimethylformamid, Benzol, Toluol, Chlorbenzol, Tetrahydrofuran, Benzol/Tetrahydrofuran oder Dioxan oder besonders vorteilhaft in einem entsprechenden Alkohol gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure wie Salzsäure oder in Gegenwart eines wasserentziehenden Mittels, z.B. in Gegenwart von Chlorameisensäureisobutylester, Thionylchlorid, Trimethylchlorsilan, Schwefelsäure, Methansulfonsäure, p-Toluolsulfonsäure, Phosphortrichlorid, Phosphorpentoxid, N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid, N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid/N-Hydroxysuccinimid oder 1-Hydroxy-benztriazol und gegebenenfalls zusätzlich in Gegenwart von 4-Dimethylamino-pyridin, N,N'-Carbonyldiimidazol oder Triphenyl-phosphin/Tetrachlorkohlenstoff, zweckmäßigerweise bei Temperaturen zwischen 0 und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0 und 80°C, durchgeführt.

Die nachträgliche Acylierung oder Sulfonylierung wird gegebenenfalls in einem Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch wie Methylenchlorid, Dimethylformamid, Benzol, Toluol, Chlorbenzol, Tetrahydrofuran, Benzol/Tetrahydrofuran oder Dioxan mit einem entsprechenden Acyl- oder Sulfonylderivat gegebenenfalls in Gegenwart einer tertiären organischen Base oder in Gegenwart einer anorganischen Base oder in Gegenwart eines wasserentziehenden Mittels, z.B. in Gegenwart von Chlorameisensäureisobutylester, Thionylchlorid, Trimethylchlorsilan, Schwefelsäure, Methansulfonsäure, p-Toluolsulfonsäure, Phosphortrichlorid, Phosphorpentoxid, N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid, N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid/N-Hydroxysuccinimid oder 1-Hydroxy-benztriazol und gegebenenfalls zusätzlich in Gegenwart von 4-Dimethylamino-pyridin, N,N'-Carbonyldiimidazol oder Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff, zweckmäßigerweise bei Temperaturen zwischen 0 und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0 und 80°C, durchgeführt.

Die nachträgliche Alkylierung wird gegebenenfalls in einem Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch wie Methylenchlorid, Dimethylformamid, Benzol, Toluol, Chlorbenzol, Tetrahydrofuran, Benzol/Tetrahydrofuran oder Dioxan mit einem Alkylierungsmittel wie einem entsprechenden Halogenid oder Sulfonsäureester, z.B. mit Methyljodid, Ethylbromid, Dimethylsulfat oder Benzylchlorid, gegebenenfalls in Gegenwart einer tertiären organischen Base oder in Gegenwart einer anorganischen Base zweckmäßigerweise bei Temperaturen zwischen 0 und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0 und 100°C, durchgeführt.

Die nachträgliche reduktive Alkylierung wird mit einer entsprechenden Carbonylverbindung wie Formaldehyd, Acetaldehyd, Propionaldehyd, Aceton oder Butyraldehyd in Gegenwart eines komplexen Metallhydrids wie Natriumborhydrid, Lithiumborhydrid oder Natriumcyanoborhydrid zweckmäßigerweise bei einem pH-Wert von 6-7 und bei Raumtemperatur oder in Gegenwart eines Hydrierungskatalysators, z.B. mit Wasserstoff in Gegenwart von Palladium/Kohle, bei einem Wasserstoffdruck von 1 bis 5 bar durchgeführt. Die Methylierung wird jedoch vorzugsweise in Gegenwart von Ameisensäure als Reduktionsmittel bei erhöhten Temperaturen, z.B. bei Temperaturen zwischen 60 und 120°C, durchgeführt.

Die nachträgliche Amidierung wird durch Umsetzung eines entsprechenden reaktionsfähigen Carbonsäurederivates mit einem entsprechenden Amin gegebenenfalls in einem Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch wie Methylenchlorid, Dimethylformamid, Benzol, Toluol, Chlorbenzol, Tetrahydrofuran, Benzol/Tetrahydrofuran oder Dioxan, wobei das eingesetzte Amin gleichzeitig als Lösungsmittel dienen kann, gegebenenfalls in Gegenwart einer tertiären organischen Base oder in Gegenwart einer anorganischen Base oder mit einer entsprechenden Carbonsäure in Gegenwart eines wasserentziehenden Mittels, z.B. in Gegenwart von Chlorameisensäureisobutylester, Thionylchlorid,

Trimethylchlorsilan, Schwefelsäure, Methansulfonsäure, p-Toluolsulfonsäure, Phosphortrichlorid, Phosphorpentoxid, N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid, N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid/N-Hydroxysuccinimid oder 1-Hydroxy-benztriazol und gegebenenfalls zusätzlich in Gegenwart von 4-Dimethylamino-pyridin, N,N'-Carbonyldiimidazol oder Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff, zweckmäßigerweise bei Temperaturen zwischen 0 und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0 und 80°C, durchgeführt.

Die nachträgliche Oxidation wird gegebenenfalls in einem Lösungsmittel wie Methylenchlorid, Wasser, Dimethylformamid, Benzol, Chlorbenzol, Tetrahydrofuran oder Dioxan mit einem Oxidationsmittel wie Chromschwefelsäure, Chromtrioxid und Pyridin, Pyridiniumdichromat, Pyridiniumchlorochromat, Oxalylchlorid/Dimethylsulfoxid/Triethylamin, Tetra-n-propylperruthenat/N-Methylmorpholin-N-oxid oder Rutheniumtrichlorid/-Natriummetaperiodat zweckmäßigerweise bei Temperaturen zwischen -80 und 100°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen -80°C und Raumtemperatur, durchgeführt.

Bei den vorstehend beschriebenen Umsetzungen können gegebenenfalls vorhandene reaktive Gruppen wie Hydroxy-, Carboxy-, Phosphono-, O-Alkyl-phosphono-, Amino-, Alkylamino- oder Iminogruppen während der Umsetzung durch übliche Schutzgruppen geschützt werden, welche nach der Umsetzung wieder abgespalten werden.

Beispielsweise kommt als Schutzrest für eine Hydroxygruppe die Trimethylsilyl-, Acetyl-, Benzoyl-, Methyl-, Ethyl-, tert.Butyl-, Trityl-, Benzyl- oder Tetrahydropyranylgruppe,

als Schutzreste für eine Carboxygruppe die Trimethylsilyl-, Methyl-, Ethyl-, tert.Butyl-, Benzyl- oder Tetrahydropyranylgruppe,

als Schutzreste für eine Phosphonogruppe eine Alkylgruppe wie die Methyl-, Ethyl-, Isopropyl- oder n-Butylgruppe, die Phenyl- oder Benzylgruppe,

als Schutzreste für eine Amino-, Alkylamino- oder Iminogruppe die Formyl-, Acetyl-, Trifluoracetyl-, Ethoxycarbonyl-, tert.-Butoxycarbonyl-, Benzyloxycarbonyl-, Benzyl-, Methoxybenzyl- oder 2,4-Dimethoxybenzylgruppe und für die Aminogruppe zusätzlich die Phthalylgruppe und

als Schutzreste für das Stickstoffatom einer 1-Aza-bicycloalkylgruppe wie der Chinuclidinylgruppe die Benzylgruppe oder Boran in Betracht.

Die gegebenenfalls anschließende Abspaltung eines verwendeten Schutzrestes erfolgt beispielsweise hydrolytisch in einem wässrigen Lösungsmittel, z.B. in Wasser, Isopropanol/Wasser, Essigsäure/Wasser, Tetrahydrofuran/Wasser oder Dioxan/Wasser, in Gegenwart einer Säure wie Trifluoressigsäure, Salzsäure oder Schwefelsäure oder in Gegenwart einer Alkalibase wie Natriumhydroxid oder Kaliumhydroxid oder aprotisch, z.B. in Gegenwart von Jodtrimethylsilan, bei Temperaturen zwischen 0 und 120°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 10 und 100°C.

Die Abspaltung eines Benzyl-, Methoxybenzyl- oder Benzyloxycarbonylrestes erfolgt jedoch beispielsweise hydrogenolytisch, z.B. mit Wasserstoff in Gegenwart eines Katalysators wie Palladium/Kohle in einem geeigneten Lösungsmittel wie Methanol, Ethanol, Essigsäureethylester oder Eisessig gegebenenfalls unter Zusatz einer Säure wie Salzsäure bei Temperaturen zwischen 0 und 100°C, vorzugsweise jedoch bei Raumtemperaturen zwischen 20 und 60°C, und bei einem Wasserstoffdruck von 1 bis 7 bar, vorzugsweise jedoch von 3 bis 5 bar. Die Abspaltung eines 2,4-Dimethoxybenzylrestes erfolgt jedoch vorzugsweise in Trifluoressigsäure in Gegenwart von Anisol.

Die Abspaltung eines tert.-Butyl- oder tert.-Butyloxycarbonylrestes erfolgt vorzugsweise durch Behandlung mit einer Säure wie Trifluoressigsäure oder Salzsäure oder durch Behandlung mit Jodtrimethylsilan gegebenenfalls unter Verwendung eines Lösungsmittels wie Methylenchlorid, Dioxan, Methanol oder Diethylether.

Die Abspaltung eines Trifluoracetylrestes erfolgt vorzugsweise durch Behandlung mit einer Säure wie Salzsäure gegebenenfalls in Gegenwart eines Lösungsmittels wie Essigsäure bei Temperaturen zwischen 50 und 120°C oder durch Behandlung mit Natronlauge gegebenenfalls in Gegenwart eines Lösungsmittels wie Tetrahydrofuran bei Temperaturen zwischen 0 und 50°C.

Die Abspaltung eines Phthalylrestes erfolgt vorzugsweise in Gegenwart von Hydrazin oder eines primären Amins wie Methylamin, Ethylamin oder n-Butylamin in einem Lösungsmittel wie Methanol, Ethanol, Isopropanol, Toluol/Wasser oder Dioxan bei Temperaturen zwischen 20 und 50°C.

Die Spaltung des Komplexes einer 1-Aza-bicycloalkylgruppe wie der Chinuclidinylgruppe mit Boran erfolgt vorzugsweise durch Behandlung mit einer Säure wie Salzsäure und gegebenenfalls in Gegenwart eines Lösungsmittels wie Methanol, Ethanol, Essigsäure oder Dioxan bei Temperaturen zwischen 0°C und der Siedetemperatur des Reaktionsgemisches. Bei dieser Umsetzung kann eine gegebenenfalls vorhandene Estergruppe gleichzeitig in die entsprechende Carboxygruppe übergeführt werden.

Die Spaltung nur eines Alkylrestes von einer O,O'-Dialkylphosphonogruppe erfolgt beispielsweise mit Natriumiodid in einem Lösungsmittel wie Aceton, Ethyl-methylketon, Acetonitril oder Dimethylformamid bei Temperaturen zwischen 40 und 150°C, vorzugsweise jedoch bei Temperaturen zwischen 60 und 100°C.

Die Abspaltung beider Alkylreste von einer O,O'-Dialkyl-phosphonogruppe erfolgt beispielsweise mit Jodtrimethylsilan,

Bromtrimethylsilan oder Chlortrimethylsilan/Natriumiodid in einem Lösungsmittel wie Methylchlorid, Chloroform oder Acetonitril bei Temperaturen zwischen 0°C und der Siedetemperatur des Reaktionsgemisches, vorzugsweise jedoch bei Temperaturen zwischen 20 und 60°C.

Ferner können die erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel I, wie bereits eingangs erwähnt wurde, in ihre Enantiomeren und/oder Diastereomeren aufgetrennt werden. So können beispielsweise cis-/trans-Gemische in ihre cis- und trans-Isomere, und Verbindungen mit mindestens einem optisch aktiven Kohlenstoffatom in ihre Enantiomeren aufgetrennt werden.

So lassen sich beispielsweise die erhaltenen cis-/trans-Gemische durch Chromatographie in ihre cis- und trans-Isomeren, die erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel I, welche in Racematen auftreten, nach an sich bekannten Methoden (siehe Allinger N. L. und Eliel E. L. in "Topics in Stereochemistry", Vol. 6, Wiley Interscience, 1971)) in ihre optischen Antipoden und Verbindungen der allgemeinen Formel I mit mindestens 2 asymmetrischen Kohlenstoffatomen auf Grund ihrer physikalisch-chemischen Unterschiede nach an sich bekannten Methoden, z.B. durch Chromatographie und/oder fraktionierte Kristallisation, in ihre Diastereomeren auftrennen, die, falls sie in racemischer Form anfallen, anschließend wie oben erwähnt in die Enantiomeren getrennt werden können.

Die Enantiomerentrennung erfolgt vorzugsweise durch Säulentrennung an chiralen Phasen oder durch Umkristallisieren aus einem optisch aktiven Lösungsmittel oder durch Umsetzen mit einer, mit der racemischen Verbindung Salze oder Derivate wie z.B. Ester oder Amide bildenden optisch aktiven Substanz, insbesondere Säuren und ihre aktivierten Derivate oder Alkohole, und Trennen des auf diese Weise erhaltenen diastereomeren Salzgemisches oder Derivates, z.B. auf Grund von verschiedenen Löslichkeiten, wobei aus den reinen diastereomeren Salzen oder Derivaten die freien Antipoden durch Einwirkung geeigneter

Mittel freigesetzt werden können. Besonders gebräuchliche, optisch aktive Säuren sind z.B. die D- und L-Formen von Weinsäure oder Dibenzoylweinsäure, Di-o-Tolylweinsäure, Äpfelsäure, Mandelsäure, Camphersulfonsäure, Glutaminsäure, Asparaginsäure oder Chinasäure. Als optisch aktiver Alkohol kommt beispielsweise (+)- oder (-)-Menthol und als optisch aktiver Acylrest in Amiden beispielsweise (+)-oder (-)-Menthyloxycarbonyl in Betracht.

Desweiteren können die erhaltenen Verbindungen der Formel I in ihre Salze, insbesondere für die pharmazeutische Anwendung in ihre physiologisch verträglichen Salze mit anorganischen oder organischen Säuren, übergeführt werden. Als Säuren kommen hierfür beispielsweise Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Fumarsäure, Bernsteinsäure, Milchsäure, Zitronensäure, Weinsäure oder Maleinsäure in Betracht.

Außerdem lassen sich die so erhaltenen neuen Verbindungen der Formel I, falls diese eine Carboxy-, Phosphono-, O-Alkylphosphono-, Sulfo- oder 5-Tetrazolylgruppe enthalten, gewünschtenfalls anschließend in ihre Salze mit anorganischen oder organischen Basen, insbesondere für die pharmazeutische Anwendung in ihre physiologisch verträglichen Salze, überführen. Als Basen kommen hierbei beispielsweise Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Arginin, Cyclohexylamin, Ethanolamin, Diethanolamin und Triethanolamin in Betracht.

Die als Ausgangsstoffe verwendeten Verbindungen der allgemeinen Formeln II bis V sind teilweise literaturbekannt oder man erhält diese nach an sich literaturbekannten Verfahren (siehe Beispiele I bis XVII).

Wie bereits eingangs erwähnt, weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel I und ihre physiologisch verträglichen Salze wertvolle pharmakologische Eigenschaften auf, insbesondere eine spezifische Hemmwirkung auf die durch den Epidermal Growth Factor-Rezeptor (EGF-R) vermittelte Si-

gnaltransduktion, wobei diese beispielsweise durch eine Inhibition der Ligandenbindung, der Rezeptordimerisierung oder der Tyrosinkinase selbst bewirkt werden kann. Außerdem ist es möglich, daß die Signalübertragung an weiter abwärtsliegenden Komponenten blockiert wird.

Die biologischen Eigenschaften der neuen Verbindungen wurden wie folgt geprüft:

Die Hemmung der EGF-R vermittelten Signalübertragung kann z.B. mit Zellen nachgewiesen werden, die humanen EGF-R exprimieren und deren Überleben und Proliferation von Stimulierung durch EGF bzw. TGF-alpha abhängt. Hier wurde eine Interleukin-3- (IL-3) abhängige Zellinie murinen Ursprungs verwendet, die derart genetisch verändert wurde, daß sie funktionellen humanen EGF-R exprimiert. Die Proliferation dieser F/L-HERc genannten Zellen kann daher entweder durch murines IL-3 oder durch EGF stimuliert werden (siehe von Rüden, T. et al. in EMBO J. 7, 2749-2756 (1988) und Pierce, J. H. et al. in Science 239, 628-631 (1988)).

Als Ausgangsmaterial für die F/L-HERc Zellen diente die Zellinie FDC-P_1, deren Herstellung von Dexter, T. M. et al. in J. Exp. Med. 152, 1036-1047 (1980) beschrieben wurde. Alternativ können aber auch andere Wachstumsfaktor-abhängige Zellen verwendet werden (siehe beispielsweise Pierce, J. H. et al. in Science 239, 628-631 (1988), Shibuya, H. et al. in Cell 70, 57-67 (1992) und Alexander, W. S. et al. in EMBO J. 10, 3683-3691 (1991)). Zur Expression der humanen EGF-R cDNA (siehe Ullrich, A. et al. in Nature 309, 418-425 (1984)) wurden rekombinante Retroviren verwendet, wie in von Rüden, T. et al., EMBO J. 7, 2749-2756 (1988) beschrieben, mit dem Unterschied, daß zur Expression der EGF-R cDNA der retrovirale Vektor LXSN (siehe Miller, A. D. et al. in BioTechniques 7, 980-990 (1989)) eingesetzt wurde und als Verpackungszelle die Linie GP+E86 (siehe Markowitz, D. et al. in J. Virol. 62, 1120-1124 (1988)) diente.

Der Test wurde wie folgt durchgeführt:

F/L-HERc Zellen wurden in RPMI/1640 Medium (BioWhittaker), supplementiert mit 10 % foetalem Rinderserum (FCS, Boehringer Mannheim), 2 mM Glutamin (BioWhittaker), Standardantibiotika und 20 ng/ml humanem EGF (Promega), bei 37°C und 5% CO_2 kultiviert. Zur Untersuchung der inhibitorischen Aktivität der erfindungsgemäßen Verbindungen wurden 1,5 x 10^4 Zellen pro Vertiefung in Triplikaten in 96-Loch-Platten in obigem Medium (200µl) kultiviert, wobei die Proliferation der Zellen entweder mit EGF (20 ng/ml) oder murinem IL-3 stimuliert wurde. Als Quelle für IL-3 dienten Kulturüberstände der Zellinie X63/0 mIL-3 (siehe Karasuyama, H. et al.in Eur. J. Immunol. 18, 97-104 (1988)). Die erfindungsgemäßen Verbindungen wurden in 100% Dimethylsulfoxid (DMSO) gelöst und in verschiedenen Verdünnungen den Kulturen zugefügt, wobei die maximale DMSO Konzentration 1% betrug. Die Kulturen wurden für 48 Stunden bei 37°C inkubiert.

Zur Bestimmung der inhibitorischen Aktivität der erfindungsgemäßen Verbindungen wurde die relative Zellzahl mit dem Cell Titer 96^{TM} AQ_{ueous} Non-Radioactive Cell Proliferation Assay (Promega) in O.D. Einheiten gemessen. Die relative Zellzahl wurde in Prozent der Kontrolle (F/LHERc Zellen ohne Inhibitor) berechnet und die Wirkstoffkonzentration, die die Proliferation der Zellen zu 50% hemmt (IC_{50}), abgeleitet. Hierbei wurden folgende Ergebnisse erhalten:

Verbindung (Beispiel Nr.)	Hemmung der EGF-abhängigen Proliferation IC_{50} [µM]	Hemmung der IL-3-abhängigen Proliferation IC_{50} [µM]
1(3)	2,5	>10
1(5)	1,0	>10
1(6)	0,005	>10
1(10)	0,5	>10
1(13)	0,3	>10
1(17)	0,04	> 3
1(19)	0,05	>10
1(23)	0,025	> 3
1(58)	0,02	> 3
1(62)	0,040	> 1
1(72)	0,003	> 3
1(108)	0,050	>10
1(109)	0,015	10
1(110)	0,002	>10
3(5)	0,05	> 3
3(18)	0,05	> 3
3(19)	0,015	> 3
3(45)	0,020	> 1
4(1)	2	>10
1(129)	0.008	>20
1(183)	0.005	>20
1(204)	0.0008	>10
1(134)	0.013	>10
1(207)	0.002	>10
1(201)	0.032	>10
1(61)	0.032	9
1(140)	0.005	>10
1(170)	0.015	>10
1(197)	0.9	10
1(193)	0.004	10

Die erfindungsgemäßen Verbindungen inhibieren auch die EGF-stimulierte Proliferation der menschlichen Tumorzellinie KB, die von einem oralen epidermoiden Karzinom stammt und den EGF-Rezeptor überexprimiert (z.B. Aboud-Pirak, E. et al, J. Natl. Cancer. Inst. 80, 1605-11 (1988)). KB-Zellen (bezogen von ATCC) wurden in DMEM (BioWhittaker) in Anwesenheit von 10% FCS (Boehringer Mannheim), 50µM beta-Mercaptoethanol und Standardantibiotika passagiert. Als Indikator für die EGF/TGF-alpha-stimulierte Zellproliferation wurde die EGF-induzierte DNA-Synthese durch Messung des Einbaus radioaktiv markierten Thymidins bestimmt. Dazu wurden die Zellen zweimal gewaschen und 1500 Zellen pro Vertiefung einer 96-Loch-Platte in 200µl IMDM (BioWhittaker) ohne Serum in Anwesenheit von 50µM beta-Mercaptoethanol, Standardantibiotika, TGF-alpha [10ng/ml] oder EGF [20ng/ml] und von verschiedenen Konzentrationen der erfindungsgemäßen Substanzen ausplattiert (Triplikate, maximale DMSO-Konzentration 1%, siehe Proliferations-Test mit F/L-HERc-Zellen). Nach 60 Stunden wurde für etwa 16 - 18h [^{3}H]-Thymidin (0.1µCi in 10µl) zugegeben. Die anschließende Messung des Thymidin-Einbaus ergab für die Verbindungen 2, 6, 17, 18, 19, 72, 83, 93, 95, 96 und 104 des Beispiels 1 IC_{50}-Werte von 0.1 - 1 µM für die Hemmung der EGF/TGF-alpha-stimulierten KB-Zell-Proliferation.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel I hemmen somit die Signaltransduktion durch Tyrosinkinasen, wie am Beispiel des humanen EGF-Rezeptors gezeigt wurde, und sind daher nützlich zur Behandlung pathophysiologischer Prozesse, die durch Überfunktion von Tyrosinkinasen hervorgerufen werden. Das sind z.B. benigne oder maligne Tumoren, insbesondere Tumoren epithelialen und neuroepithelialen Ursprungs, Metastasierung sowie die abnorme Proliferation vaskulärer Endothelzellen (Neoangiogenese).

Außerdem können die Verbindungen der allgemeinen Formel I und deren physiologisch verträglichen Salze zur Behandlung anderer Krankheiten verwendet werden, die durch aberrante Funktion von

Tyrosinkinasen verursacht werden, wie z.B. epidermaler Hyperproliferation (Psoriasis), inflammatorischer Prozesse, Erkrankungen des Immunsystems, Hyperproliferation hämatopoetischer Zellen etc. .

Auf Grund ihrer biologischen Eigenschaften können die erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen pharmakologisch wirksamen Verbindungen angewendet werden, beispielsweise in der Tumortherapie in Monotherapie oder in Kombination mit anderen Anti-Tumor Therapeutika, beispielsweise in Kombination mit Topoisomerase-Inhibitoren (z.B. Etoposide), Mitoseinhibitoren (z.B. Vinblastin), mit Nukleinsäuren interagierenden Verbindungen (z.B. cis-Platin, Cyclophosphamid, Adriamycin), Hormon-Antagonisten (z.B. Tamoxifen), Inhibitoren metabolischer Prozesse (z.B. 5-FU etc.), Zytokinen (z.B. Interferonen), Antikörpern etc. Diese Kombinationen können entweder simultan oder sequentiell verabreicht werden.

Bei der pharmazeutischen Anwendung werden die erfindungsgemäßen Verbindungen in der Regel bei warmblütigen Wirbeltieren, insbesondere beim Menschen, in Dosierungen von 0,01-100 mg/kg Körpergewicht, vorzugsweise bei 0,1-15 mg/kg verwendet. Zur Verabreichung werden diese mit einem oder mehreren üblichen inerten Trägerstoffen und/oder Verdünnungsmitteln, z.B. mit Maisstärke, Milchzucker, Rohrzucker, mikrokristalliner Zellulose, Magnesiumstearat, Polyvinylpyrrolidon, Zitronensäure, Weinsäure, Wasser, Wasser/Äthanol, Wasser/Glycerin, Wasser/Sorbit, Wasser/Polyäthylenglykol, Propylenglykol, Stearylalkohol, Carboxymethylcellulose oder fetthaltigen Substanze wie Hartfett oder deren geeigneten Gemischen in übliche galenische Zubereitungen wie Tabletten, Dragées, Kapseln, Pulver, Suspensionen, Lösungen, Sprays oder Zäpfchen eingearbeitet.

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung näher erläutern ohne diese zu beschränken:

Beispiel I

4-[(3-Methylphenyl)amino]-2,8-dichlor-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

Zu 1,0 g 2,4,8-Trichlor-pyrimido[5,4-d]pyrimidin in 20 ml Methylenchlorid werden bei 0 bis -10°C 0,45 g 3-Methylanilin und 0,42 g Triethylamin zugegeben und 1,5 Stunden bei dieser Temperatur gerührt. Anschließend wird mit Wasser versetzt, die organische Phase abgetrennt, getrocknet und eingeengt. Der Rückstand wird durch Chromatographie über eine Aluminiumoxid-Säule mit Petrolether/Essigester (10:2) gereinigt.
Ausbeute: 0,51 g (39 % der Theorie),
Schmelzpunkt: 180-181°C

Analog Beispiel I werden folgende Verbindungen erhalten:

(1) 4-[(3-Trifluormethylphenyl)amino]-2,8-dichlor-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,56 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 2:1)

(2) 4-[(3-Bromphenyl)amino]-2,8-dichlor-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 205-208°C
R_f-Wert: 0,50 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 2:1)

(3) 4-[(3-Chlorphenyl)amino]-2,8-dichlor-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,67 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 2:1)

(4) 4-(Phenylamino]-2,8-dichlor-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,50 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 2:1)

Beispiel II

4-Hydroxy-6-methylsulfinyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin und
4-Hydroxy-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

2,0 g 4-Hydroxy-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]pyrimidin und 8 g 3-Chlorperoxybenzoesäure (Gehalt: 50 %) werden in 50 ml Methylenchlorid 3 Stunden kräftig gerührt. Der Niederschlag wird abgesaugt, mit Essigester gewaschen und getrocknet.
Ausbeute: 2,2 g,
R_f-Wert: 0,27 und 0,50 (Kieselgel; Methylenchlorid/Essigester/Methanol = 10:4:3)

Beispiel III

4-Hydroxy-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

2,2 g eines Gemisches aus 4-Hydroxy-6-methylsulfinyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin und 4-Hydroxy-6-methylsulfonyl-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin werden in 10 ml Cyclopropylamin 3 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen wird eingeengt, der Rückstand wird mit Wasser gerührt und der Feststoff abgesaugt und getrocknet.
Ausbeute: 1,7 g,
Schmelzpunkt: >240°C
R_f-Wert: 0,45 (Kieselgel; Methylenchlorid/Essigester/Methanol = 10:4:3)

Beispiel IV

4-Chlor-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

1,7 g 4-Hydroxy-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin werden mit 50 ml Thionylchlorid unter Zusatz von 4 Tropfen Dimethylformamid 1,5 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Das Reaktionsgemisch wird eingeengt, mit Methylenchlorid versetzt und nochmals eingeengt. Der Rückstand wird dann zwischen Methylenchlorid und einer wäßrigen Kaliumcarbonatlösung verteilt. Die

wäßrige Phase wird noch zweimal mit Methylenchlorid extrahiert und die vereinigten organischen Phasen getrocknet und eingeengt.Das Produkt wird ohne weitere Reinigung weiter umgesetzt.
Schmelzpunkt: 135°C (Zers.)
R_f-Wert: 0,53 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

Analog Beispiel IV wird folgende Verbindung erhalten:

(1) 4-Chlor-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 90-92°C
R_f-Wert: 0,63 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 7:3)

Beispiel V

5-Amino-2-methylthio-pyrimidin-4-carbonsäure

131,4 g 5-Brom-2-methylthio-pyrimidin-4-carbonsäure, 860 ml konz. wäßriges Ammoniak und 2,42 g Kupfer(II)sulfat, gelöst in 34 ml Wasser, werden in einem Bombenrohr 4 Stunden bei 95°C geschüttelt. Nach dem Abkühlen wird der Niederschlag abgesaugt. Der Niederschlag wird in 600 ml heißem Wasser gelöst und die Lösung über Aktivkohle filtriert. Das Filtrat wird im Eisbad abgekühlt und mit konzentrierter Salzsäure auf einen pH von 3 gebracht. Der Niederschlag wird abgesaugt und durch Lösen in verdünnter Natronlauge und Ausfällen mit Salzsäure gereinigt.
Ausbeute: 54,6 g (56 % der Theorie),
Schmelzpunkt: 187°C
R_f-Wert: 0,35 (Kieselgel; Essigester/Methanol = 2:1)

Beispiel VI

4-Hydroxy-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

Methode A:
25 g 5-Amino-2-methylthio-pyrimidin-4-carbonsäure und 150 ml Formamid werden in einem Ölbad gerührt, wobei innerhalb einer halben Stunde die Ölbadtemperatur auf 180°C gesteigert wird. Es

wird noch 1,5 Stunden bei dieser Temperatur gerührt. Dann wird das Reaktionsgemisch heiß auf 750 ml eines Eis/Wasser-Gemisches gegeben. Nach 2 Stunden wird abgesaugt, mit Wasser gewaschen und getrocknet.

Methode B:
Eine Mischung von 69 g 5-Amino-2-methylthio-pyrimidin-4-carbonsäure, 155 g Formamidinacetat und 300 ml Ethoxyethanol wird 2 Stunden zum Sieden erhitzt. Dann wird das Reaktionsgemisch auf 10°C abgekühlt, mit 250 ml Wasser versetzt und eine Stunde bei 10°C stehen gelassen. Dann wird abgesaugt, mit Wasser gewaschen und getrocknet.
Ausbeute: 59 g (82 % d. Theorie).
Schmelzpunkt: >240°C
R_f-Wert: 0,63 (Kieselgel; Methylenchlorid/Essigester/Methanol = 10:4:3)

Beispiel VII

4-Dibenzylamino-cyclohexanon

1,0 ml Oxalylchlorid werden in 40 ml Methylenchlorid gelöst und auf -60°C abgekühlt. Man tropft 1,7 ml Dimethylsulfoxid in 20 ml Methylenchlorid zu, rührt noch zwei Minuten und tropft dann langsam 2,95 g 4-N,N-Dibenzylamino-cyclohexanol in 20 ml Methylenchlorid hinzu. Nach 15 Minuten werden 7,0 ml Triethylamin zugetropft. Nach weiteren 5 Minuten wird auf Raumtemperatur erwärmt und 12 Stunden gerührt. Die Reaktionsmischung wird einmal mit je 100 ml Wasser und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen. Nach dem Trocknen über Natriumsulfat wird das Lösungsmittel im Rotationsverdampfer abdestilliert und das Rohprodukt über eine Kieselgelsäule mit Petrolether/Essigester (10:3, dann 10:5, dann 10:10) gereinigt.
Ausbeute: 2,91 g (99 % der Theorie),
Schmelzpunkt: 63-64°C

Beispiel VIII

4-Dibenzylamino-1-methyl-cyclohexanol

In eine Lösung von 10,7 g 4-Dibenzylamino-cyclohexanon in 200 ml Ether wird eine Lösung von 15,1 ml 3,0 molarem Methylmagnesiumbromid in 200 ml Ether getropft. Die Mischung wird dann 45 Minuten zum Sieden erhitzt, auf 0°C abgekühlt und vorsichtig mit 300 ml gesättigter Ammoniumchloridlösung versetzt. Die Etherphase wird abgetrennt, mit je 100 ml gesättigter Natriumhydrogencarbonat-Lösung und gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen und über Natriumsulfat getrocknet. Nach dem Abdestillieren des Lösungsmittels im Rotationsverdampfer wird das Rohprodukt über eine Aluminiumoxid-Säule mit Petrolether/-Essigester (10:1, dann 10:3) gereinigt; dabei werden die Diastereomeren getrennt.

cis-Diastereomer:

Ausbeute: 3,73 g (33 % der Theorie),

Schmelzpunkt: 91-95°C

R_f-Wert: 0,52 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 10:3)

trans-Diastereomer:

Ausbeute: 2,33 g (21 % der Theorie),

Schmelzpunkt: 111-115°C

R_f-Wert: 0,29 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 10:3)

Beispiel IX

cis-4-Amino-1-methylcyclohexanol

Eine Lösung von 4,2 g cis-4-Dibenzylamino-methyl-cyclohexanol in 30 ml Methanol wird mit 1,5 g Palladium auf Kohle (10 %) versetzt und bei Raumtemperatur und 3,5 bar hydriert, bis kein Wasserstoff mehr aufgenommen wird. Nach Filtration und Verdampfen des Lösungsmittels im Rotationsverdampfer erhält man 2,75 g eines öligen Rückstands, der ohne weitere Reinigung eingesetzt wird.

R_f-Wert: 0,06 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 10:4)

Analog Beispiel IX wird folgende Verbindung erhalten:

(1) trans-4-Amino-1-methylcyclohexanol
Schmelzpunkt: 225-230°C
R_f-Wert: 0,13 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 10:4)

Beispiel X

trans-4-(Hydroxymethyl)-cyclohexylamin

Zu 0,9 g Lithiumaluminiumhydrid in 70 ml Tetrahydrofuran wird bei Raumtemperatur unter Rühren portionsweise eine Lösung von 1,4 g trans-4-Amino-cyclohexancarbonsäure-methylester in 30 ml Tetrahydrofuran getropft. Danach wird noch eine Stunde zum Sieden erhitzt. Man kühlt auf 0°C und tropft vorsichtig solange 10%ige Kalilauge hinzu, bis sich ein weißer Niederschlag gebildet hat. Man dekantiert und wäscht den Niederschlag viermal durch Zugabe von je 50 ml Tetrahydrofuran und Abdekantieren. Die organischen Phasen werden vereinigt, das Lösungsmittel im Rotationsverdampfer abdestilliert und der Rückstand an Aluminiumoxid mit einem Essigester/Methanol/konz.Ammoniak-Gemisch (500:180:1) säulenchromatographisch gereinigt.
Schmelzpunkt: 135-139°C
Ausbeute: 0.99 g (84% der Theorie),
R_f-Wert: 0,48 (Aluminiumoxid; Essigester/Methanol/konz.Ammoniak = 500:180:1)

Beispiel XI

4-Tetrahydropyranon-oxim

Zu einer Mischung von 5.2 g Hydroxylamin-hydrochlorid und 4.8 g Natriumacetat in 50 ml Wasser wird bei 60°C unter Rühren 5.0 g 4-Tetrahydropyranon getropft. Nach einer weiteren Stunde bei 60°C wird abkühlen gelassen und die Lösung dreimal mit je 50 ml Ether extrahiert. Dann werden die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat getrocknet, das Solvens im Rotationsverdampfer abdestilliert und der Rückstand ohne weitere Reinigung in die nächste Reaktion eingesetzt.
Schmelzpunkt: 50-52°C

Ausbeute: 4,2 g (74% der Theorie),
R_f-Wert: 0,30 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Beispiel XII

4-Amino-tetrahydropyran

4.2 g 4-Tetrahydropyranon-oxim werden in 100 ml Ethanol gelöst und nach Zugabe von 0.5 g Palladium auf Kohle (10%) in einer Parr-Apparatur 2.5 Stunden bei 90°C und 5 bar Wasserstoffdruck hydriert. Nach dem Abkühlen wird das Solvens im Rotationsverdampfer abdestilliert und der Rückstand ohne weitere Reinigung weiter verwendet.
Ausbeute: 0.7 g (19%der Theorie) eines farblosen Öls,
R_f-Wert: 0,45 (Kieselgel; Methylenchlorid/Essigester/Methanol = 10:4:2)

Beispiel XIII

4-Brom-cyclopropylbenzol

Zu einer Mischung von 11.8 g Cyclopropylbenzol, 11 g Kaliumacetat und 100 ml Eisessig werden bei 5°C 16 g Brom langsam zugetropft. Nach 5 Stunden bei 5°C und 2 Stunden bei 10°C wird die Mischung auf Eiswasser gegossen und dreimal mit je 100 ml Ether extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden je einmal mit Natriumthiosulfat-Lösung, Wasser und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen und über Natriumsulfat getrocknet. Das Solvens wird im Rotationsverdampfer abdestilliert und der Rückstand mit Petrolether über Aluminiumoxid filtriert. Die Destillation des Rückstandes ergibt 6,2 g eines farblosen Öls (Kp_{12} = 108 - 112°C).
R_f-Wert: 0,65 (Aluminiumoxid ; Petrolether)

Beispiel XIV

4-Brom-2-nitro-cyclopropylbenzol

Zu einer Mischung von 12 g 4-Brom-cyclopropylbenzol und 20 ml konzentrierter Schwefelsäure wird bei 0°C eine Mischung von 4.3 ml 65%iger Salpetersäure und 5 ml konzentrierter Schwefelsäure innerhalb 30 Minuten zugegeben. Dann wird die Mischung auf Eiswasser gegossen und dreimal mit je 100 ml Methylenchlorid extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet. Das Solvens wird im Rotationsverdampfer abdestilliert und der Rückstand mit Petrolether an Aluminiumoxid säulenchromatographisch gereinigt.
Ausbeute: 3,6 g (25% der Theorie) eines farblosen Öls,
R_f-Wert: 0,30 (Aluminiumoxid ; Petrolether)

Beispiel XV

2-Amino-cyclopropylbenzol

3,5 g 4-Brom-2-nitro-cyclopropylbenzol werden in 30 ml Ethanol gelöst und nach Zugabe von 0.5 g Palladium auf Kohle (10%) in einer Parr-Apparatur 2.5 Stunden bei Raumtemperatur und 5 bar Wasserstoffdruck hydriert. Nach dem Abkühlen wird das Solvens im Rotationsverdampfer abdestilliert, der Rückstand mit 1N Natronlauge alkalisch gestellt und dreimal mit je 50 ml Ether extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet, das Solvens im Rotationsverdampfer abdestilliert und der Rückstand säulenchromatographisch gereinigt.
Ausbeute: 1,3 g (72% der Theorie) eines farblosen Öls,
R_f-Wert: 0,43 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

Beispiel XVI

2,5-Diamino-benzonitril

10 g 2-Cyano-4-nitro-anilin werden in 50 ml Dimethylformamid gelöst und nach Zugabe von 0.5 g Palladium auf Kohle (10%) in einer Parr-Apparatur 2 Stunden bei Raumtemperatur und 3 bar Wasserstoffdruck hydriert. Nach dem Abkühlen wird filtriert, das Solvens im Rotationsverdampfer abdestilliert und der Rückstand ohne weitere Reinigung weiter verwendet.
Ausbeute: 10,2 g (100% der Theorie) eines braunen, chromatographisch einheitlichen Öls,
R_f-Wert: 0,63 (Kieselgel; Methylenchlorid/Essigester/Methanol = 10:4:2)

Beispiel XVII

1,4-Diamino-2,6-dibrom-benzol

3.0 g 2,6-Dibrom-4-nitro-anilin werden in 150 ml Ethanol, 150 ml Essigester und 30 ml Dimethylformamid gelöst und nach Zugabe von 0.5 g Platin auf Kohle (5%) in einer Parr-Apparatur 1 Stunde bei Raumtemperatur und 1,5 bar Wasserstoffdruck hydriert. Nach dem Abkühlen wird filtriert, das Solvens im Rotationsverdampfer abdestilliert und der Rückstand säulenchromatographisch gereinigt.
Ausbeute: 1,4 g eines farblosen Öls,
R_f-Wert: 0,47 (Kieselgel; Petroläther/Essigester = 2:1)

Beispiel XVIII

3-(N-Benzyloxycarbonyl)amino-tetrahydrofuran

Eine Lösung von 0,74 g 3-Tetrahydrofuran-carbonsäure, 2 ml Triethylamin und 2,2 g Diphenylphosphorylazid in 10 ml Dioxan wird eine Stunde zum Sieden erhitzt. Nach Zugabe von 2,7 g Benzylalkohol wird weitere 12 h zum Sieden erhitzt. Nach Verdampfen des Lösungsmittels im Rotationsverdampfer wird der

Rückstand durch Chromatographie über eine Kieselgelsäule mit Petrolether/Essigester (10:3) gereinigt.
Ausbeute: 2,24 g (86 % der Theorie),
Schmelzpunkt: 54-56°C
R_f-Wert: 0,53 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Beispiel XIX

3-Amino-tetrahydrofuran

Eine Lösung von 2,2 g 3-(N-Benzyloxycarbonyl)aminotetrahydrofuran in 30 ml Methanol wird mit 0,4 g Palladium auf Kohle (10 %) versetzt und bei Raumtemperatur und 5 bar hydriert, bis kein Wasserstoff mehr aufgenommen wird. Nach Filtration und Verdampfen des Lösungsmittels im Rotationsverdampfer erhält man 0,31 g eines öligen Rückstands, der ohne weitere Reinigung eingesetzt wird.
Ausbeute: 0,31 g (33 % der Theorie),
R_f-Wert: 0,45 (Aluminiumoxid;
Methylenchlorid/Essigester/Methanol = 10:4:3)
Massenspektrum: M^+ = 87

Beispiel XX

4-(2-Hydroxymethyl-1-pyrrolidinyl)anilin

Eine Lösung von 1,0 g 1-(4-Nitrophenyl)-2-hydroxymethylpyrrolidin in 40 ml Methanol wird mit 0,5 g Palladium auf Kohle (5 %) versetzt und bei Raumtemperatur und 5 bar hydriert, bis kein Wasserstoff mehr aufgenommen wird. Nach Filtration und Verdampfen des Lösungsmittels im Rotationsverdampfer erhält man einen dunkel gefärbten Rückstand, der ohne weitere Reinigung eingesetzt wird.
Ausbeute: 1,1 g (quant.),
R_f-Wert: 0,81 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol = 10:3)

Beispiel XXI

3-(4-Amino-phenyl)-propionsäure

Eine Mischung von 155 g 4-Nitro-zimtsäure in 1 l Methanol wird mit 15 g Palladium auf Kohle (10 %) und 30 ml Wasser versetzt und bei Raumtemperatur und 3 bar hydriert, bis kein Wasserstoff mehr aufgenommen wird (2 h). Nach Filtration und Verdampfen des Lösungsmittels im Rotationsverdampfer wird zur Entfernung der Wasser-Reste zweimal mit je 300 ml Toluol versetzt und das Lösungsmittel im Rotationsverdampfer abdestilliert. Man erhält so 132 g (quant.) 3-(4-Amino-phenyl)-propionsäure.
Schmelzpunkt: 124 - 128°C.

Beispiel XXII

3-(trans-4-Acetylamino-cyclohexyl)-propionsäure

Eine Mischung von 397 g 3-(4-Amino-phenyl)-propionsäure, 125 g NaOH und 160 g Raney-Nickel in 5,7 l Wasser wird bei 170°C und 100 bar hydriert, bis kein Wasserstoff mehr aufgenommen wird (30 h). Nach Filtration und Waschen des Rückstands mit Wasser erhält man als Filtrat 6,3 l einer farblosen Lösung, die mit einer Lösung von 192 g NaOH in 400 ml Wasser und danach tropfenweise innerhalb 35 min. mit 454 ml Acetanhydrid versetzt wird. Nach fünf Stunden wird vom Niederschlag abfiltriert, das Filtrat durch Zugabe konzentrierter Salzsäure auf pH4 gebracht und drei Stunden bei 0°C gerührt. Dann wird abgesaugt, mit 250 ml Eiswasser nachgewaschen und bei 70°C getrocknet. Man erhält so 216 g 3-(trans-4-Acetylamino-cyclohexyl)-propionsäure.
Ausbeute: 216 g (42 % d. Theorie).
Schmelzpunkt: 193 - 196°C

Beispiel XXIII

3-(trans-4-Amino-cyclohexyl)-propionsäuremethylester-hydrochlorid

Eine Mischung von 185 g 3-(trans-4-Acetylamino-cyclohexyl)-propionsäure, 500 ml Wasser und 500 ml konz. Salzsäure wird 68 h zum Sieden erhitzt. Dann wird im Rotationsverdampfer zur Trockne eingedampft, fünfmal mit je 300 ml einer Methanol/Toluol-2:1-Mischung versetzt und jeweils erneut eingedampft. Der Rückstand wird mit 450 ml einer Aceton/tert.-Butylmethylether-1:2-Mischung verrührt, abgesaugt und im Vakuum über NaOH getrocknet. Zur Vervollständigung der Veresterung wird in 1 l Methanol gelöst und unter Eiskühlung tropfenweise mit 50 ml Thionylchlorid versetzt. Nach 30 min. wird das Lösungsmittel im Rotationsverdampfer abdestilliert, der Rückstand mit 300 ml Methanol versetzt und erneut eingedampft. Der Rückstand wird mit 450 ml einer Aceton/tert.-Butylmethylether-1:2-Mischung verrührt, abgesaugt und getrocknet.
Ausbeute: 178 g (92 % d. Theorie).
Schmelzpunkt: 196 - 198°C

Beispiel XXIV

trans-4-Dibenzylamino-cyclohexanol

Zu einer Mischung von 61 g trans-4-Amino-cyclohexanol, 350 ml Wasser, 350 ml Ethanol und 110 g Kaliumcarbonat werden 140 ml Benzylbromid zugetropft. Dann wird eine Stunde zum Sieden erhitzt, abgekühlt und der kristalline Niederschlag abgesaugt. Der Rückstand wird in 1,5 l Cyclohexan aufgenommen, die Mischung aufgekocht, abgekühlt und abgesaugt. Nachwaschen mit Cyclohexan und Trocknen im Vakuum ergibt 108 g (92 % d. Theorie) trans-4-Dibenzylamino-cyclohexanol.
Schmelzpunkt: 97 - 99°C

Beispiel XXV

α-(trans-4-Amino-cyclohexyloxy)-essigsäure-tert.-butylester

Zu einer Mischung von 76 g trans-4-Dibenzylamino-cyclohexanol, 57 ml α-Bromessigsäure-tert.-butylester, 700 ml Toluol und 2,8 g Tetrabutylammoniumhydrogensulfat wird bei Raumtemperatur eine Lösung von 262 g NaOH in 260 ml Wasser zugetropft. Nach 20 h wird die organische Phase abgetrennt, zweimal mit je 100 ml Wasser und einmal mit gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Rotationsverdampfer abdestilliert.
Man erhält so 116 g eines leicht gelben Feststoffs, der ohne weitere Reinigung in 1,5 l Methanol aufgenommen, mit 20 g Palladium auf Kohle (10%) versetzt und bei Raumtemperatur und 5 bar hydriert wird, bis kein Wasserstoff mehr aufgenommen wird (3 h). Nach Filtration wird das Lösungsmittel im Rotationsverdampfer abdestilliert.
Ausbeute: 68 g (quant.) eines gelben Öls, das ohne weitere Reinigung in die nächste Reaktion eingesetzt wird.

Beispiel XXVI

α-(trans-4-Amino-cyclohexyloxy)-essigsäure-methylester-hydrochlorid

59 g des oben erhaltenen Öls werden in 500 ml Methanol gelöst. Eine Stunde lang wird bei 0°C HCl-Gas eingeleitet und weitere 12 h bei Raumtemperatur gerührt. Das Lösungsmittel wird im Rotationsverdampfer abdestilliert, der Rückstand mit Aceton verrieben und abgesaugt. Nach dem Trocknen im Vakuum erhält man 34 g (59 % der Theorie) α-(trans-4-Amino-cyclohexyloxy)-essigsäure-methylester-hydrochlorid als farblose Kristalle.
Schmelzpunkt: 157 - 160°C

Beispiel XXVII

trans-4-Aminomethyl-cyclohexancarbonsäuremethylester-hydrochlorid

103 g trans-4-Aminomethyl-cyclohexancarbonsäure werden in 1 l Methanol gelöst und unter Eiskühlung mit 48 ml Thionylchlorid tropfenweise versetzt. Nach 2 h bei Raumtemperatur wird das Lösungsmittel im Rotationsverdampfer abdestilliert, der Rückstand mit 300 ml tert.-Butylmethylether verrührt, abgesaugt und getrocknet.
Ausbeute: 137 g (quant.).
Schmelzpunkt: 170 - 172°C

Beispiel 1

4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(cyclohexylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

Zu 0,4 g eines Gemisches aus 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-methylsulfinyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin und 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin in 10 ml Dioxan werden 1,3 ml Cyclohexylamin gegeben und über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Das Reaktionsgemisch wird eingedampft, mit Wasser versetzt und der Feststoff abgesaugt. Das Rohprodukt wird durch Chromatographie über eine Kieselgelsäule mit Petrolether/Essigester (2:1) gereinigt.
Ausbeute: 0,23 g (54 % der Theorie),
Schmelzpunkt: 165-167°C
R_f-Wert: 0,51 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

Ber.:	C	68,24	H	6,63	N 25,13
Gef.:		68,44		6,79	25,01

Analog Beispiel 1 werden folgende Verbindungen erhalten:

(1) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(isobutylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 164-166°C

Ber.: C 66,21 H 6,54 N 27,25
Gef.: 66,28 6,64 27,13

(2) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(isopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 176-178°C
R_f-Wert: 0,60 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)
Ber.: C 65,29 H 6,16 N 28,55
Gef.: 65,04 6,17 28,26

(3) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(1-phenyl-4-piperazinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 190-192°C
R_f-Wert: 0,43 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)
Ber.: C 69,50 H 5,83 N 24,67
Gef.: 69,70 6,01 24,31

(4) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
Schmelzpunkt: 111-113°C
R_f-Wert: 0,84 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)
Ber.: C 67,48 H 6,29 N 26,23
Gef.: 67,51 6,36 26,26

(5) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-methoxy-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Durchführung in Methanol mit Natriummethylat
Schmelzpunkt: 121-123°C
R_f-Wert: 0,31 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)
Ber.: C 62,91 H 4,90 N 26,20
Gef.: 62,90 4,99 26,13

(6) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(tert.butylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 206-208°C
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

Ber.:	C	66,21	H	6,54	N 27,25
Gef.:		66,17		6,59	27,12

(7) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(2,3,4,5-tetrahydro-1H-3-benzazepin-3-yl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 154-156°C
R_f-Wert: 0,86 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	72,23	H	5,80	N 21,97
Gef.:		71,93		5,82	21,93

(8) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(ethylamino)-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
Schmelzpunkt: 160°C
R_f-Wert: 0,44 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	64,27	H	5,75	N 29,98
Gef.:		64,22		5,91	29,99

(9) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(n-hexylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 116-118°C
R_f-Wert: 0,46 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	67,83	H	7,19	N 24,98
Gef.:		67,77		7,19	24,99

(10) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(diethylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 119-121°C
R_f-Wert: 0,62 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

Ber.:	C	66,21	H	6,49	N 27,25
Gef.:		66,27		6,67	27,31

(11) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(dimethylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 120-121°C
R_f-Wert: 0,57 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	64,27	H	5,75	N 29,98
Gef.:		64,17		5,77	30,22

(12) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(benzylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 198-204°C
R_f-Wert: 0,66 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:1)
Massenspektrum: M^+ = 342

(13) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-amino-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: >260°C
R_f-Wert: 0,67 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:1,5; Auftrag in Dimethylformamid)
Massenspektrum: M^+ = 252

(14) 4-(Phenylamino)-6-(1-pyrrolidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 172-174°C
Massenspektrum: M^+ = 292

(15) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(methylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 195-197°C
R_f-Wert: 0,31 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	63,14	H	5,29	N 31,55
Gef.:		62,74		5,31	31,09

(16) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-methyl-1-piperazinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 133-135°C
R_f-Wert: 0,53 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	64,45	H	6,31	N 29,23
Gef.:		64,36		6,39	29,03

(17) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 168-170°C

R_f-Wert: 0,48 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)
Ber.: C 65,96 H 5,18 N 28,84
Gef.: 65,48 5,69 28,22

(18) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(1-pyrrolidinyl)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 145-147°C
R_f-Wert: 0,65 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)

(19) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(morpholino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 125-127°C
R_f-Wert: 0,53 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)

(20) 4-(N-Methyl-N-phenyl-amino]-6-(1-pyrrolidinyl)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 128-130°C
R_f-Wert: 0,45 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)
Ber.: C 66,64 H 5,92 N 27,43
Gef.: 66,54 5,83 27,11

(21) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(allylamino)-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
Schmelzpunkt: 152-156°C
R_f-Wert: 0,63 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:1)

(22) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(2-methyl-2-buten-4-yl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(23) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(propargylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 185-187°C
R_f-Wert: 0,68 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:1)

(24) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(cyclopropylmethyl)amino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 141-144°C
R_f-Wert: 0,71 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:1)

(25) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(cyclobutylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 184-186°C
R_f-Wert: 0,54 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:1)

(26) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(2-hydroxyethyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 167-171°C
R_f-Wert: 0,42 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

(27) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(2-methoxyethyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 128-131°C
R_f-Wert: 0,56 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:1)

(28) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(1-piperazinyl)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 125-128°C
R_f-Wert: 0,37 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol = 6:1)
Massenspektrum: M^+ = 321

(29) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(1-acetyl-4-piperazinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 180-182°C
R_f-Wert: 0,38 (Kieselgel; Essigester/Methanol = 15:1)
Massenspektrum: M^+ = 363

(30) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(1-methansulfonyl-4-piperazinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen des Beispiels 2 durch Umsetzung mit Piperazin und anschließender Umsetzung mit Methansulfonylchlorid in Gegenwart von Triethylamin.
Schmelzpunkt: 248-250°C
R_f-Wert: 0,53 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol = 30:1)
Massenspektrum: M^+ = 399

(31) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-hydroxy-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 205-207°C
R_f-Wert: 0,33 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

(32) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(3-hydroxy-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 171-173°C
R_f-Wert: 0,46 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol = 9:1)

(33) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-phenyl-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 148-150°C
R_f-Wert: 0,77 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(34) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(1-benzyl-4-piperazinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 132-134°C

(35) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(2-phenylethyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 150-151°C
R_f-Wert: 0,56 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	70,77	H	5,66	N 23,58
Gef.:		70,85		5,82	23,52

(36) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(cyclopentylamino)-pyrimido-

[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 178-180°C
R_f-Wert: 0,49 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)
Ber.: C 67,48 H 6,29 N 26,23
Gef.: 67,42 6,33 25,70

(37) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(thiomorpholino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 125-127°C
R_f-Wert: 0,81 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(38) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(S-oxido-thiomorpholino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 212°C
R_f-Wert: 0,40 (Kieselgel; Essigester/Methanol = 10:1)

(39) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(S,S-dioxido-thiomorpholino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 240°C
R_f-Wert: 0,30 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(40) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(carboxymethyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(41) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(aminocarbonylmethyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 290°C (Zers.)
R_f-Wert: 0,26 (Aluminiumoxid; Methylenchlorid/Methanol = 9:1)

(42) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(methylaminocarbonylmethyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(43) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(dimethylaminocarbonyl-methyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(44) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[[(1-pyrrolidinyl)carbonyl-methyl]amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(45) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[[(morpholinocarbonyl)-methyl]amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(46) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-carboxy-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen des Beispiels 2 durch Umsetzung mit Piperidin-4-carbonsäure in einem Dioxan/Natronlauge-Gemisch.
Schmelzpunkt: 255-258°C (Zers.)
R_f-Wert: 0,21 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)
Massenspektrum: M^+ = 364

(47) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-aminocarbonyl-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 242-244°C (Zers.)
R_f-Wert: 0,48 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:5)
Massenspektrum: M^+ = 363

(48) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(3-diethylaminocarbonyl-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 119-121°C
R_f-Wert: 0,36 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

Ber.:	C	65,85	H	6,97	N 23,37
Gef.:		65,80		7,07	23,17

(49) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(8-aza-1,4-dioxaspiro[4,5]-decan-8-yl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 184-186°C
R_f-Wert: 0,56 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	63,48	H	5,86	N 22,21
Gef.:		63,35		6,00	21,89

(50) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(2-dimethylaminoethyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 140-142°C
R_f-Wert: 0,66 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)
Massenspektrum: M^+ = 323

(51) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[bis-(2-hydroxyethyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 180-182°C
R_f-Wert: 0,29 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol/Ammoniak = 5:5:1.25:0.1)
Massenspektrum: M^+ = 340

(52) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(dibutylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 56-58°C
R_f-Wert: 0,57 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	69,20	H	7,74	N 23,06
Gef.:		69,38		7,80	22,91

(53) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(cyclopentyloxy)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 83-85°C
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)
Hergestellt aus den Verbindungen des Beispiels 2 unter Verwendung von Cyclopentanol und metallischem Natrium.

(54) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-cyan-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(55) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(2-azaspiro[4,5]decan-2-yl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(56) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(7-azaspiro[4,5]decan-7-yl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(57) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(2-butylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 178-180°C
R_f-Wert: 0,67 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	66,21	H	6,54	N 27,25
Gef.:		66,23		6,59	27,19

Massenspektrum: M^+ = 308

(58) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 176-178°C
R_f-Wert: 0,33 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

Ber.:	C	61,92	H	5,85	N 27,08
Gef.:		61,60		5,97	26,72

(59) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(2-carboxy-1-pyrrolidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(60) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(2-aminocarbonyl-1-pyrrolidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(61) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-amino-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 105-110°C
R_f-Wert: 0,12 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol = 1:1)

(62) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-methyl-4-piperidinyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 204-205°C
R_f-Wert: 0,37 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:0,5)

Ber.:	C	65,31	H	6,63	N 28,06
Gef.:		65,23		6,68	27,72

(63) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(1,2,3,4-tetrahydro-2-isochinolinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 95-97°C
R_f-Wert: 0,38 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 7:3)
Massenspektrum: M^+ = 368

(64) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(2-aza-bicyclo[2.2.2]octan-2-yl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(65) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(endo-2-norbornyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 149-154°C
R_f-Wert: 0,78 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

Ber.:	C	69,34	H	6,40	N 24,26
Gef.:		69,65		6,49	24,23

(66) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(norbornan-2-yl-methyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(67) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(5-norbornen-2-yl-methyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(68) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(R(+)-bornylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 184-187°C
R_f-Wert: 0,80 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:6:1)

(69) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(3-chinuclidinyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 186-189°C
R_f-Wert: 0,48 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:2)

Ber.:	C	66,46	H	6,41	N 27,13
Gef.:		66,09		6,40	27,10

(70) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(cyclopentylmethyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(71) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-adamantyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 262-266°C
R_f-Wert: 0,69 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:1)

(72) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 226-228°C
R_f-Wert: 0,30 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

(73) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(2-hydroxycyclopentyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(74) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(4-dimethylamino-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(75) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(3-methylcyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 150-152°C
R_f-Wert: 0,76 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:1)

(76) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(spiro[5,5]undecan-3-yl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(77) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(3-cyanopropyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(78) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(2-aza-bicyclo[2.2.1]heptan-2-yl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(79) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(3-aza-bicyclo[3.2.2]nonan-3-yl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 116-119°C
R_f-Wert: 0,75 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:6:1)

(80) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(exo-2-norbornylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 245-247°C
R_f-Wert: 0,70 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:1)

(81) 4,6-Bis-[(3-Methylphenyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 220-222°C
R_f-Wert: 0,37 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:2)

(82) 4-[(3-Fluorphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 180-182°C
R_f-Wert: 0,45 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(83) 4-[(3-Chlorphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 182-184°C

Ber.:	C	57,60	H	4,18	N	26,87	Cl 11,33
Gef.:		57,66		4,39		26,40	11,24

(84) 4-[(3-Bromphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 205-207°C
R_f-Wert: 0,63 (Kieselgel; Petrolether/Essigester= 1:1)

Ber.:	C	50,42	H	3,66	N	23,52	Br 22,39
Gef.:		50,29		3,82		23,42	22,65

(85) 4-[(3-Trifluormethylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 146-148°C
R_f-Wert: 0,22 (Kieselgel; Petrolether/Essigester= 2:1)

(86) 4-[(3-Methoxyphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 143-145°C
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(87) 4-[(3-Ethylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 140-142°C
R_f-Wert: 0,55 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	66,86	H	5,61	N 27,52
Gef.:		66,51		5,92	27,12

(88) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-hydroxy-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
Schmelzpunkt: > 220°C
R_f-Wert: 0,28 (Kieselgel; Ammoniak/Methanol = 10:1)
Hergestellt aus den Verbindungen des Beispiels 2 und Natronlauge.

(89) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(hydroxyamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(90) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(methoxyamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(91) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(N-methyl-N-methoxy-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 118-121°C
R_f-Wert: 0,60 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:7:1)

(92) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(2,2,2-trifluorethylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 172-175°C
R_f-Wert: 0,59 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:1)

(93) 4-[(3-Chlorphenyl)amino]-6-(1-pyrrolidinyl)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 170-173°C
R_f-Wert: 0,68 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)

Ber.:	C	58,81	H	4,63	N	25,72	Cl 10,85
Gef.:		58,93		4,77		25,52	11,10

(94) 4-[(3-Fluorphenyl)amino]-6-(1-pyrrolidinyl)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 169-172°C
R_f-Wert: 0,60 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)

Ber.:	C	61,93	H	4,87	N	27,08
Gef.:		62,00		4,95		27,07

(95) 4-[(3-Bromphenyl)amino]-6-(isopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 181-184°C
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)

Ber.:	C	50,15	H	4,21	N	23,39	Br 22,24
Gef.:		49,86		4,37		23,11	22,30

(96) 4-[(3-Chlorphenyl)amino]-6-(isopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 193-196°C
R_f-Wert: 0,53 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)

Ber.:	C	57,24	H	4,80	N	26,70	Cl 11,26
Gef.:		57,48		4,97		26,54	11,85

(97) 4-[(3-Fluorphenyl)amino]-6-(isopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 195-200°C
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)

Ber.:	C	60,39	H	5,07	N	28,17	
Gef.:		60,13		5,13		28,03	

(98) 4-[(3-Bromphenyl)amino]-6-(morpholino)-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
Schmelzpunkt: 183-187°C
R_f-Wert: 0,40 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)

Ber.:	C	49,63	H	3,90	N	21,70	
Gef.:		49,59		4,17		21,64	

(99) 4-[(3-Chlorphenyl)amino]-6-(morpholino)-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
Schmelzpunkt: 188-192°C
R_f-Wert: 0,41 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)

Ber.:	C	56,06	H	4,41	N	24,52	Cl	10,34
Gef.:		55,75		4,67		24,43		10,97

(100) 4-[(3-Fluorphenyl)amino]-6-(morpholino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 166-169°C
R_f-Wert: 0,48 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)

(101) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[2-(2'-hydroxyethylamino)-ethyloxy]pyrimido[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,10 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol/Ammoniak = 5:5:1,25:0,1)
Massenspektrum: M^+ = 340

(102) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(1-azetidinyl)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 129-131°C
R_f-Wert: 0,51 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:6:1)

(103) 4-[(3-Bromphenyl)amino]-6-(1-pyrrolidinyl)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 206-208°C
R_f-Wert: 0,63 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)

Ber.:	C	51,76	H	4,07	N	22,64	Br 21,52
Gef.:		51,67		4,22		22,44	22,14

(104) 4-[(3-Bromphenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 226-231°C
R_f-Wert: 0,43 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

Ber.:	C	52,06	H	4,61	N	20,24	Br 19,24
Gef.:		52,23		4,83		20,30	19,38

(105) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(3-hydroxypropyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 186-190°C
R_f-Wert: 0,38 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

Ber.:	C	61,92	H	5,84	N	27,08
Gef.:		61,90		6,08		26,66

(106) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(4-hydroxybutyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 195-201°C
R_f-Wert: 0,32 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

Ber.:	C	62,95	H	6,21	N	25,91
Gef.:		63,04		6,41		25,51

(107) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(cis-4-hydroxycyclohexyl)-amino]pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 212-216°C
R_f-Wert: 0,48 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:3)

Ber.:	C	65,12	H	6,33	N	23,98	
Gef.:		65,06		6,46		23,86	

(108) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(trans-4-tert.butyloxycarbonylamino-cyclohexyl)amino]pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 198-200°C
R_f-Wert: 0,55 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:1)
Massenspektrum: M^+ = 449

(109) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(4-oxo-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen des Beispiels 2 durch Umsetzung mit trans-4-Hydroxycyclohexylamin und anschließender Umsetzung mit Pyridiniumchlorochromat.
Schmelzpunkt: 215-218°C
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:3)
Massenspektrum: M^+ = 348

(110) 4-[(3-Chlorphenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 219-223°C
R_f-Wert: 0,34 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

Ber.:	C	58,30	H	5,16	N	22,66	Cl	9,56
Gef.:		58,22		5,06		22,88		9,61

(111) 4-[(3-Fluorphenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 220-223°C
R_f-Wert: 0,38 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

Ber.:	C	61,01	H	5,40	N 23,71
Gef.:		61,14		5,46	23,83

(112) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(trans-4-methoxycyclohexyl)amino]pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 188-191°C
R_f-Wert: 0,53 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

Ber.:	C	65,91	H	6,64	N 23,06
Gef.:		65,75		6,79	22,83

(113) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(trans-4-aminocyclohexyl)-amino]pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen des Beispiels 2 durch Umsetzung mit trans-4-tert.Butyloxy-carbonylamino-cyclohexylamin und anschließende Umsetzung mit etherischer Chlorwasserstoff-Lösung und Methanol.
Schmelzpunkt: >260°C
R_f-Wert: 0,28 (Reversed-Phase-Kieselgel; Methanol/5%ige Kochsalzlösung = 10:4)

(114) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(trans-4-methylsulfonyl-aminocyclohexyl)amino]pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen des Beispiels 2 durch Umsetzung mit trans-4-tert.Butyloxycarbonylamino-cyclohexylamin und anschließende Umsetzung mit etherischer Chlorwasserstoff-Lösung und Methanol sowie anschließende Umsetzung mit Methansulfonsäurechlorid.
Schmelzpunkt: 192-195°C
R_f-Wert: 0,37 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

(115) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(trans-4-acetylamino-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen des Beispiels 2 durch Umsetzung mit trans-4-tert.Butyloxycarbonylamino-cyclohexylamin und anschließende Umsetzung mit etherischer Chlorwasserstoff-Lösung und Methanol sowie anschließende Umsetzung mit Acetanhydrid und Triethylamin.
Schmelzpunkt: 302-305°C
R_f-Wert: 0,38 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:3)

(116) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(trans-4-dimethylamino-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen des Beispiels 2 durch Umsetzung mit trans-4-tert.Butyloxycarbonylamino-cyclohexylamin und anschließende Umsetzung mit etherischer Chlorwasserstoff-Lösung und Methanol sowie anschließende Umsetzung mit Ameisensäure, Formaldehyd und Natriumhydrogencarbonat.
Schmelzpunkt: 161-165°C
R_f-Wert: 0,71 (Aluminiumoxid, Methylenchlorid/Methanol = 20:1)

Ber.:	C	66,82	H	7,21	N 25,97
Gef.:		66,74		7,32	26,12

(117) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(cis-4-hydroxy-4-methyl-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen der Beispiele IX und 2.
Schmelzpunkt: 194-196°C
R_f-Wert: 0,36 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

(118) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-4-methyl-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen der Beispiele IX(1) und 2.
Schmelzpunkt: 217-221°C
R_f-Wert: 0,36 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

Ber.: C 65,91 H 6,64 N 23,06
Gef.: 65,80 6,70 23,26

(119) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(N-isopropyl-N-methyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 91-96°C
R_f-Wert: 0,55 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)
Ber.: C 66,21 H 6,54 N 27,25
Gef.: 66,33 6,79 26,99

(120) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(N-tert.butyl-N-methyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 136-139°C
R_f-Wert: 0,89 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

(121) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(N-(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)-N-methyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 220-222°C
R_f-Wert: 0,40 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

(122) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 207-210°C
R_f-Wert: 0,47 (Kieselgel; Essigester/Methanol = 20:1)
Ber.: C 62,95 H 6,21 N 25,91
Gef.: 63,16 6,38 25,41

(123) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(cis-2,6-dimethyl-morpholino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 134-139°C
R_f-Wert: 0,70 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)
Ber.: C 65,12 H 6,33 N 23,98
Gef.: 65,05 6,41 24,06

(124) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(trans-2,6-dimethyl-morpholino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(125) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(3-methyl-morpholino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(126) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(3,3-dimethyl-morpholino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(127) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(3,5-dimethyl-morpholino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(128) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(2-methyl-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 131-134°C
R_f-Wert: 0,66 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)

Ber.:	C	68,24	H	6,63	N 25,13
Gef.:		68,25		6,72	24,68

(129) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-(morpholino)-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 148-150°C
R_f-Wert: 0,48 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:3)

Ber.:	C	53,53	H	4,74	N 24,27
Gef.:		53,43		4,83	24,00

(130) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(2-hydroxy-cyclohexylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 218-220°C
R_f-Wert: 0,36 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

(131) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(2-methyl-1-pyrrolidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(132) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(2,2-dimethyl-1-pyrrolidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(133) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(2,5-dimethyl-1-pyrrolidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 123 - 125°C
R_f-Wert: 0,55 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 10:4)

(134) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[trans-4-carboxy-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 135 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit methanolischer Natronlauge.
Schmelzpunkt: >325°C
Massenspektrum: M^+ = 378

(135) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[trans-4-(methoxycarbonyl)-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 170-174°C
R_f-Wert: 0,31 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 3:5)

(136) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[trans-4-aminocarbonyl-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 134 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Thionylchlorid und Ammoniak.
Schmelzpunkt: 312 - 315°C
R_f-Wert: 0,38 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:3)

(137) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[trans-4-(N-methylaminocarbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 134 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Thionylchlorid und Methylamin.
Schmelzpunkt: 298 - 304°C
R_f-Wert: 0,43 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:3)

(138) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[trans-4-(N,N-dimethylaminocarbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 135 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit O-(Benzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetramethyluroniumtetrafluoroborat, Triethylamin und Dimethylamin.
Schmelzpunkt: 214-217°C
R_f-Wert: 0,40 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:3)
Massenspektrum: M^+ = 405

(139) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[trans-4-(pyrrolidinocarbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 135 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit O-(Benzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetramethyluroniumtetrafluoroborat, Triethylamin und Pyrrolidin.
Schmelzpunkt: 210-214°C
R_f-Wert: 0,47 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:3)
Massenspektrum: M^+ = 431

(140) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[trans-4-(morpholinocarbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 135 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit N,N'-Carbonyldiimidazol und Morpholin.
Schmelzpunkt: 150-160°C
R_f-Wert: 0,48 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:3)
Massenspektrum: M^+ = 447

(141) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(trans-4-(hydroxymethyl)-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen der Beispiele 2 und X.
Schmelzpunkt: 264-267°C
R_f-Wert: 0,41 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)
Massenspektrum: M^+ = 364

(142) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 194 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Palladiumhydroxid und Wasserstoff zur Benzylgruppenabspaltung. Durch anschließende Behandlung mit Palladium auf Kohle in siedendem Dioxan/Wasser-Gemisch wird der teilweise hydrierte Pyrimidopyrimidin-Grundkörper zurückgebildet.
Schmelzpunkt: 187-192°C
R_f-Wert: 0,56 (Aluminiumoxid; Methylenchlorid/Methanol = 20:1,6)
Massenspektrum: M^+ = 335

(143) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-formyl-4-piperidinyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(144) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-acetyl-4-piperidinyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 142 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Acetanhydrid und Triethylamin.
Schmelzpunkt: 174 - 177°C
R_f-Wert: 0,48 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol = 10:1)

(145) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-methylsulfonyl-4-piperidinyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 142 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Methylsulfonylchlorid und Triethylamin.
Schmelzpunkt: 229 - 233°C
R_f-Wert: 0,59 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol = 10:1)

(146) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-methoxycarbonyl-4-piperidinyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 142 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Chlorameisensäuremethylester und Triethylamin.
Schmelzpunkt: 141 - 146°C
R_f-Wert: 0,45 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol = 20:1)

(147) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-cyano-4-piperidinyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(148) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-aminocarbonyl-4-piperidinyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(149) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-(N-methylamino)carbonyl-4-piperidinyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(150) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-(N,N-dimethylamino)carbonyl-4-piperidinyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(151) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-methoxycarbonyl-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 46 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Thionylchlorid und Methanol.
Schmelzpunkt: 114-118°C
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)
Massenspektrum: M^+ = 378

(152) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[4-(N-methylamino)carbonyl-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 46 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit O-(Benzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetramethyluronium-tetrafluoroborat, Triethylamin und Methylamin.
Schmelzpunkt: 226-230°C
R_f-Wert: 0,43 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:3)
Massenspektrum: M^+ = 377

(153) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[4-(N,N-dimethylamino)carbonyl-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 46 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit O-(Benzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetramethyluronium-tetrafluoroborat, Triethylamin und Dimethylamin.
Schmelzpunkt: 174-177°C

R_f-Wert: 0,53 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:4)

(154) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[4-(pyrrolidino)carbonyl-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 46 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit O-(Benzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetramethyluroniumtetrafluoroborat, Triethylamin und Pyrrolidin.
Schmelzpunkt: 181-184°C
R_f-Wert: 0,46 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:3)
Massenspektrum: M^+ = 417

(155) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[4-hydroxymethyl-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 170-175°C
R_f-Wert: 0,55 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:7:1,5)

Ber.:	C	65,12	H	6,33	N 23,98
Gef.:		65,07		6,52	23,80

(156) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[3-hydroxymethyl-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 141-145°C
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

Ber.:	C	65,12	H	6,33	N 23,98
Gef.:		64,96		6,47	23,88

(157) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[2-hydroxymethyl-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 164-168°C
R_f-Wert: 0,40 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	65,12	H	6,33	N 23,98
Gef.:		64,94		6,22	24,00

(158) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(n-propylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 145-149°C
R_f-Wert: 0,76 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

Ber.:	C	65,29	H	6,16	N 28,55
Gef.:		64,40		6,33	28,13

(159) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(n-butylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 136-140°C
R_f-Wert: 0,53 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)
Massenspektrum: M^+ = 308

Ber.:	C	66,21	H	6,54	N 27,25
Gef.:		65,96		6,65	27,05

(160) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(3-phenyl-n-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 118-122°C
R_f-Wert: 0,66 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)
Massenspektrum: M^+ = 370

Ber.:	C	71,33	H	5,99	N 22,68
Gef.:		71,48		6,06	22,69

(161) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[4-hydroxy-4-phenyl-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 185-188°C
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)

(162) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-carboxy-1-methyl)ethyl-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(163) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-methoxycarbonyl-1-methyl)ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(164) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-aminocarbonyl-1-methyl)-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(165) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-(N-methylamino)carbonyl-1-methyl)ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 214-216°C
R_f-Wert: 0,41 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:3)
Massenspektrum: M^+ = 351

(166) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-(N,N-dimethylamino)-carbonyl-1-methyl)ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(167) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-(1-pyrrolidino)carbonyl-1-methyl)ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(168) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-(morpholino)carbonyl-1-methyl)ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(169) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(3-tetrahydrofuranylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(170) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-tetrahydropyranylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 226-228°C
R_f-Wert: 0,46 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

Ber.:	C	64,26	H	5,99	N	24,98
Gef.:		64,03		5,99		24,28

(171) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(tetrahydrofurfurylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(172) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-(2-hydroxyethyl)amino-carbonyl-1-methyl)ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(173) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-desoxy-1-D-sorbityl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 179-182°C
R_f-Wert: 0,45 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:2)

Ber.:	C	54,79	H	5,81	N 20,18
Gef.:		54,69		5,84	20,38

(174) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(p-hydroxyphenyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(175) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(trans-4-(N-oxido-N,N-dimethylamino)-cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 182-184°C
R_f-Wert: 0,55 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:4)
Hergestellt aus der Verbindung 116 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Wasserstoffperoxid.

(176) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-methyl-N-oxido-4-piperidinyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 212-214°C
R_f-Wert: 0,53 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester/Methanol = 2:8:3)
Hergestellt aus der Verbindung 62 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Wasserstoffperoxid.

(177) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-oxo-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 31 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Pyridiniumdichromat.
Schmelzpunkt: 122-124°C
R_f-Wert: 0,40 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 1:1)

(178) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[2-(2-hydroxyethyloxy)ethyl-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 99-101°C

Ber.:	C	59,98	H	5,92	N 24,68
Gef.:		59,75		6,01	24,56

(179) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(2,3-dihydroxypropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 187-189°C
R_f-Wert: 0,39 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

Ber.:	C	58,88	H	5,56	N 25,75
Gef.:		58,85		5,60	25,50

(180) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[4-(2-oxo-1-pyrrolidinyl)-phenylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 212-214°C
R_f-Wert: 0,42 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)
Massenspektrum: M^+ = 303

(181) 4-(Phenylamino)-6-(phenylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(182) 4-[N-Methyl-N-phenyl-amino]-6-[N-methyl-N-phenyl-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(183) 4-[(4-Chlor-3-fluor-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: > 230°C
R_f-Wert: 0,30 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:3)
Massenspektrum: M^+ = 378/380

(184) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[4-(morpholino)carbonyl-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 46 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit N,N'-Carbonyldiimidazol und Morpholin.
Schmelzpunkt: 208-212°C

R_f-Wert: 0,58 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:4)
Massenspektrum: M^+ = 433

(185) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(tris-hydroxymethyl-methyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 222-224°C
R_f-Wert: 0,45 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:2)

Ber.:	C	57,29	H	5,65	N 23,58
Gef.:		57,12		5,69	23,70

(186) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-acetylamino-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 61 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Triethylamin und Acetanhydrid.
Schmelzpunkt: 225-230°C
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol = 10:1)

Ber.:	C	63,64	H	6,14	N 26,00
Gef.:		63,52		6,18	25,62

(187) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-methylsulfonylamino-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 61 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Triethylamin und Methansulfonsäurechlorid.
Schmelzpunkt: 182-187°C
R_f-Wert: 0,60 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol = 10:1)

(188) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-methoxycarbonylamino-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 61 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Triethylamin und Chlorameisensäuremethylester.
Schmelzpunkt: 178-180°C
R_f-Wert: 0,40 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol = 10:0,75)

(189) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[4-(N,N-dimethylaminocarbonyl)amino-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 61 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Triethylamin und N,N-Dimethylcarbamidsäurechlorid.
Schmelzpunkt: 220-227°C
R_f-Wert: 0,53 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol = 10:1)

(190) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-cyanamino-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 61 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Bromcyan.
Schmelzpunkt: 220-224°C
R_f-Wert: 0,45 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:3)
Massenspektrum: M^+ = 360

(191) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-formylamino-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 61 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Ameisensäuremethylester.
Schmelzpunkt: 196-198°C
R_f-Wert: 0,58 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol = 10:1,5)

(192) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-isopropylaminocarbonylmethyl-1-piperazinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 146-151°C
R_f-Wert: 0,42 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)
Massenspektrum: M^+ = 420

(193) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[4-(2-hydroxymethyl-1-pyrrolidinyl)phenylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen der Beispiele 2 und XX.
Schmelzpunkt: 208-210°C
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

(194) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-benzyl-4-piperidinyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 143-145°C
R_f-Wert: 0,48 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)
Massenspektrum: M^+ = 425

(195) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-ethoxycarbonyl-4-piperidinyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 160-163°C
R_f-Wert: 0,46 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:9:2)

Ber.:	C	61,90	H	6,18	N 24,06
Gef.:		61,73		6,23	24,08

(196) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[3-(2-oxo-1-pyrrolidinyl)-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 118-120°C
R_f-Wert: 0,25 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

(197) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[2-(1,4,7,10,13-pentaoxacyclopentadecyl)-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 145-147°C
R_f-Wert: 0,37 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

Ber.:	C	59,48	H	6,65	N 17,34
Gef.:		59,56		6,69	17,28

(198) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[2-(1,4,7,10,13,16-hexaoxacyclooctadecyl)-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 72-74°C
R_f-Wert: 0,29 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

(199) 4-[(2-Cyclopropylphenyl)amino]-6-morpholino-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 171-173°C

Ber.:	C	65,49	H	5,78	N 24,12
Gef.:		65,24		5,84	24,06

(200) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[4-(2-hydroxyethyl)-1-piperazinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 140-142°C
R_f-Wert: 0,45 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

(201) 4-[(4-Amino-3-cyano-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 200°C
R_f-Wert: 0,44 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:3)

(202) 4-[(3,4-Dichlorphenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclo-hexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 220-222°C
R_f-Wert: 0,57 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

(203) 4-[(3-Chlor-4-methoxy-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 187-199°C
R_f-Wert: 0,40 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

Ber.:	C	56,92	H	5,28	N 20,96
Gef.:		56,71		5,29	20,54

(204) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 222-224°C

Ber.:	C	55,60	H	4,66	N 21,61
Gef.:		55,40		4,75	21,35

(205) 4-[(4-Amino-3-nitro-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 250-252°C
R_f-Wert: 0,32 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

(206) 4-[(4-Chlor-3-nitro-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 235-237°C
R_f-Wert: 0,28 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:3)

Ber.:	C	51,99	H	4,36	N 23,57
Gef.:		51,70		4,45	23,78

(207) 4-[(4-Amino-3,5-dichlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 250-252°C
R_f-Wert: 0,23 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:3)

Ber.:	C	51,43	H	4,55	N 23,32
Gef.:		51,55		4,70	23,35

(208) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-butyloxy-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
Schmelzpunkt: 54-56°C
R_f-Wert: 0,67 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 10:7)
Massenspektrum: M^+ = 309

(209) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-propyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 170-172°C
R_f-Wert: 0,27 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:3)

Ber.:	C	58,88	H	5,55	N 25,75
Gef.:		58,65		5,57	25,80

(210) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(2-hydroxy-1-phenyl)-1-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(211) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(2-hydroxy-2-phenyl)-1-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(212) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(1-hydroxy-3-phenyl)-2-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(213) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(1-hydroxy-1-phenyl)-2-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 234 - 236°C
R_f-Wert: 0,42 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)
Massenspektrum: M^+ = 424

(214) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(1,3-dihydroxy-1-phenyl)-2-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 176-178°C
R_f-Wert: 0,48 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

(215) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(1,3-dihydroxy-1-(4-nitrophenyl))-2-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(216) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(1-hydroxy-3-methoxy-1-phenyl)-2-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(217) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(1-hydroxy-3-methyl)-2-butylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(218) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-(hydroxymethyl)-cyclopentylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(219) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(2-hydroxy-2-(3-hydroxyphenyl))-1-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(220) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(2-hydroxy-2-(4-hydroxyphenyl))-1-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(221) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(1-hydroxy-1-(4-hydroxyphenyl))-2-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(222) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[tris-(3-hydroxypropyl)-methylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(223) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[N-methyl-N-(2-hydroxyethyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(224) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-carboxy-1-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(225) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-aminocarbonyl-1-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(226) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-(N-methylaminocarbonyl)-1-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(227) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-(N,N-dimethylaminocarbonyl)-1-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(228) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-(N-formylamino)-1-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(229) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-(methoxycarbonylamino)-1-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(230) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-(N-acetylamino)-1-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(231) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-amino-2-hydroxy-1-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(232) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-(morpholino)-1-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(233) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-(1-piperazinyl)-1-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(234) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-(1-pyrrolidinyl)-1-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(235) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-hydroxymethyl-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(236) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-(methoxy-carbonyl-methyloxy)cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen der Beispiele 2 und XXVI.
R_f-Wert: 0,32 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)
Massenspektrum: M^+ = 460

(237) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-(carboxy-methyloxy)cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 236 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Natronlauge in einem Methanol/Tetrahydrofuran-Gemisch.
Schmelzpunkt: 263 - 265°C
R_f-Wert: 0,42 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:3)
Massenspektrum: M^+ = 446

(238) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-(N,N-di-methylaminocarbonyl-methyloxy)cyclohexyl)-amino]-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(239) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-(morpho-linocarbonyl-methyloxy)cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin

(240) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-(2-methoxycarbonyl-ethyl)cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen der Beispiele 2 und XXIII.
Schmelzpunkt: 144 - 146°C
R_f-Wert: 0,62 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

(241) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-(2-carboxyethyl)cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 240 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Natronlauge in einem Methanol/Tetrahydrofuran-Gemisch.
Schmelzpunkt: 298 - 300°C
R_f-Wert: 0,25 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

(242) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-(2-N,N-dimethylaminocarbonyl-ethyl)cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin

(243) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-(2-morpholinocarbonyl-ethyl)cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(244) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-(methoxycarbonyl)cyclohexyl-methyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen der Beispiele 2 und XXVII.
Schmelzpunkt: 200 - 202°C
R_f-Wert: 0,63 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)
Massenspektrum: M^+ = 444

(245) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-carboxycyclohexyl-methyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung 244 des Beispiels 1 durch Umsetzung mit Natronlauge in einem Methanol/Tetrahydrofuran-Gemisch.
Schmelzpunkt: 269 - 271°C

R_f-Wert: 0,58 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:3)
Massenspektrum: M^+ = 430

(246) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-(N,N-dimethylamino-carbonyl)cyclohexyl-methyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin

(247) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-(morpholinocarbonyl)cyclohexyl-methyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(248) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-isopropoxy-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 125 - 127°C
R_f-Wert: 0,42 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 10:5)
Massenspektrum: M^+ = 333

(249) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(4-tetrahydropyranyloxy)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(250) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(3-tetrahydrofuranyloxy)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(251) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-hydroxy-cyclohexyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 200 - 202°C
R_f-Wert: 0,35 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)
Massenspektrum: M^+ = 362

(252) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(2-tetrahydropyranylmethyloxy)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(253) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(methoxycarbonyl)-cyclohexyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(254) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-carboxy-cyclohexyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(255) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(N,N-dimethylaminocarbonyl)-cyclohexyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(256) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(N-methyl-aminocarbonyl)-cyclohexyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(257) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(aminocarbonyl)-cyclohexyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(258) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(N,N-dimethylamino)-cyclohexyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(259) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(N-acetyl-amino)-cyclohexyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(260) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(N-methylsulfonylamino)-cyclohexyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(261) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(N-methoxycarbonylamino)-cyclohexyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(262) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(N-tert.-butyloxycarbonylamino)-cyclohexyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(263) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-methyl-4-piperidinyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 129 - 131°C
R_f-Wert: 0,48 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 1:1)
Massenspektrum: M^+ = 389

(264) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-acetyl-4-piperidinyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(265) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-methylsulfonyl-4-piperidinyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(266) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-tert.-butyloxy-carbonyl-4-piperidinyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(267) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-methoxycarbonyl-4-piperidinyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(268) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-methoxyethyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(269) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-hydroxyethyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(270) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-methoxy-2-propyl-oxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(271) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-allyloxy-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(272) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[cyclobutyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(273) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-(3-methyl-oxetanyl)-methyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(274) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-tetrahydropyranyl-methyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(275) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-hydroxy-cyclopentyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(276) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-hydroxy-cyclohexyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(277) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-hydroxy-cyclohexyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(278) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-N,N-dimethylamino-2-propyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(279) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-(morpholino)-ethyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(280) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-methyl-3-pyrrolidinyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(281) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-methyl-3-piperidinyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(282) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-methoxy-2-methyl-2-propylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(283) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-amino-1-pyrrolidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(284) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-N,N-dimethylamino-1-pyrrolidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(285) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-acetylamino-1-pyrrolidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(286) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-cyanamino-1-pyrrolidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(287) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-methylsulfonyl-amino-1-pyrrolidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(288) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-methoxycarbonyl-amino-1-pyrrolidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(289) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-formylamino-1-pyrrolidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(290) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-N,N-dimethylamino-carbonylamino-1-pyrrolidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(291) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-amino-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(292) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-N,N-dimethylamino-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(293) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-acetylamino-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(294) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-methoxycarbonyl-amino-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(295) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-methylsulfonyl-amino-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(296) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-pyrrolidinyl-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(297) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-methyl-3-pyrrolidinylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(298) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-acetyl-3-pyrrolidinylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(299) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-cyano-3-pyrrolidinylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(300) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-methylsulfonyl-3-pyrrolidinylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(301) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-methoxycarbonyl-3-pyrrolidinylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(302) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-formyl-3-pyrrolidinylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(303) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-(N,N-dimethyl-aminocarbonyl)-3-pyrrolidinylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(304) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-piperidinylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(305) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-methyl-3-piperidinylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(306) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-acetyl-3-piperidinylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(307) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-methoxycarbonyl-3-piperidinylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(308) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-methylsulfonyl-3-piperidinylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(309) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2,5-dimethyl-1-piperazinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(310) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-methyl-1-piperazinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(311) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(2-aminoethyl)-1-piperazinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(312) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(2-(2-hydroxy-ethyloxy)ethyl)-1-piperazinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(313) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-butyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(314) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-methoxy-cyclohexyloxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(315) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 213 - 218°C
R_f-Wert: 0,37 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 10:8)

(316) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(317) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(318) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(319) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(320) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(321) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(322) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(323) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(324) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(325) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(326) 4-[(3-Methyl-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(327) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 255 - 259°C
R_f-Wert: 0,54 (Kieselgel; Essigester/Methanol = 20:1)

(328) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(329) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(330) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(331) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(332) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(333) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(334) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(335) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(4-aminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(336) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-aminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(337) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-aminocyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(338) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[(trans-4-aminocyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(339) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[(trans-4-aminocyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(340) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[(trans-4-aminocyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(341) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-dimethyl-aminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(342) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-dimethyl-aminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(343) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-dimethylamino-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(344) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[(trans-4-dimethylamino-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(345) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[(trans-4-dimethylamino-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(346) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[(trans-4-dimethylamino-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(347) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-acetyl-aminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(348) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-acetylamino-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(349) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-acetylaminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(350) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[(trans-4-acetylaminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(351) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[(trans-4-acetylaminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(352) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[(trans-4-acetylaminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(353) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-methylsulfonylaminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(354) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-methylsulfonylaminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(355) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-methylsulfonylaminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(356) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[(trans-4-methylsulfonylaminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(357) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[(trans-4-methylsulfonylaminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(358) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[(trans-4-methylsulfonylaminocyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(359) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-methoxycyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(360) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-methoxycyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(361) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-methoxycyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(362) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[(trans-4-methoxycyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(363) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[(trans-4-methoxycyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(364) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[(trans-4-methoxycyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(365) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-carboxy-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(366) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[trans-4-carboxy-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(367) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[trans-4-carboxy-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(368) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[trans-4-carboxy-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(369) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[trans-4-carboxy-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(370) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[trans-4-carboxy-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(371) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(N,N-dimethylamino-carbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(372) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(N,N-dimethylamino-carbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(373) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(N,N-dimethylamino-carbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(374) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[trans-4-(N,N-dimethylamino-carbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(375) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[trans-4-(N,N-dimethylamino-carbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(376) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[trans-4-(N,N-dimethyl-amino-carbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(377) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(morpho-linocarbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(378) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(morpholino-carbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(379) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(morpholinocar-bonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(380) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[trans-4-(morpholinocarbonyl)-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(381) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[trans-4-(morpholinocarbon-yl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(382) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[trans-4-(morpholinocarbon-yl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(383) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(pyrroli-dinocarbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(384) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(pyrrolidino-carbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(385) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(pyrrolidinocarbon-yl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(386) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[trans-4-(pyrrolidinocarbon-yl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(387) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[trans-4-(pyrrolidinocarbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(388) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[trans-4-(pyrrolidinocarbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(389) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(cis-4-hydroxy-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(390) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[(cis-4-hydroxy-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(391) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[(cis-4-hydroxy-cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(392) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[(cis-4-hydroxy-cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(393) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[(cis-4-hydroxy-cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(394) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[(cis-4-hydroxy-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(395) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[N-(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)-N-methyl-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 243 - 246°C
R_f-Wert: 0,51 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

(396) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[N-(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)-N-methyl-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(397) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[N-(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)-N-methyl-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(398) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[N-(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)-N-methyl-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(399) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[N-(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)-N-methyl-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(400) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[N-(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)-N-methyl-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(401) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-4-methylcyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(402) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-4-methylcyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(403) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-4-methylcyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(404) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-4-methylcyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(405) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-4-methylcyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(406) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-4-methylcyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(407) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(cis-4-hydroxy-4-methylcyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(408) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[(cis-4-hydroxy-4-methylcyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(409) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[(cis-4-hydroxy-4-methylcyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(410) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[(cis-4-hydroxy-4-methylcyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(411) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[(cis-4-hydroxy-4-methylcyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(412) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[(cis-4-hydroxy-4-methylcyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(413) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-tetrahydropyranylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(414) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[4-tetrahydropyranylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(415) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[4-tetrahydropyranylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(416) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[4-tetrahydropyranylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(417) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[4-tetrahydropyranylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(418) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[4-tetrahydropyranylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(419) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(4-oxo-cyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(420) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[(4-oxo-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(421) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[(4-oxo-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(422) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[(4-oxo-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(423) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[(4-oxo-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(424) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[(4-oxo-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(425) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(4-oxo-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(426) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-(4-oxo-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(427) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-(4-oxo-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(428) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-(4-oxo-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(429) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-(4-oxo-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(430) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-(4-oxo-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(431) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-morpholino-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 218 - 221°C
R_f-Wert: 0,47 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:5:1)

(432) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-morpholino-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(433) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-morpholino-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin

(434) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-morpholino-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin

(435) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(436) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-(4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(437) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-(4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(438) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-(4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(439) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-(4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(440) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-(4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(441) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-[2-(morpholino)-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(442) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-[2-(morpholino)-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(443) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-[2-(morpholino)-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(444) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-[2-(morpholino)-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(445) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-[2-(morpholino)-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(446) 4-[(3-Methyl-phenyl)amino]-6-[2-(morpholino)-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(447) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-isopropylamino-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(448) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-isopropylamino-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(449) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-isopropylamino-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(450) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-isopropylamino-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(451) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(tert.-butylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(452) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-(tert.-butylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(453) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-(tert.-butylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(454) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-(tert.-butylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(455) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-(tert.-butylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(456) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-(tert.-butylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(457) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 227 - 231°C
R_f-Wert: 0,44 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

(458) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(459) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(460) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(461) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(462) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(463) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(1-methyl-4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(464) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-(1-methyl-4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(465) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-(1-methyl-4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(466) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-(1-methyl-4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(467) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-(1-methyl-4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(468) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-(1-methyl-4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(469) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(propargylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(470) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-(propargylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(471) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-(propargylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(472) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-(propargylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(473) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-(propargylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(474) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-(propargylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(475) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(1-pyrrolidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(476) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-(1-pyrrolidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(477) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-(1-pyrrolidinyl)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(478) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-(1-pyrrolidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(479) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(tetrahydrofurfuryl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 158 - 160°C
R_f-Wert: 0,40 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(480) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-(tetrahydrofurfurylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(481) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-(tetrahydrofurfurylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(482) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-(tetrahydrofurfurylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(483) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-(tetrahydrofurfurylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(484) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-(tetrahydrofurfurylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(485) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(3-tetrahydrofuranyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus den Verbindungen der Beispiele 2 und XIX.
Schmelzpunkt: 239 - 241°C
R_f-Wert: 0,51 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

(486) 4-[(3,4-Dichlor-phenyl)amino]-6-(3-tetrahydrofuranyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(487) 4-[(3-Chlor-phenyl)amino]-6-(3-tetrahydrofuranylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(488) 4-[(3-Brom-phenyl)amino]-6-(3-tetrahydrofuranylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(489) 4-[(3-Nitro-phenyl)amino]-6-(3-tetrahydrofuranylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(490) 4-[(3-Ethinyl-phenyl)amino]-6-(3-tetrahydrofuranylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(491) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-(1-methyl-4-piperazinyl)ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(492) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-(1-acetyl-4-piperazinyl)ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(493) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-(1-methylsulfonyl-4-piperazinyl)ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(494) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-(1-methoxycarbonyl-4-piperazinyl)ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(495) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-(1-cyan-4-piperazinyl)ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(496) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-(1-dimethylaminocarbonyl-4-piperazinyl)ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(497) 4-[(4-Amino-3,5-dibrom-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

Schmelzpunkt: 228 - 230°C

R_f-Wert: 0,40 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:3)

Ber.:	C	42,45	H	3,76	N 19,25
Gef.:		42,59		4,10	19,06

Massenspektrum: M^+ = 507

(498) 4-[(4-Amino-5-brom-3-chlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(499) 4-[(3,5-Dichlor-4-dimethylamino-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(500) 4-[(4-Acetylamino-3,5-dichlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(501) 4-[(4-Methylsulfonylamino-3,5-dichlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(502) 4-[(4-Trifluormethylsulfonylamino-3,5-dichlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(503) 4-[(3,5-Dibrom-4-hydroxy-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(504) 4-[(3,5-Dichlor-4-hydroxy-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(505) 4-[(3,5-Dichlor-4-methoxy-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(506) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[3-hydroxycyclopentylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(507) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-hydroxy-3-methyl-3-butylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(508) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[1-hydroxy-4-methyl-4-pentylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(509) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-methyl-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(510) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-phenyl-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(511) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(4-methoxyphenyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(512) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(2-hydroxymethyl-1-pyrrolidinyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(513) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(2-oxo-1-pyrrolidinyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(514) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(N-acetyl-N-methylamino)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(515) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(N,N-bis-(2-hydroxyethyl)amino)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(516) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(N-ethyl-N-(2-hydroxyethyl)amino)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(517) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(1-pyrrolidinyl)-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(518) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(2-oxo-1-imidazolidinyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(519) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(3-methyl-2-oxo-1-imidazolidinyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(520) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(N-acetyl-N-methylamino)phenylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(521) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(N,N-bis-(2-hydroxyethyl)amino)phenylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(522) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(N-ethyl-N-(2-hydroxyethyl)amino)phenylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(523) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(1-pyrrolidinyl)phenylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(524) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(2-oxo-1-imidazolidinyl)phenylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(525) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-(3-methyl-2-oxo-1-imidazolidinyl)phenylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(526) 4-[(3-Difluormethoxy-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(527) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-morpholino-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(528) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-morpholino-phenyl-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 250 - 254°C
R_f-Wert: 0,49 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

(529) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-dimethylaminopyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 203 - 205°C
R_f-Wert: 0,85 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)
Massenspektrum: M^+ = 318

(530) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-amino-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 169 - 174°C
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol/konz.Ammoniak = 100:30:1)

(531) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-dimethylamino-1-piperidinyl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 162 - 165°C
R_f-Wert: 0,48 (Kieselgel; Methylenchlorid/Methanol = 10:3)

(532) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-dimethylamino-1-ethoxy]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 98 - 100°C
R_f-Wert: 0,38 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:4)

Beispiel 2

4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-methylsulfinyl-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin und 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

---

3,9 g 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]-

pyrimidin und 6,28 g 3-Chlorperoxybenzoesäure (50%ig) in 100 ml Methylenchlorid werden 75 Minuten unter Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen wird mit Wasser versetzt, die organische Phase wird abgetrennt, mit Natriumbicarbonatlösung und Wasser gewaschen, getrocknet und einrotiert. Der Rückstand wird mit Diethylether gerührt, der Feststoff abgesaugt und getrocknet.
Ausbeute: 4,2 g,
R_f-Wert: 0,38 und 0,54 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 10:10:1)

Die Verbindungen wurden chromatographisch getrennt und charakterisiert:

a) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-methylsulfinyl-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
Schmelzpunkt: 118°C
R_f-Wert: 0,73 (Kieselgel; Essigester/Methanol = 10:1)
Massenspektrum: M^+ = 299

b) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
Schmelzpunkt: 220°C
R_f-Wert: 0,60 (Kieselgel; Essigester)
Massenspektrum: M^+ = 315

Analog Beispiel 2 werden folgende Verbindungen erhalten:

(1) 4-(Phenylamino)-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Es wird ein Überschuß an 3-Chlorperoxybenzoesäure verwendet.
R_f-Wert: 0,36 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

(2) 4-(N-Methyl-N-phenyl-amino)-6-methylsulfonyl-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Es wird ein Überschuß an 3-Chlorperoxybenzoesäure verwendet.
R_f-Wert: 0,32 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

(3) 4-[(3-Fluorphenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
R_f-Wert: 0,64 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

(4) 4-[(3-Chlorphenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

(5) 4-[(3-Bromphenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
R_f-Wert: 0,38 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

(6) 4-[(3-Trifluormethylphenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,54 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

(7) 4-[(3-Methoxyphenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,49 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

(8) 4-[(3-Ethylphenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
R_f-Wert: 0,37 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(9) 4-[(3,4-Dichlorphenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,45 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(10) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

R_f-Wert: 0,45 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:8:2)

(11) 4-[(3-Chlor-4-methoxy-phenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,60 (Kieselgel; Methylenchlorid/Essigester/Methanol = 10:4:3)

(12) 4-[(4-Amino-3-nitro-phenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,19 (Kieselgel; Methylenchlorid/Essigester/Methanol = 10:4:2)

(13) 4-[(4-Chlor-3-nitro-phenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,38 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:3)

(14) 4-[(4-Amino-3-cyano-phenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,25 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

(15) 4-[(4-Amino-3,5-dichlor-phenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,40 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

(16) 4-[(4-Amino-3,5-dibrom-phenyl)amino]-6-methylsulfonyl-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,53 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:2)

(10) 4-[(4-Trifluormethylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 229-231°C
R_f-Wert: 0,23 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

(11) 4-[(3-Fluorphenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
R_f-Wert: 0,52 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

(12) 4-[(3-Chlorphenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
R_f-Wert: 0,54 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

(13) 4-[(3-Bromphenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
R_f-Wert: 0,60 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

(14) 4-[(3-Trifluormethylphenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,62 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

(15) 4-[(3-Methoxyphenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
Schmelzpunkt: 168-170°C
R_f-Wert: 0,49 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

(16) 4-[(3-Ethylphenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
R_f-Wert: 0,53 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

(17) 4-[(3-Iodphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 240-242°C
R_f-Wert: 0,47 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	44,57	H	3,42	N 20,79
Gef.:		44,50		3,46	20,86

(18) 4-[(3-Trifluormethoxyphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 168-170°C
R_f-Wert: 0,55 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(19) 4-[(3-Cyanphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 240°C
R_f-Wert: 0,41 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(20) 4-[(3-Ethoxycarbonylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(21) 4-[(3-Isopropylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(22) 4-[(3-Cyclopropylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(23) 4-[(4-Chlorphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 218-220°C
R_f-Wert: 0,45 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	57,60	H	4,18	N 26,87
Gef.:		57,71		4,32	26,57

(24) 4-[(4-Methylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 192-194°C
R_f-Wert: 0,47 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	65,73	H	5,51	N 28,74
Gef.:		65,67		5,65	28,51

(25) 4-[(4-Methoxyphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 187-189°C

Beispiel 3

4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin

4,9 g 4-Chlor-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]pyrimidin, 2,0 g 3-Methylanilin, 2,4 ml Triethylamin und 100 ml Dioxan werden 3 Stunden auf 100°C erhitzt. Nach dem Abkühlen wird das Reaktionsgemisch eingeengt und zwischen Wasser und Methylenchlorid verteilt. Die organische Phase wird abgetrennt, getrocknet und eingeengt und der Rückstand durch Chromatographie über eine Kieselgelsäule (Petrolether/Essigester = 2:1) gereinigt. Der Feststoff wird mit Diethylether verrieben, abgesaugt und getrocknet.
Ausbeute: 2,8 g (43 % der Theorie),
Schmelzpunkt: 118-120°C
R_f-Wert: 0,55 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

Analog Beispiel 3 werden folgende Verbindungen erhalten:

(1) 4-(Phenylamino)-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,63 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

(2) 4-[(4-Fluorphenyl)amino)-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Ausgangsmaterial: Verbindung des Beispiels IV, 2 1/2 tägiges Erhitzen.
Schmelzpunkt: 200-202°C
R_f-Wert: 0,44 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	60,80	H	4,42	N 28,36
Gef.:		60,77		4,52	28,60

(3) 4-(N-Methyl-N-phenyl-amino)-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
R_f-Wert: 0,45 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

(4) 4-[(3,4-Difluorphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 212-214°C
R_f-Wert: 0,51 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(5) 4-[(3,5-Difluorphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Durchführung in Butanol bei Rückflußtemperatur in Gegenwart von N-Ethyl-diisopropylamin.
Schmelzpunkt: 199-201°C
R_f-Wert: 0,62 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(6) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 197-199°C

(7) 4-[[3,5-Bis-(trifluormethyl)-phenyl]amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 228-230°C
R_f-Wert: 0,68 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(8) 4-[(4-Fluor-3-trifluormethylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 174-176°C
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	52,75	H	3,23	N 23,06
Gef.:		52,52		3,52	22,66

(9) 4-[(4-Fluor-3-methylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 180-182°C
R_f-Wert: 0,40 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	61,92	H	4,87	N 27,08
Gef.:		61,71		4,96	26,82

R_f-Wert: 0,45 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	62,32	H	5,23	N 27,25
Gef.:		62,14		5,29	26,95

(26) 4-[(4-tert.Butylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

Schmelzpunkt: 142-144°C

R_f-Wert: 0,55 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	68,23	H	6,63	N 25,13
Gef.:		68,16		6,77	24,72

(27) 4-[[3-(Cyclopentyloxy)phenyl]amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(28) 4-[(4-Bromphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

Schmelzpunkt: 229-231°C

R_f-Wert: 0,42 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	50,42	H	3,66	N 23,52
Gef.:		50,41		3,79	23,50

(29) 4-[(2-Methylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

Schmelzpunkt: 218-220°C

R_f-Wert: 0,40 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	65,73	H	5,51	N 28,74
Gef.:		65,72		5,55	28,22

(30) 4-[(3,4-Dimethylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

Schmelzpunkt: 180-182°C

R_f-Wert: 0,40 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	66,64	H	5,92	N 27,43
Gef.:		66,56		5,99	27,51

(31) 4-[(5-Indanyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 199-201°C
R_f-Wert: 0,42 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(32) 4-[(2-Naphthyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 187-189°C
R_f-Wert: 0,38 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	69,49	H	4,91	N 25,59
Gef.:		69,22		4,96	25,87

(33) 4-[(1,2,3,4-Tetrahydro-6-naphthyl)amino]-6-(cyclopropyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(34) 4-[(3,5-Dimethylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyri-mido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 210-212°C
R_f-Wert: 0,48 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	66,64	H	5,92	N 27,43
Gef.:		66,71		6,07	27,60

(35) 4-[(2,5-Dimethylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyri-mido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 210-212°C
R_f-Wert: 0,38 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	66,64	H	5,92	N 27,43
Gef.:		66,65		5,93	27,56

(36) 4-[(3,4-Dichlorphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyri-mido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 228-230°C
R_f-Wert: 0,40 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	51,88	H	3,48	N 24,20
Gef.:		51,70		3,52	23,77

(37) 4-[(2-Fluorphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 198-200°C
R_f-Wert: 0,41 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	60,80	H	4,42	N 28,36
Gef.:		60,60		4,61	28,16

(38) 4-[(2,5-Difluorphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 238-240°C
R_f-Wert: 0,43 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	57,32	H	3,84	N 26,73
Gef.:		57,57		4,05	26,23

(39) 4-[(2-Fluor-5-methylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 200-202°C

Ber.:	C	61,92	H	4,87	N 27,08
Gef.:		61,99		4,99	27,00

(40) 4-[(2-Fluor-3-trifluormethyl-phenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 204-206°C

Ber.:	C	52,75	H	3,23	N 23,06
Gef.:		53,50		3,39	22,59

(41) 4-[(2-Fluor-3-methyl-phenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(42) 4-[(2-Fluor-5-trifluormethyl-phenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 210-212°C
R_f-Wert: 0,28 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

Ber.:	C	52,75	H	3,23	N 23,06
Gef.:		52,37		3,51	23,27

(43) 4-[(2,5-Difluor-4-methyl-phenyl)amino]-6-(cyclopropyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(44) 4-[(2,4-Difluor-3-methyl-phenyl)amino]-6-(cyclopropyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(45) 4-[(3-Nitrophenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 208-210°C
R_f-Wert: 0,32 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

Ber.:	C	55,72	H	4,05	N 30,32
Gef.:		55,58		4,12	30,42

(46) 4-[(3-Ethinylphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 279-281°C
R_f-Wert: 0,43 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

Ber.:	C	67,53	H	4,66	N 27,79
Gef.:		67,48		4,76	28,14

(47) 4-(Phenylamino)-6-(morpholino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 170-172°C
R_f-Wert: 0,47 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:2)

Ber.:	C	62,32	H	5,23	N 27,25
Gef.:		62,31		5,38	27,17

(48) 4-[N-Methyl-N-(3-methylphenyl)-amino]-6-(morpholino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 71-73°C
R_f-Wert: 0,60 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:2)

Ber.:	C	64,26	H	5,99	N 24,98
Gef.:		64,36		6,08	24,75

(49) 4-[N-Methyl-N-phenyl-amino]-6-(morpholino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 132-134°C

R_f-Wert: 0,38 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:2)

Ber.:	C	63,33	H	5,62	N 26,06
Gef.:		63,59		5,79	25,82

(50) 4-[(3-Cyclopropylphenyl)amino]-6-(morpholino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(51) 4-[(3-Cyano-4-hydroxyphenyl)amino]-6-(morpholino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(52) 4-[(3-Cyano-4-aminophenyl)amino]-6-(morpholino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(53) 4-[(4-Hydroxy-3-nitrophenyl)amino]-6-(morpholino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

(54) 4-[(4-Amino-3-nitrophenyl)amino]-6-(morpholino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin

(55) 4-[(3,4-Dichlorphenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin
Schmelzpunkt: 158-160°C
R_f-Wert: 0,48 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

(56) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido-[5,4-d]-pyrimidin
Schmelzpunkt: 140-145°C (Zers.)
R_f-Wert: 0,54 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 10:7)
Diese Verbindung läßt sich auch auf folgendem Wege erhalten: Eine Mischung von 10 g 4-Hydroxy-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]-pyrimidin, 16 ml Hexamethyldisilazan, 22.5 g 3-Chlor-4-fluor-anilin und 1 g p-Toluolsulfonsäure-Hydrat wird 12 h zum Sieden erhitzt. Dann werden 500 ml Methanol zugegeben und die Mischung eine weitere Stunde zum Sieden erhitzt. Das Lösungsmittel wird im Rotationsverdampfer abdestilliert, der Rückstand in Methylenchlorid gelöst, die Lösung mit 100 ml 2N Natronlauge extrahiert und über Magnesiumsulfat getrocknet. Nach dem Abdestil-

lieren des Lösungsmittels im Rotationsverdampfer wird der Rückstand zweimal mit je 200 ml Ether verrieben, abfiltriert und mehrfach mit Ether gewaschen.
Nach dem Trocknen erhält man 11.5 g (69 % der Theorie) der Titelverbindung mit den oben angegebenen physikalischen Daten.

(57) 4-[(3-Chlor-4-methoxy-phenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 154-156°C
R_f-Wert: 0,40 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(58) 4-[(4-Amino-3-nitro-phenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 248-250°C
R_f-Wert: 0,48 (Kieselgel; Petrolether/Essigester/Methanol = 10:10:1)

(59) 4-[(4-Chlor-3-nitro-phenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 173-175°C
R_f-Wert: 0,58 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(60) 4-[(4-Amino-3-cyano-phenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung des Beispiels XVI.
Schmelzpunkt: 225-227°C

(61) 4-[(4-Amino-3,5-dichlor-phenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 195-197°C
R_f-Wert: 0,50 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 1:1)

(62) 4-[(4-Amino-3,5-dibrom-phenyl)amino]-6-methylthio-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung des Beispiels XVII.
Schmelzpunkt: 245-247°C

(63) 4-[(2-Cyclopropylphenyl)amino]-6-(morpholino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin
Hergestellt aus der Verbindung des Beispiels XV.
Schmelzpunkt: 171-173°C

Ber.:	C	65,49	H	5,78	N 24,12
Gef.:		65,24		5,84	24,06

Beispiel 4

4-(Phenylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

Zu einer Mischung aus 10 ml Jodwasserstoffsäure (67%ig) und 2,4 g Diphosphortetrajodid werden bei 50°C 0,6 g 4-(Phenylamino)-2,8-dichlor-pyrimido[5,4-d]pyrimidin portionsweise unter Rühren zugegeben. Es wird 20 Minuten weitergerührt, auf Eis und Wasser gegossen und mit Natronlauge alkalisch gestellt. Das Gemisch wird dreimal mit Methylenchlorid extrahiert, die vereinigten Extrakte werden getrocknet und eingeengt. Der Rückstand wird in Dioxan gelöst, mit 0,5 g Palladium auf Kohle (10 % Palladium) versetzt und über Nacht unter Rückfluß erhitzt. Es wird vom Katalysator abfiltriert, das Filtrat wird eingeengt und der Rückstand durch Chromatographie über eine Aluminiumoxid-Säule mit Petrolether/Essigester (10:3) gereinigt.
Ausbeute: 0,07 g (16 % der Theorie),
Schmelzpunkt: 110-112°C
R_f-Wert: 0,55 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 2:1)

Analog Beispiel 4 werden folgende Verbindungen erhalten:

(1) 4-[(3-Bromphenyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 208-210°C
R_f-Wert: 0,30 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 2:1)

(2) 4-[(3-Chlorphenyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 187-189°C
R_f-Wert: 0,35 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 10:4)

(3) 4-[(3-Trifluormethylphenyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
R_f-Wert: 0,41 (Aluminiumoxid; Petrolether/Essigester = 2:1)
Massenspektrum: M^+ = 291

(4) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin
Schmelzpunkt: 159-160°C
R_f-Wert: 0,25 (Kieselgel; Petrolether/Essigester = 2:1)

Beispiel 5

Dragées mit 75 mg Wirksubstanz

1 Dragéekern enthält:

Wirksubstanz	75,0 mg
Calciumphosphat	93,0 mg
Maisstärke	35,5 mg
Polyvinylpyrrolidon	10,0 mg
Hydroxypropylmethylcellulose	15,0 mg
Magnesiumstearat	1,5 mg
	230,0 mg

Herstellung:
Die Wirksubstanz wird mit Calciumphosphat, Maisstärke, Polyvinylpyrrolidon, Hydroxypropylmethylcellulose und der Hälfte der angegebenen Menge Magnesiumstearat gemischt. Auf einer Tablettiermaschine werden Preßlinge mit einem Durchmesser von ca. 13 mm hergestellt, diese werden auf einer geeigneten Maschine durch ein Sieb mit 1,5 mm-Maschenweite gerieben und mit der restlichen Menge Magnesiumstearat vermischt. Dieses Granulat wird auf einer Tablettiermaschine zu Tabletten mit der gewünschten Form gepreßt.

Kerngewicht: 230 mg
Stempel: 9 mm, gewölbt

Die so hergestellten Dragéekerne werden mit einem Film überzogen, der im wesentlichen aus Hydroxypropylmethylcellulose

besteht. Die fertigen Filmdragées werden mit Bienenwachs geglänzt.

Dragéegewicht: 245 mg.

Beispiel 6

Tabletten mit 100 mg Wirksubstanz

Zusammensetzung:

1 Tablette enthält:

Wirksubstanz	100,0 mg
Milchzucker	80,0 mg
Maisstärke	34,0 mg
Polyvinylpyrrolidon	4,0 mg
Magnesiumstearat	2,0 mg
	220,0 mg

Herstellungverfahren:

Wirkstoff, Milchzucker und Stärke werden gemischt und mit einer wäßrigen Lösung des Polyvinylpyrrolidons gleichmäßig befeuchtet. Nach Siebung der feuchten Masse (2,0 mm-Maschenweite) und Trocknen im Hordentrockenschrank bei 50°C wird erneut gesiebt (1,5 mm-Maschenweite) und das Schmiermittel zugemischt. Die preßfertige Mischung wird zu Tabletten verarbeitet.

Tablettengewicht: 220 mg

Durchmesser: 10 mm, biplan mit beidseitiger Facette und einseitiger Teilkerbe.

Beispiel 7

Tabletten mit 150 mg Wirksubstanz

Zusammensetzung:

1 Tablette enthält:

Wirksubstanz	150,0 mg
Milchzucker pulv.	89,0 mg
Maisstärke	40,0 mg
Kolloide Kieselgelsäure	10,0 mg
Polyvinylpyrrolidon	10,0 mg
Magnesiumstearat	1,0 mg
	300,0 mg

Herstellung:

Die mit Milchzucker, Maisstärke und Kieselsäure gemischte Wirksubstanz wird mit einer 20%igen wäßrigen Polyvinylpyrrolidonlösung befeuchtet und durch ein Sieb mit 1,5 mm-Maschenweite geschlagen.
Das bei 45°C getrocknete Granulat wird nochmals durch dasselbe Sieb gerieben und mit der angegebenen Menge Magnesiumstearat gemischt. Aus der Mischung werden Tabletten gepreßt.

Tablettengewicht: 300 mg
Stempel: 10 mm, flach

Beispiel 8

Hartgelatine-Kapseln mit 150 mg Wirksubstanz

1 Kapsel enthält:

Wirkstoff		150,0 mg
Maisstärke getr.	ca.	180,0 mg
Milchzucker pulv.	ca.	87,0 mg
Magnesiumstearat		3,0 mg
	ca.	420,0 mg

Herstellung:

Der Wirkstoff wird mit den Hilfsstoffen vermengt, durch ein Sieb von 0,75 mm-Maschenweite gegeben und in einem geeigneten Gerät homogen gemischt.
Die Endmischung wird in Hartgelatine-Kapseln der Größe 1 abgefüllt.

Kapselfüllung: ca. 320 mg
Kapselhülle: Hartgelatine-Kapsel Größe 1.

Beispiel 9

Suppositorien mit 150 mg Wirksubstanz

1 Zäpfchen enthält:

Wirkstoff	150,0 mg
Polyäthylenglykol 1500	550,0 mg
Polyäthylenglykol 6000	460,0 mg
Polyoxyäthylensorbitanmonostearat	840,0 mg
	2 000,0 mg

Herstellung:

Nach dem Aufschmelzen der Suppositorienmasse wird der Wirkstoff darin homogen verteilt und die Schmelze in vorgekühlte Formen gegossen.

Beispiel 10

Suspension mit 50 mg Wirksubstanz

100 ml Suspension enthalten:

Wirkstoff	1,00 g
Carboxymethylcellulose-Na-Salz	0,10 g
p-Hydroxybenzoesäuremethylester	0,05 g
p-Hydroxybenzoesäurepropylester	0,01 g

Rohrzucker		10,00 g
Glycerin		5,00 g
Sorbitlösung 70%ig		20,00 g
Aroma		0,30 g
Wasser dest.	ad	100 ml

Herstellung:

Dest. Wasser wird auf 70°C erhitzt. Hierin wird unter Rühren p-Hydroxybenzoesäuremethylester und -propylester sowie Glycerin und Carboxymethylcellulose-Natriumsalz gelöst. Es wird auf Raumtemperatur abgekühlt und unter Rühren der Wirkstoff zugegeben und homogen dispergiert. Nach Zugabe und Lösen des Zuckers, der Sorbitlösung und des Aromas wird die Suspension zur Entlüftung unter Rühren evakuiert.

5 ml Suspension enthalten 50 mg Wirkstoff.

Beispiel 11

Ampullen mit 10 mg Wirksubstanz

Zusammensetzung:

Wirkstoff		10,0 mg
0,01 n Salzsäure s.q.		
Aqua bidest	ad	2,0 ml

Herstellung:

Die Wirksubstanz wird in der erforderlichen Menge 0,01 n HCl gelöst, mit Kochsalz isotonisch gestellt, sterilfiltriert und in 2 ml Ampullen abgefüllt.

Beispiel 12

Ampullen mit 50 mg Wirksubstanz

Zusammensetzung:

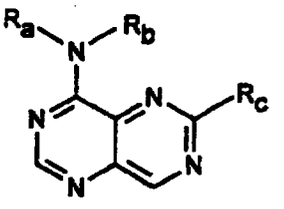
Wirkstoff		50,0 mg
0,01 n Salzsäure s.q.		
Aqua bidest	ad	10,0 ml

Herstellung:

Die Wirksubstanz wird in der erforderlichen Menge 0,01 n HCl gelöst, mit Kochsalz isotonisch gestellt, sterilfiltriert und in 10 ml Ampullen abgefüllt.

Patentansprüche

1. Pyrimido[5,4-d]pyrimidine der allgemeinen Formel



, (I)

in der

R_a ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe,

R_b eine durch die Reste R_1 bis R_3 substituierte Phenylgruppe, wobei

R_1 und R_2, die gleich oder verschieden sein können, jeweils ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom,

eine C_{1-6}-Alkyl-, Hydroxy- oder C_{1-6}-Alkoxygruppe,

eine C_{3-7}-Cycloalkyl- oder C_{4-7}-Cycloalkoxygruppe, die jeweils durch eine oder zwei Alkylgruppen oder durch eine Arylgruppe substituiert sein können,

eine gegebenenfalls durch eine Arylgruppe substituierte C_{2-5}-Alkenyl- oder C_{3-5}-Alkenyloxygruppe, wobei der Vinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine gegebenenfalls durch eine Arylgruppe substituierte C_{2-5}-Alkinyl- oder C_{3-5}-Alkinyloxygruppe, wobei der Ethinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine Aryl-, Aryloxy-, Aralkyl-, Aralkoxy-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Alkylsulfonyloxy-, Trifluormethylsulfenyl-, Trifluormethylsulfinyl-, Trifluormethylsulfo-

nyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylsulfenyl-, Aralkylsulfinyl- oder Aralkylsulfonylgruppe,

eine durch 1 bis 3 Fluoratome substituierte Methyl- oder Methoxygruppe,

eine durch 1 bis 5 Fluoratome substituierte C_{2-4}-Alkyl- oder C_{2-4}-Alkoxygruppe,

eine Nitro-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, C_{3-7}-Cycloalkylamino-, N-Alkyl-C_{3-7}-cycloalkylamino-, Arylamino-, N-Alkyl-arylamino-, Aralkylamino- oder N-Alkyl-aralkylaminogruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 4- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 5- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen jeweils durch eine Carbonylgruppe oder in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein können,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte (Alkylenimino)carbonyl- oder (Alkylenimino)sulfonylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Arylcarbonylamino-, N-Alkyl-arylcarbonylamino-, Arylsulfonylamino-, N-Al-

kyl-arylsulfonylamino-, Aralkylcarbonylamino-, N-Alkyl-aralkylcarbonylamino-, Aralkylsulfonylamino-, N-Alkyl-aralkylsulfonylamino-, Perfluoralkylsulfonylamino-, N-Alkyl-perfluoralkylsulfonylamino-, Alkylcarbonyl-, Arylcarbonyl-, Aralkylcarbonyl-, Aryl-hydroxymethyl-, Aralkyl-hydroxymethyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aralkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Arylaminocarbonyl-, N-Alkyl-arylaminocarbonyl-, Aralkylaminocarbonyl-, N-Alkyl-aralkylaminocarbonyl-, N-Hydroxy-aminocarbonyl-, N-Hydroxy-alkylaminocarbonyl-, N-Alkoxy-aminocarbonyl-, N-Alkoxy-alkylaminocarbonyl-, Cyano-, Azido-, N-Cyano-amino- oder N-Cyano-alkylaminogruppe,

eine Sulfo-, Alkoxysulfonyl-, Aminosulfonyl-, Alkylaminosulfonyl-, Dialkylaminosulfonyl-, Arylaminosulfonyl-, N-Alkyl-arylaminosulfonyl-, Aralkylaminosulfonyl- oder N-Alkyl-aralkylaminosulfonylgruppe,

eine Phosphono-, O-Alkyl-phosphono-, O,O'-Dialkyl-phosphono-, O-Aralkyl-phosphono- oder O,O'-Diaralkyl-phosphonogruppe,

eine durch R_4 substituierte Alkyl-oder Alkoxygruppe, wobei

R_4 eine Hydroxy-, Alkoxy-, Aryloxy-, Aralkoxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylsulfenyl-, Aralkylsulfinyl-, Aralkylsulfonyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl- oder Cyanogruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 4- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 5- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen durch eine Carbonylgruppe oder in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder

Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein können, oder

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte (Alkylenimino)carbonylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann, darstellt,

R_3 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Alkyl-, Alkoxy- oder Trifluormethylgruppe oder

R_2 zusammen mit R_3, sofern diese an benachbarte Kohlenstoffatome gebunden sind, auch eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Alkylgruppen substituierte Methylendioxygruppe, eine gegebenenfalls durch ein oder zwei Alkylgruppen substituierte n-C_{3-6}-Alkylengruppe oder eine gegebenenfalls durch ein oder zwei Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome, durch eine oder zwei Hydroxy-, Alkyl-, Alkoxy-, Trifluormethyl- oder Cyangruppen substituierte 1,3-Butadien-1,4-diylengruppe, wobei die Substituenten gleich oder verschieden sein können, oder

R_a zusammen mit R_1, sofern R_1 in o-Stellung zu dem durch R_a substituierten Stickstoffatom steht, auch eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Alkylgruppen substituierte n-C_{2-4}-Alkylengruppe darstellen, und

R_c ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom,

eine Alkyl-, C_{3-7}-Cycloalkyl-, C_{3-7}-Cycloalkyl-C_{1-3}-alkyl-, Aryl-, Aralkyl-, Hydroxy-, Aryloxy-, Aralkoxy-, Mercapto-, C_{1-8}-Alkylsulfenyl-, C_{1-8}-Alkylsulfinyl-, C_{1-8}-Alkylsulfonyl-,

C_{4-7}-Cycloalkylsulfenyl-, C_{4-7}-Cycloalkylsulfinyl-, C_{4-7}-Cycloalkylsulfonyl-, C_{3-7}-Cycloalkyl-C_{1-3}-alkylsulfenyl-, C_{3-7}-Cycloalkyl-C_{1-3}-alkylsulfinyl-, C_{3-7}-Cycloalkyl-C_{1-3}-alkylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylsulfenyl-, Aralkylsulfinyl- oder Aralkylsulfonylgruppe,

eine C_{1-8}-Alkoxygruppe, die durch eine Alkoxycarbonyl-, Cyano-, Carboxy-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl- oder Dialkylaminocarbonylgruppe substituiert sein kann,

eine C_{2-8}-Alkoxygruppe, die durch eine Hydroxy-, Alkoxy-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-N-(alkylcarbonyl)amino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-N-(alkylsulfonyl)amino-, Alkoxycarbonylamino- oder N-Alkyl-N-(alkoxycarbonyl)aminogruppe, durch eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 5- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 5- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen jeweils durch eine Carbonylgruppe und zusätzlich in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Formyl-imino-, N-Dialkylaminocarbonyl-imino-, N-Alkoxycarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann, substituiert ist,

eine durch zwei Hydroxy- oder Alkoxygruppen substituierte C_{3-8}-Alkoxygruppe,

eine durch eine C_{3-7}-Cycloalkylgruppe substituierte C_{1-8}-Alkoxygruppe, wobei der Cycloalkylteil jeweils durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituiert sein kann und wobei in den vorstehend erwähnten C_{4-7}-Cycloalkylteilen jeweils eine Methylengruppe durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcar-

bonyl-imino-, N-Alkoxycarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Hydroxygruppen oder durch eine Alkoxy-, Alkoxycarbonyl-, Cyano-, Carboxy-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-N-(alkylcarbonyl)amino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-N-(alkylsulfonyl)amino-, Alkoxycarbonylamino- oder N-Alkyl-N-(alkoxycarbonyl)aminogruppe substituierte C_{4-7}-Cycloalkoxygruppe, wobei in den vorstehend erwähnten C_{5-7}-Cycloalkoxygruppen jeweils eine Methylengruppe durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkoxycarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine gegebenenfalls durch eine Arylgruppe oder C_{3-7}-Cycloalkylgruppe substituierte C_{3-8}-Alkenyloxygruppe, wobei der Vinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine gegebenenfalls durch eine Arylgruppe oder C_{3-7}-Cycloalkylgruppe substituierte C_{3-8}-Alkinyloxygruppe, wobei der Ethinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder 1 bis 2 Arylgruppen substituierte 4- bis 8-gliedrige Alkylenimino-gruppe, die zusätzlich durch den Rest R_5 substituiert sein kann, wobei

R_5 eine Aryl-, Aralkyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Cyano-, Hydroxy-, Alkoxy-, Aryloxy-, Aralkoxy-, Alkylcarbonyloxy-, Arylcarbonyloxy-, Amino-, Alkylamino-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, Dialkylamino-, Cyanamino-, Formylamino-, N-(Alkyl)-N-(hydroxy-C_{2-4}-alkyl)amino- oder Bis-(hydroxy-C_{2-4}-alkyl)aminogruppe,

* C L N S *

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte (Alkylenimino)carbonylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder eine Hydroxyalkylgruppe substituierte 4- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 5- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen durch eine Carbonylgruppe ersetzt sein können,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder eine Hydroxyalkylgruppe substituierte 6- oder 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung des Alkyleniminoteils durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkylimino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Arylimino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt ist und zusätzlich im Alkyleniminoteil der vorstehend erwähnten Gruppen jeweils eine oder zwei der zu den Stickstoffatomen benachbarten Methylengruppen durch eine Carbonylgruppe ersetzt sein können,

eine durch eine Hydroxy-, Alkoxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-,Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino- oder eine Hydroxyalkylgruppe substituierte 4- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe,

eine Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Arylcarbo-

nylamino-, N-Alkyl-arylcarbonylamino-, Arylsulfonylamino-, N-Alkyl-arylsulfonylamino-, Aralkylcarbonylamino-, N-Alkyl-aralkylcarbonylamino-, Aralkylsulfonylamino-, N-Alkyl-aralkylsulfonylamino-, Alkoxycarbonylamino-, N-Alkyl-alkoxycarbonylamino-, Aralkoxycarbonylamino- oder N-Alkyl-aralkoxycarbonylaminogruppe,

eine $(NR_7R_8)CONR_6$- oder $(NR_7R_8)SO_2NR_6$-Gruppe, in denen

R_6, R_7 und R_8, die gleich oder verschieden sein können, jeweils ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe oder R_6 und R_7 zusammen eine n-C_{2-4}-Alkylengruppe und R_8 ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe darstellen,

eine Carboxyalkyl-, Alkoxycarbonylalkyl-, Aminocarbonylalkyl-, Alkylaminocarbonylalkyl- oder Dialkylaminocarbonylalkylgruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte (Alkylenimino)carbonylalkylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine (Carboxyalkyl)oxy-, (Alkoxycarbonylalkyl)oxy-, (Aminocarbonylalkyl)oxy-, (Alkylaminocarbonylalkyl)oxy- oder (Dialkylaminocarbonylalkyl)oxy-gruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte [(Alkylenimino)carbonylalkyl]oxy-gruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine Cyanoalkyl-, Hydroxyalkyl-, Alkoxyalkyl-, Aryloxyalkyl-, Aminoalkyl-, Alkylaminoalkyl- oder Dialkylaminoalkylgruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte (Alkylenimino)alkylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine Alkylcarbonylaminoalkyl-, N-Alkyl-alkylcarbonylaminoalkyl-, Alkylsulfonylaminoalkyl-, N-Alkyl-alkylsulfonylaminoalkyl-, Arylcarbonylaminoalkyl-, N-Alkyl-arylcarbonylaminoalkyl-, Arylsulfonylaminoalkyl-, N-Alkyl-arylsulfonylaminoalkyl-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylsulfenyl-, Aralkylsulfinyl-, Aralkylsulfonyl-, Alkylsulfenylalkyl-, Alkylsulfinylalkyl-, Alkylsulfonylalkyl-, Arylsulfenylalkyl-, Arylsulfinylalkyl- oder Arylsulfonylalkylgruppe oder

eine C_{3-7}-Cycloalkylgruppe, wobei in einer C_{5-7}-Cycloalkylgruppe eine Methylengruppe durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein kann, darstellt,

oder R_C eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder durch eine Arylgruppe substituierte 6- bis 8-gliedrige Alkyleniminogruppe, die zusätzlich durch den Rest R_5 substituiert sein kann, wobei in den vorstehend erwähnten Alkyleniminogruppen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, N-Oxido-N-alkylimino- oder R_9N-Gruppe ersetzt ist, wobei

R_9 ein Wasserstoffatom, eine Alkyl-, Hydroxy-C_{2-4}-alkyl-, Alkoxy-C_{2-4}-alkyl-, Amino-C_{2-4}-alkyl-, Alkylamino-C_{2-4}-alkyl-, Dialkylamino-C_{2-4}-alkyl-, (Hydroxy-C_{2-4}-alkoxy)-C_{2-4}-alkyl-, Aminocarbonylalkyl-, Alkylaminocarbonylalkyl-, Dialkylaminocarbonylalkyl-, Aryl-, Aralkyl-, Formyl-, Alkylcarbonyl-, Alkylsulfonyl-, Arylcarbonyl-, Aryl-sulfonyl-, Aralkylcarbonyl-, Aralkylsulfonyl-, Alkoxycarbonyl-, Cyano-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl- oder Dialkylaminocarbonylgruppe oder eine (Alkylenimino)carbonylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in einem 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteil eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein kann, darstellt,

oder R_c eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 1-Pyrrolidinylgruppe, in der zwei Wasserstoffatome am Kohlenstoffgerüst durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 2 bis 6 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 1 bis 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 bis 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Atom getrennt sind, wobei die vorstehend erwähnten 1-Pyrrolidinylgruppen zusätzlich durch den Rest R_5, der wie vorstehend erwähnt definiert ist, substituiert sein können,

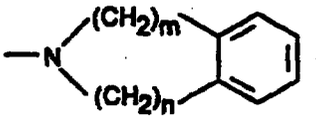
eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 1-Piperidinyl- oder 1-Azacyclohept-1-yl-gruppe, in denen zwei Wasserstoffatome am Kohlenstoffgerüst durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 2 bis 6 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 1 bis 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen

befinden, die durch ein Atom getrennt sind, oder 1 bis 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch zwei Atome getrennt sind, wobei die vorstehend erwähnten 1-Piperidinyl- und 1-Azacyclohept-1-yl-gruppen zusätzlich durch den Rest R_5, der wie vorstehend erwähnt definiert ist, substituiert sein können,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 1-Pyrrolidinylgruppe, in der zwei Wasserstoffatome in 3-Stellung durch eine $-O-CH_2CH_2-O-$ oder $-O-CH_2CH_2CH_2-O-$Gruppe substituiert sind,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 1-Piperidinyl- oder 1-Azacyclohept-1-yl-gruppe, in denen in 3-Stellung oder in 4-Stellung jeweils zwei Wasserstoffatome durch eine $-O-CH_2CH_2-O-$ oder $-O-CH_2CH_2CH_2-O-$Gruppe substituiert sind,

eine Gruppe der Formel



in der
m und n, die gleich oder verschieden sein können, die Zahlen 1 bis 3 oder
m die Zahl 0 und n die Zahl 2, 3 oder 4 bedeuten, wobei zusätzlich der obige Benzoteil durch Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome, durch Alkyl-, Trifluormethyl-, Hydroxy-, Alkoxy- oder Cyanogruppen und der obige gesättigte cyclische Iminoteil durch 1 oder 2 Alkylgruppen, wobei die Substituenten jeweils gleich oder verschieden sein können, mono- oder disubstituiert sein kann, oder

eine $(R_{10}NR_{11})$-Gruppe, in der

R_{10} und R_{11} die gleich oder verschieden sein können, jeweils ein Wasserstoffatom,

eine C_{1-16}-Alkylgruppe, die durch 1 oder 2 Aryl- oder C_{3-7}-Cycloalkylgruppen, durch eine Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylaminocarbonyl-, Cyano-, Hydroxy-, Alkoxy-, Aryloxy-, Aralkoxy-, C_{2-4}-Alkylendioxy-, Alkylcarbonyloxy-, Arylcarbonyloxy-, Formylamino-, Amino-, Alkylamino- oder Dialkylaminogruppe, durch eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte (Alkylenimino)carbonylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in einem 6- oder 7-gliedrigen Alkyleniminoteil jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Aryl-imino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

durch eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 4- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 6- oder 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl- oder R_9N-Gruppe ersetzt sein kann, wobei R_9 wie eingangs definiert ist, und zusätzlich in den vorstehend erwähnten 5- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine oder zwei zu den Stickstoffatomen benachbarte Methylengruppen durch eine Carbonylgruppe ersetzt sein können,

durch eine Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Arylcarbonylamino-, N-Alkyl-arylcarbonylamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Arylsulfonylamino-, N-Alkyl-arylsulfonylamino-, Aralkylcarbonylamino-, N-Alkyl-aralkylcarbonylamino-, Aralkylsulfonylamino-, N-Alkyl-aralkylsulfonylamino-, Alkoxycarbonylamino-, N-Alkyl-alkoxycarbonylamino-, Aralkoxycarbonylamino- oder N-Alkyl-aralkoxycarbonylaminogruppe, durch eine (R_8NR_7)-CO-NR_6- oder (R_8NR_7)-SO_2-

* C L M S *

NR_6-Gruppe, wobei R_6, R_7 und R_8 wie eingangs definiert sind, durch eine Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylsulfenyl-, Aralkylsulfinyl- oder Aralkylsulfonylgruppe, durch eine durch R_5 und gegebenenfalls zusätzlich durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte C_{4-7}-Cycloalkylgruppe, wobei R_5 wie eingangs definiert ist, durch eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, in der eine Methylengruppe durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl- oder NR_9-Gruppe ersetzt ist oder durch ein Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom substituiert sein kann,

eine durch 2 oder 3 Fluoratome substituierte C_{2-10}-Alkylgruppe,

eine durch 4 oder 5 Fluoratome substituierte C_{3-10}-Alkylgruppe,

eine durch eine 1,4,7,10-Tetraoxacyclododecyl-, 1,4,7,10,13-Pentaoxacyclopentadecyl- oder eine 1,4,7,10,13,16-Hexaoxacyclooctadecylgruppe substituierte Methylgruppe,

eine durch 2 bis 5 Hydroxy- oder Alkoxygruppen substituierte C_{3-10}-Alkylgruppe,

eine durch eine Arylgruppe und eine Hydroxygruppe substituierte C_{2-6}-Alkylgruppe, die zusätzlich durch eine Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert sein kann,

eine durch eine Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino- oder Alkoxycarbonylaminogruppe und zusätzlich durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituierte C_{3-6}-Alkylgruppe,

eine gegebenenfalls durch eine Arylgruppe oder C_{3-7}-Cycloalkylgruppe substituierte Alkenyl- oder Alkinylgruppe mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, wobei der Vinyl- oder Ethinylteil nicht mit dem Stickstoffatom verknüpft sein kann,

eine C_{2-4}-Alkylgruppe, die durch eine C_{2-4}-Alkoxygruppe substituiert ist, welche in ω-Position durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert ist,

eine Arylgruppe,

eine Cyclopropylgruppe, die durch 1 oder 2 Alkylgruppen, durch eine Aryl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl- oder Dialkylaminocarbonylgruppe oder durch eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte (Alkylenimino)carbonylgruppe mit jeweils 4 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil substituiert sein kann, wobei in den vorstehend erwähnten 6- oder 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, N-Alkylimino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Arylimino- oder N-Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte C_{4-7}-Cycloalkylgruppe, die zusätzlich durch R_5, der wie eingangs definiert ist, substituiert sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 2 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, die zusätzlich durch eine N,N-Dialkyl-N-oxido-aminogruppe substituiert ist,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkenylgruppe, wobei der Vinylteil nicht mit dem Stickstoffatom der ($R_{11}NR_{10}$)-Grupppe verknüpft sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte C_{4-7}-Cycloalkylgruppe, die zusätzlich durch R_5 substituiert sein kann, wobei in dem Cycloalkylteil eine Methylengruppe durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, N-Alkyl-N-oxido-imino- oder R_9N-Gruppe ersetzt ist, wobei R_5 und R_9 wie eingangs definiert sind,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte C_5-C_7-Cycloalkyl- oder C_5-C_7-Cycloalkylalkylgruppe, in denen jeweils eine Methylengruppe im Cycloalkylteil durch eine Carbonylgruppe ersetzt ist,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte Cyclopentyl- oder Cyclopentylalkylgruppe, in denen jeweils zwei Wasserstoffatome im Cyclopentylteil durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 2 bis 6 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 1 bis 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 bis 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Kohlenstoffatom getrennt sind, wobei die vorstehend erwähnten Ringe zusätzlich durch den Rest R_5, der wie eingangs definiert ist, substituiert sein können,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte Cyclohexyl-, Cyclohexylalkyl-, Cycloheptyl- oder Cycloheptylalkylgruppe, in denen jeweils zwei Wasserstoffatome im Cycloalkylteil durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 2 bis 6 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 1 bis 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Kohlenstoffatom getrennt sind, oder 1 bis 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch zwei Kohlenstoffatome getrennt sind, wobei die vorstehend erwähnten Ringe zusätzlich durch den Rest R_5, der wie eingangs definiert ist, substituiert sein können,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 3-Cyclohexen-1-yl- oder 3-Cyclohexen-1-yl-alkylgruppe, in denen

im Cyclohexenylteil zwei Wasserstoffatome in 2,5-Stellung durch eine n-C_{1-3}-Alkylenbrücke ersetzt sind,

eine 3-Chinuclidinyl-, 4-Chinuclidinyl-, 2-Chinuclidinyl-alkyl-, 3-Chinuclidinyl-alkyl-, 4-Chinuclidinyl-alkyl-, Azabicyclo[2.2.1]hept-4-yl-, Azabicyclo[2.2.1]hept-4-yl-alkyl- oder Adamantylgruppe, oder

R_{10} ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe und R_{11} eine Hydroxy-, Alkoxy- oder Cyanogruppe darstellen, bedeuten,

deren Tautomeren, deren Stereoisomere und deren Salze,

wobei, sofern nichts anderes erwähnt wurde,

unter den bei der Definition der vorstehend erwähnten Reste erwähnten Arylteilen eine Phenylgruppe zu verstehen ist, die jeweils durch R_{12} monosubstituiert, durch R_{13} mono-, di- oder trisubstituiert oder durch R_{12} monosubstituiert und zusätzlich durch R_{13} mono- oder disubstituiert sein kann, wobei die Substituenten gleich oder verschieden sein können, und

R_{12} eine Cyano-, Carboxy-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Alkoxycarbonyl-, Alkylcarbonyl-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Alkylsulfonyloxy-, Perfluoralkyl-, Perfluoralkoxy-, Nitro-, Amino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, N-Alkyl-(hydroxy-C_{2-4}-alkyl)-amino-, Bis-(hydroxy-C_{2-4}-alkyl)amino-, Phenylalkylcarbonylamino-, Phenylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, Phenylalkylsulfonylamino-, Phenylsulfonylamino-, N-Alkyl-phenylalkylcarbonylamino-, N-Alkyl-phenylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-phenylalkylsulfonylamino-, N-Alkyl-phenylsulfonylamino-, Aminosulfonyl-, Alkylaminosulfonyl-, Dialkylaminosulfonyl-, (R_8NR_7)-CO-NR_6- oder (R_8NR_7)-

* C L M S *

SO_2-NR_6-Gruppe, wobei R_6, R_7 und R_8 wie eingangs definiert sind,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder eine Hydroxyalkylgruppe substituierte 5- bis 7-gliedrige Alkylenimino-gruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder eine R_9N-Gruppe ersetzt sein kann, wobei R_9 wie eingangs definiert ist,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder eine Hydroxyalkylgruppe substituierte 5- bis 7-gliedrige Alkylenimino-gruppe, wobei jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen jeweils durch eine Carbonylgruppe ersetzt ist, und

R_{13} eine Alkyl-, Hydroxy- oder Alkoxygruppe, ein Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom darstellen, wobei zwei Reste R_{13}, sofern diese an benachbarte Kohlenstoffatome gebunden sind, auch eine Alkylengruppe mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, eine 1,3-Butadien-1,4-diylengruppe oder eine Methylendioxygruppe darstellen können,

sowie, soweit nichts anderes erwähnt wurde, die vorstehend erwähnten Alkyl-, Alkylen- und Alkoxyteile jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten.

2. Pyrimido[5,4-d]pyrimidine der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 mit der Maßgabe, daß, sofern nichts anderes erwähnt wurde, jedes Kohlenstoffatom in den im Anspruch 1 erwähnten Alkylen- oder Cycloalkylenteilen, das an ein Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom gebunden ist, an kein weiteres Halogen-, Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom gebunden sein kann,

deren Tautomeren, deren Stereoisomere und deren Salze.

3. Pyrimido[5,4-d]pyrimidine der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der

R_a ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe,

R_b eine durch die Reste R_1 bis R_3 substituierte Phenylgruppe, wobei

R_1 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom,

eine C_{1-6}-Alkyl-, Hydroxy- oder C_{1-6}-Alkoxygruppe,

eine C_{3-6}-Cycloalkyl- oder C_{5-6}-Cycloalkoxygruppe,

eine C_{2-5}-Alkenyl- oder C_{3-5}-Alkenyloxygruppe, wobei der Vinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine C_{2-5}-Alkinyl- oder C_{3-5}-Alkinyloxygruppe, wobei der Ethinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine Aryl-, Aryloxy-, Aralkyl-, Aralkoxy-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Alkylsulfonyloxy-, Trifluormethylsulfenyl-, Trifluormethylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylsulfenyl-, Aralkylsulfinyl- oder Aralkylsulfonylgruppe,

eine durch 1 bis 3 Fluoratome substituierte Methyl- oder Methoxygruppe,

eine durch 1 bis 5 Fluoratome substituierte C_{2-4}-Alkyl- oder C_{2-4}-Alkoxygruppe,

eine Nitro-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, C_{3-6}-Cycloalkylamino-, N-Alkyl-C_{3-6}-cycloalkylamino-, Arylamino-, N-Alkyl-arylamino-, Aralkylamino- oder N-Alkyl-aralkylaminogruppe,

eine 5- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen jeweils durch eine Carbonylgruppe oder in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom, durch eine Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein können,

eine (Alkylenimino)carbonyl- oder (Alkylenimino)sulfonylgruppe mit jeweils 5 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom, durch eine Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Arylcarbonylamino-, N-Alkyl-arylcarbonylamino-, Arylsulfonylamino-, N-Alkyl-arylsulfonylamino-, Aralkylcarbonylamino-, N-Alkyl-aralkylcarbonylamino-, Aralkylsulfonylamino-, N-Alkyl-aralkylsulfonylamino-, Trifluormethylsulfonylamino-, N-Alkyl-trifluormethylsulfonylamino-, Alkylcarbonyl-, Arylcarbonyl-, Aralkylcarbonyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Arylaminocarbonyl-, N-Alkyl-arylaminocarbonyl-, Aralkylaminocarbonyl-, N-Alkyl-aralkylaminocarbonyl-, N-Hydroxy-aminocarbonyl-, N-Hydroxy-alkylaminocarbonyl-, N-Alkoxy-aminocarbonyl-, N-Alkoxy-alkylaminocarbonyl-, Cyano-, Azido-, N-Cyano-amino- oder N-Cyano-alkylaminogruppe,

eine Sulfo-, Aminosulfonyl-, Alkylaminosulfonyl-, Dialkylaminosulfonyl-, Arylaminosulfonyl-, N-Alkyl-arylaminosulfonyl-, Aralkylaminosulfonyl- oder N-Alkyl-aralkylaminosulfonylgruppe,

eine Phosphono-, O-Alkyl-phosphono-, O,O'-Dialkyl-phosphono- oder O,O'-Diaralkyl-phosphonogruppe,

eine durch R_4 substituierte Alkyl- oder Alkoxygruppe, wobei

* C L M S *

R_4 eine Hydroxy-, Alkoxy-, Aryloxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl- oder Cyanogruppe oder

eine (Alkylenimino)carbonylgruppe mit jeweils 5 bis 7 Ringatomen im Alkyleniminoteil, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom, durch eine Imino- oder N-Alkyl-iminogruppe ersetzt sein kann, darstellt,

R_2 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Alkyl-, Trifluormethyl-, Hydroxy-, Alkoxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Trifluormethylsulfonylamino-, N-Alkyl-trifluormethylsulfonylamino- oder Cyanogruppe und

R_3 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Alkyl-, Trifluormethyl- oder Alkoxygruppe oder

R_2 zusammen mit R_3, sofern diese an benachbarte Kohlenstoffatome gebunden sind, auch eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Alkylgruppen substituierte Methylendioxygruppe, eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Alkylgruppen substituierte n-C_{3-6}-Alkylengruppe oder eine gegebenenfalls durch ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, durch eine Hydroxy-, Alkyl-, Alkoxy-, Trifluormethyl- oder Cyangruppe substituierte 1,3-Butadien-1,4-diylengruppe oder

R_a zusammen mit R_1, sofern R_1 in o-Stellung zu dem durch R_a substituierten Stickstoffatom steht, auch eine n-C_{2-3}-Alkylengruppe darstellen, und

R_C ein Wasserstoff- oder Chloratom,

eine Alkyl-, Aryl-, Aralkyl-, Mercapto-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl- oder Alkylsulfonylgruppe,

eine Hydroxy-, Aryloxy- oder Aralkoxygruppe,

eine C_{1-6}-Alkoxygruppe, die durch eine Alkoxycarbonyl-, Cyano-, Carboxy-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl- oder Dialkylaminocarbonylgruppe substituiert sein kann,

eine C_{2-6}-Alkoxygruppe, die durch eine Hydroxy-, Alkoxy-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino- oder Alkoxycarbonylaminogruppe, durch eine gegebenenfalls durch 1 bis 2 Alkylgruppen substituierte 5- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 5- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen jeweils durch eine Carbonylgruppe oder in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder durch eine Carbonyl-, Imino-, Alkyl-imino-, Alkylcarbonyl-imino-, Alkoxycarbonyl-imino-, Alkylsulfonyl-imino-, Formyl-imino-, Dialkylaminocarbonyl-imino-, Aryl-imino- oder Aralkyl-iminogruppe ersetzt sein kann, substituiert ist,

eine durch zwei Hydroxy- oder Alkoxygruppen substituierte C_{3-6}-Alkoxygruppe,

eine durch eine C_{3-7}-Cycloalkylgruppe substituierte Alkoxygruppe, wobei der Cycloalkylteil jeweils durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituiert sein kann und wobei in den vorstehend erwähnten C_{4-7}-Cycloalkylteilen jeweils eine Methylengruppe durch ein Sauerstoffatom, durch eine Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkoxycarbonyl-imino- oder N-Aryl-iminogruppe ersetzt sein kann,

eine gegebenenfalls durch eine Hydroxy-, Alkoxy-, Alkoxycarbonyl-, Cyano-, Carboxy-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino- oder Alkoxycarbonylaminogruppe substituierte C_{4-7}-Cycloalkoxygruppe,

eine C_{5-7}-Cycloalkoxygruppe, wobei in der vorstehend erwähnten Cyclopentyloxygruppe jeweils eine Methylengruppe in 3-Stellung, in den vorstehend erwähnten C_{6-7}-Cycloalkoxygruppen jeweils eine Methylengruppe in 3- oder 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder durch eine Imino-, Alkyl-imino-, Alkylcarbonyl-imino-, Alkoxycarbonyl-imino-, Alkylsulfonyl-imino-, Aryl-imino- oder Aralkyl-iminogruppe ersetzt ist,

eine C_{3-6}-Alkenyloxygruppe, wobei der Vinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine C_{3-6}-Alkinyloxygruppe, wobei der Ethinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder eine Arylgruppe substituierte 4- bis 8-gliedrige Alkyleniminogruppe, die zusätzlich durch den Rest R_5 substituiert sein kann, wobei

R_5 eine Aryl-, Aralkyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Piperazinocarbonyl-, 4-Alkyl-piperazinocarbonyl-, Cyano-, Hydroxy-, Alkoxy-, Aryloxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, N-Alkyl-hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, Di(hydroxy-C_{2-4}-alkyl)amino-, Formylamino-, Cyanamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkoxycarbonylamino-, N-Alkyl-alkoxycarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Arylcarbonylamino-, N-Alkyl-arylcarbonylamino-, Arylsulfonylamino-, N-Alkyl-arylsulfonylamino-, Carboxyalkyl-, Alkoxycarbonyl-

alkyl-, Aminocarbonylalkyl-, Alkylaminocarbonylalkyl-, Dialkylaminocarbonylalkyl-, Pyrrolidinocarbonylalkyl-, Piperidinocarbonylalkyl-, Morpholinocarbonylalkyl-, Piperazinocarbonylalkyl-, 4-Alkyl-piperazinocarbonylalkyl-, Cyanoalkyl-, Hydroxyalkyl-, Alkoxyalkyl-, Aryloxyalkyl-, Aminoalkyl-, Alkylaminoalkyl-, Dialkylaminoalkyl-, Alkylcarbonylaminoalkyl-, N-Alkyl-alkylcarbonylaminoalkyl-, Alkylsulfonylaminoalkyl-, N-Alkyl-alkylsulfonylaminoalkyl-, Arylcarbonylaminoalkyl-, N-Alkyl-arylcarbonylaminoalkyl-, Arylsulfonylaminoalkyl-, N-Alkyl-arylsulfonylaminoalkyl-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Alkylsulfenylalkyl-, Alkylsulfinylalkyl-, Alkylsulfonylalkyl-, Arylsulfenylalkyl-, Arylsulfinylalkyl-, Arylsulfonylalkyl-, Carboxyalkoxy-, Alkoxycarbonylalkoxy-, Aminocarbonylalkoxy-, Alkylaminocarbonylalkoxy-, Dialkylaminocarbonylalkoxy-, Pyrrolidinocarbonylalkoxy-, Piperidinocarbonylalkoxy-, Morpholinocarbonylalkoxygruppe oder eine (R_8NR_7)-CO-NR_6-Gruppe, wobei

R_6, R_7 und R_8, die gleich oder verschieden sein können, jeweils ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe oder R_6 und R_7 zusammen eine n-C_{2-3}-Alkylengruppe und R_8 ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe darstellen,

eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Alkylgruppen oder eine Hydroxymethylgruppe substituierte Pyrrolidino-, Piperidino-, Morpholino-, Piperazino-, 4-Alkylpiperazino- oder 4-Alkylcarbonylpiperazinogruppe, wobei im heterocyclischen Teil der vorstehend erwähnten Gruppen jeweils eine oder zwei der zu den Stickstoffatomen benachbarten Methylengruppen durch eine Carbonylgruppe ersetzt sein können,

oder R_c eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen oder durch eine Arylgruppe substituierte 6- bis 8-gliedrige Alkyleniminogruppe, die zusätzlich durch den Rest R_5 substituiert sein kann, wobei in den vorstehend erwähnten Alkyleniminogruppen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch

ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, N-Oxido-N-alkylimino- oder R_9N-Gruppe ersetzt ist, wobei

R_9 ein Wasserstoffatom, eine Alkyl-, Hydroxy-C_{2-4}-alkyl-, Alkoxy-C_{2-4}-alkyl-, Hydroxy-C_{2-4}-alkoxy-C_{2-4}-alkyl-, Aminocarbonylalkyl-, Alkylaminocarbonylalkyl-, Dialkylaminocarbonylalkyl-, Amino-C_{2-4}-alkyl-, Alkylamino-C_{2-4}-alkyl-, Dialkylamino-C_{2-4}-alkyl-, Aryl-, Aralkyl-, Formyl-, Alkylcarbonyl-, Alkylsulfonyl-, Arylcarbonyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylcarbonyl-, Aralkylsulfonyl-, Alkoxycarbonyl-, Cyano-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl- oder Dialkylaminocarbonylgruppe darstellt,

oder R_c eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte 1-Pyrrolidinylgruppe, in der zwei Wasserstoffatome am Kohlenstoffgerüst durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 4 oder 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 3 oder 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 oder 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Atom getrennt sind,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte 1-Piperidinyl- oder 1-Azacyclohept-1-yl-gruppe, in denen zwei Wasserstoffatome am Kohlenstoffgerüst durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 4 oder 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 3 oder 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 oder 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Atom getrennt sind, oder 1 oder 2 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasser-

* C L M S *

stoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch zwei Atome getrennt sind,

eine 1-Pyrrolidinylgruppe, in der zwei Wasserstoffatome in 3-Stellung durch eine $-O-CH_2CH_2-O-$ oder $-O-CH_2CH_2CH_2-O-$Gruppe ersetzt sind,

eine 1-Piperidinyl- oder 1-Azacyclohept-1-yl-gruppe, in denen zwei Wasserstoffatome in 3-Stellung oder in 4-Stellung durch eine $-O-CH_2CH_2-O-$ oder $-O-CH_2CH_2CH_2-O-$Gruppe ersetzt sind,

eine 2-Isoindolinyl-, 1,2,3,4-Tetrahydro-isochinolin-2-yl- oder 2,3,4,5-Tetrahydro-1H-3-benzazepin-3-yl-Gruppe, wobei der Benzoteil der vorstehend erwähnten Gruppen jeweils durch ein Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom, durch eine Trifluormethylgruppe oder durch eine oder zwei Alkyl- oder Alkoxygruppen substituiert sein kann, oder

eine $(R_{10}NR_{11})$-Gruppe darstellt, in der

R_{10} ein Wasserstoffatom oder eine C_{1-8}-Alkylgruppe, die ab Position 2 durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert sein kann,

R_{11} ein Wasserstoffatom,

eine C_{1-10}-Alkylgruppe, die durch eine Aryl-, C_{3-7}-Cycloalkyl-, Hydroxy-, Alkoxy-, Aryloxy-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylaminocarbonyl-, Cyano-, Formylamino-, Amino-, Alkylamino- oder Dialkylaminogruppe, durch eine Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Piperazinocarbonyl- oder 4-Alkyl-piperazinocarbonylgruppe,

durch eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte 5- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 6- oder 7-gliedrigen Alkyleniminoteilen

jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Sulfinyl-, Sulfonyl- oder R_9N-Gruppe ersetzt sein kann, wobei R_9 wie eingangs definiert ist,

durch eine Pyrrolidino-, Piperidino-, Piperazino- oder 4-Alkylpiperazinogruppe, wobei jeweils eine oder zwei der zu den Stickstoffatomen benachbarten Methylengruppen durch eine Carbonylgruppe ersetzt sind,

durch eine Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Arylcarbonylamino-, N-Alkyl-arylcarbonylamino-, Arylsulfonylamino-, N-Alkyl-arylsulfonylamino-, Aralkylcarbonylamino-, N-Alkyl-aralkylcarbonylamino-, Aralkylsulfonylamino-, N-Alkyl-aralkylsulfonylamino-, Alkoxycarbonylamino- oder N-Alkyl-alkoxycarbonylaminogruppe, durch eine (R_8NR_7)-CO-NR_6-Gruppe, wobei R_6 bis R_8 wie eingangs definiert sind, durch eine Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Arylsulfenyl-, Arylsulfinyl-, Arylsulfonyl-, Aralkylsulfenyl-, Aralkylsulfinyl- oder Aralkylsulfonylgruppe oder durch eine C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, in der eine Methylengruppe durch ein Sauerstoffatom oder durch eine Imino- oder Alkyliminogruppe ersetzt ist, substituiert sein kann,

eine durch ein Chloratom oder ein bis drei Fluoratome substituierte C_{2-4}-Alkylgruppe,

eine durch eine 1,4,7,10-Tetraoxacyclododecyl-, 1,4,7,10,13-Pentaoxacyclopentadecyl- oder eine 1,4,7,10,13,16-Hexaoxacyclooctadecylgruppe substituierte Methylgruppe,

eine durch 2 bis 5 Hydroxygruppen substituierte C_{3-10}-Alkylgruppe,

eine durch eine Hydroxy- und zusätzlich durch eine Arylgruppe substituierte C_{2-6}-Alkylgruppe, die gegebenenfalls zusätzlich durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert sein kann,

* C L M S *

eine durch eine Hydroxy- und zusätzlich durch eine Amino-, Alkylamino- oder Dialkylaminogruppe substituierte C_{3-6}-Alkylgruppe,

eine gegebenenfalls durch eine Arylgruppe substituierte Alkenyl- oder Alkinylgruppe mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, wobei der Vinyl- oder Ethinylteil nicht mit dem Stickstoffatom verknüpft sein kann,

eine C_{2-4}-Alkylgruppe, die durch eine C_{2-4}-Alkoxygruppe substituiert ist, welche in ω-Position durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert ist,

eine Arylgruppe,

eine Cyclopropylgruppe, die durch 1 oder 2 Alkylgruppen, durch eine Aryl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Piperazinocarbonyl- oder 4-Alkyl-piperazinocarbonylgruppe substituiert sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte C_{4-7}-Cycloalkylgruppe, die zusätzlich durch R_5 substituiert sein kann, wobei R_5 wie eingangs definiert ist,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, die zusätzlich durch eine N,N-Dialkyl-N-oxido-aminogruppe substituiert ist,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkenylgruppe, wobei der Vinylteil nicht mit dem Stickstoffatom der $(R_{11}NR_{10})$-Grupppe verknüpft sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, wobei in dem Cycloalkylteil jeweils eine Methylengruppe durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch

eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, N-Alkyl-N-oxido-imino- oder R_9N-Gruppe ersetzt ist, wobei R_9 wie eingangs definiert ist,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, in denen jeweils eine Methylengruppe durch eine Carbonylgruppe ersetzt ist,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte C_{4-7}-Cycloalkylmethylgruppe, die im Cycloalkylteil zusätzlich durch R_5 substituiert ist, wobei R_5 wie vorstehend erwähnt definiert ist,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte Cyclopentyl- oder Cyclopentylalkylgruppe, in denen jeweils zwei Wasserstoffatome im Cyclopentylteil durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 4 oder 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 3 oder 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 oder 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Kohlenstoffatom getrennt sind,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte Cyclohexyl-, Cyclohexylalkyl-, Cycloheptyl- oder Cycloheptylalkylgruppe, in denen jeweils zwei Wasserstoffatome im Cycloalkylteil durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 4 oder 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 3 oder 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 oder 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Kohlenstoffatom getrennt sind, oder 1 oder 2 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch zwei Kohlenstoffatome getrennt sind,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 4 Alkylgruppen substituierte 5-Norbornen-2-yl- oder 5-Norbornen-2-yl-alkylgruppe,

eine 3-Chinuclidinyl-, 4-Chinuclidinyl-, 3-Chinuclidinyl-alkyl-, 4-Chinuclidinyl-alkyl-, Azabicyclo[2.2.1]hept-4-yl-, Azabicyclo[2.2.1]hept-4-yl-alkyl- oder Adamantylgruppe, oder

R_{10} ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe und R_{11} eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe darstellen,

deren Tautomere, deren Stereoisomere und deren Salze,

wobei, sofern nichts anderes erwähnt wurde,

unter den bei der Definition der vorstehend erwähnten Reste erwähnten Arylteilen eine Phenylgruppe zu verstehen ist, die jeweils durch R_{12} monosubstituiert, durch R_{13} mono-, di- oder trisubstituiert oder durch R_{12} monosubstituiert und zusätzlich durch R_{13} mono- oder disubstituiert sein kann, wobei die Substituenten gleich oder verschieden sein können, und

R_{12} eine Cyano-, Carboxy-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Alkoxycarbonyl-, Alkylcarbonyl-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Alkylsulfonyloxy-, Perfluoralkyl-, Perfluoralkoxy-, Nitro-, Amino-, Alkylamino-, Hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, N-Alkyl-hydroxy-C_{2-4}-alkylamino-, Di(hydroxy-C_{2-4}-alkyl)amino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, Phenylalkylcarbonylamino-, Phenylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, Phenylalkylsulfonylamino-, Phenylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-phenylalkylcarbonylamino-, N-Alkyl-phenylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-phenylalkylsulfonylamino-, N-Alkyl-phenylsulfonylamino-, Aminosulfonyl-, Alkylaminosulfonyl- oder Dialkylaminosulfonylgruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 2 Alkylgruppen oder eine Hydroxyalkylgruppe substituierte 5- bis 7-gliedrige Alkylen-

iminogruppe, wobei in den vorstehend erwähnten 6- bis 7-gliedrigen Alkyleniminogruppen jeweils eine Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder eine R_9N-Gruppe ersetzt sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 2 Alkylgruppen oder eine Hydroxyalkylgruppe substituierte 5- bis 7-gliedrige Alkyleniminogruppe, wobei jeweils eine oder zwei zu dem Stickstoffatom benachbarte Methylengruppen durch jeweils eine Carbonylgruppe ersetzt sind,

eine (R_8NR_7)-CO-NR_6-Gruppe, wobei R_6 bis R_8 wie vorstehend erwähnt definiert sind,

R_{13} eine Alkyl-, Hydroxy- oder Alkoxygruppe, ein Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom darstellen, wobei zwei Reste R_{13} sofern diese an benachbarte Kohlenstoffatome gebunden sind, auch eine Alkylengruppe mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, eine 1,3-Butadien-1,4-diylengruppe oder eine Methylendioxygruppe darstellen können,

sowie, soweit nichts anderes erwähnt wurde, die vorstehend erwähnten Alkyl-, Alkylen- und Alkoxyteile jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten sowie, sofern nichts anderes erwähnt wurde, jedes Kohlenstoffatom in den vorstehend erwähnten Alkylen- oder Cycloalkylenteilen, das an ein Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom gebunden ist, an kein weiteres Halogen-, Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom gebunden sein kann.

4. Pyrimido[5,4-d]pyrimidine der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der

R_a ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe,

R_b eine durch die Reste R_1 bis R_3 substituierte Phenylgruppe, wobei

R_1 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom,

eine Alkyl-, Hydroxy-, Alkoxy-, C_{3-6}-Cycloalkyl- oder C_{5-6}-Cycloalkoxygruppe,

eine in 2-Stellung durch eine Hydroxy-, Alkoxy- oder Phenoxygruppe substituierte Ethoxygruppe,

eine C_{2-5}-Alkenyl- oder C_{3-5}-Alkenyloxygruppe, wobei der Vinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine C_{2-5}-Alkinyl- oder C_{3-5}-Alkinyloxygruppe, wobei der Ethinylteil nicht mit dem Sauerstoffatom verknüpft sein kann,

eine Phenyl-, Phenoxy-, Phenylalkyl-, Phenylalkoxy-, Alkoxyalkyl-, Phenoxyalkyl-, Carboxyalkyl-, Alkoxycarbonylalkyl-, Aminocarbonylalkyl-, Alkylaminocarbonylalkyl-, Dialkylaminocarbonylalkyl-, Cyanoalkyl-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Alkylsulfonyloxy-, Trifluormethylsulfenyl-, Trifluormethylsulfonyl-, Nitro-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Pyrrolidino-, Piperidino-, Morpholino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Trifluormethylsulfonylamino-, N-Alkyl-trifluormethylsulfonylamino-, Alkylcarbonyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl- oder Cyanogruppe,

eine durch 1 bis 3 Fluoratome substituierte Methyl- oder Methoxygruppe,

eine durch 1 bis 5 Fluoratome substituierte Ethyl- oder Ethoxygruppe,

R_2 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Alkyl-, Trifluormethyl-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcar-

bonylamino-, Alkylsulfonylamino-, Trifluormethylsulfonylamino-, Hydroxy- oder Alkoxygruppe,

R_3 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor- oder Bromatom oder eine Alkylgruppe, oder

R_2 zusammen mit R_3, sofern diese an benachbarte Kohlenstoffatome gebunden sind, auch eine Methylendioxy- oder n-C_{3-6}-Alkylengruppe oder eine gegebenenfalls durch ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, durch eine Alkyl-, Alkoxy- oder Trifluormethylgruppe substituierte 1,3-Butadien-1,4-diylengruppe darstellen, bedeuten, und

R_c ein Wasserstoff- oder Chloratom,

eine Alkyl-, Phenyl-, Mercapto-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl- oder Alkylsulfonylgruppe,

eine Hydroxy-, Phenoxy- oder Phenyl-C_{1-2}-alkoxygruppe,

eine Alkoxygruppe,

eine C_{2-4}-Alkoxygruppe, die durch eine Hydroxy-, Alkoxy-, (2-Hydroxyethyl)amino-, Dialkylamino-, Morpholino-, 1-Pyrrolidinyl-, 1-Piperidinyl-, 4-Methyl-1-piperazinyl-, 4-Acetyl-1-piperazinyl-, 4-Methylsulfonyl-1-piperazinyl-, 4-Methoxycarbonyl-1-piperazinyl-, 4-Formyl-1-piperazinyl- oder 4-Dimethylaminocarbonyl-1-piperazinylgruppe substituiert ist,

eine C_{3-4}-Alkoxygruppe, die durch zwei Hydroxygruppen substituiert ist,

eine C_{1-2}-Alkoxygruppe, die durch eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Methylgruppen substituierte C_{3-7}-Cycloalkylgruppe substituiert ist, wobei in den vorstehend erwähnten C_{4-6}-Cycloalkylgruppen jeweils eine Methylengruppe durch ein Sauerstoffatom ersetzt sein kann,

eine gegebenenfalls durch eine Hydroxy-, Dialkylamino-, Alkoxy-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino- oder Alkoxycarbonylaminogruppe substituierte C_{4-6}-Cycloalkoxygruppe,

eine Cyclopentyloxygruppe, in der die Methylengruppe in 3-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder durch eine Alkyliminogruppe ersetzt ist,

eine Cyclohexyloxygruppe, in der die Methylengruppe in 3- oder 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder durch eine Alkylimino-, Alkylcarbonyl-imino-, Alkoxycarbonyl-imino- oder Alkylsulfonyl-iminogruppe ersetzt ist,

eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Methylgruppen substituierte Allyloxy- oder Propargyloxygruppe,

eine 1-Azetidinylgruppe,

eine 1-Pyrrolidinylgruppe, die durch 1 bis 2 Alkylgruppen, durch eine Phenyl-, Carboxy-, Hydroxyalkyl-, Aminoalkyl-, Alkylaminoalkyl-, Dialkylaminoalkyl-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Piperazinocarbonyl- oder 4-Alkyl-piperazinocarbonyl-Gruppe oder in 3-Stellung auch durch eine Hydroxy-, Alkoxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, Alkoxycarbonylamino-, Formylamino-, Cyanamino-, Alkylsulfonylamino-, Dialkylaminocarbonylamino-, N-Alkyl-dialkylaminocarbonylamino-, N-Alkyl-dialkylaminocarbonylamino- oder Cyanogruppe substituiert sein kann,

eine 1-Pyrrolidinylgruppe, in der zwei Wasserstoffatome am Kohlenstoffgerüst durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 4 oder 5 Kohlenstoffatome enthält,

wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 3 oder 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 oder 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Atom getrennt sind,

eine 1-Piperidinylgruppe, die durch 1 bis 4 Alkylgruppen, durch eine Phenyl-, Hydroxyalkyl-, Aminoalkyl-, Alkylaminoalkyl-, Dialkylaminoalkyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Piperazinocarbonyl- oder 4-Alkyl-piperazinocarbonyl-Gruppe oder in 3- oder 4-Stellung auch durch eine Hydroxy-, Alkoxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, Alkoxycarbonylamino-, Formylamino-, Cyanamino-, Alkylsulfonylamino-, Dialkylaminocarbonylamino-, N-Alkyl-dialkylaminocarbonylamino- oder Cyanogruppe substituiert sein kann,

eine 1-Piperidinylgruppe, die durch 1 bis 2 Alkylgruppen oder eine Phenylgruppe und zusätzlich durch eine Hydroxygruppe substituiert ist,

eine 1-Piperidinylgruppe, in der in 3-Stellung oder in 4-Stellung zwei Wasserstoffatome durch eine $-O-CH_2CH_2-O-$ oder $-O-CH_2CH_2CH_2-O-$Gruppe ersetzt sind,

eine 1-Piperidinylgruppe, in der zwei Wasserstoffatome am Kohlenstoffgerüst durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 4 oder 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 3 oder 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 oder 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch ein Atom getrennt sind, oder 1 oder 2 Kohlenstoffatome enthält,

wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch zwei Atome getrennt sind,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte 1-Piperidinylgruppe, in der die Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, Alkyl-imino-, Hydroxy-C_{2-4}-alkyl-imino-, Alkoxy-C_{2-4}-alkyl-imino-, Aminocarbonylalkyl-imino-, Alkylaminocarbonylalkyl-imino-, Dialkylaminocarbonylalkyl-imino-, Amino-C_{2-4}-alkyl-imino-, Alkylamino-C_{2-4}-alkyl-imino-, Dialkylamino-C_{2-4}-alkyl-imino-, Hydroxy-C_{2-4}-alkoxy-C_{2-4}-alkyl-imino-, Phenyl-imino-, Phenylalkyl-imino-, Alkylcarbonyl-imino-, Alkylsulfonyl-imino-, Phenylcarbonyl-imino-, Phenylsulfonyl-imino- oder N-Oxido-N-alkyl-imino-Gruppe ersetzt ist,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte 1-Azacyclohept-1-yl-Gruppe, in der jeweils die Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom, durch eine Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Phenyl-imino-, N-Phenylalkyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino-, N-Phenylcarbonyl-imino- oder N-Phenylsulfonyl-imino-Gruppe ersetzt sein kann oder zwei Wasserstoffatome in 3,6-Stellung durch eine $-CH_2CH_2$-Gruppe ersetzt sein können,

eine 2-Isoindolinyl-, 1,2,3,4-Tetrahydro-isochinolin-2-yl- oder 2,3,4,5-Tetrahydro-1H-3-benzazepin-3-yl-Gruppe, die jeweils im Benzoteil durch ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, durch eine Alkyl-, Trifluormethyl- oder Alkoxygruppe substituiert sein können, oder

eine ($R_{10}NR_{11}$)-Gruppe darstellen, in der

R_{10} ein Wasserstoffatom oder eine C_{1-6}-Alkylgruppe, die ab Position 2 durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert sein kann, und

R_{11} ein Wasserstoffatom,

eine C_{1-8}-Alkylgruppe, die durch eine Phenyl-, C_{3-6}-Cycloalkyl-, Hydroxy-, Alkoxy-, Cyano-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, (2-Hydroxyethyl)aminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, 1-Piperazinylcarbonyl-, 4-Alkyl-1-piperazinylcarbonyl-, Amino-, Formylamino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkoxycarbonylamino-, N-Alkyl-alkoxycarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Phenylcarbonylamino-, N-Alkyl-phenylcarbonylamino-, Phenylsulfonylamino-, N-Alkyl-phenylsulfonylamino-, Alkylsulfenyl-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, 1-Pyrrolidinyl-, 2-Oxo-1-pyrrolidinyl-, 1-Piperidinyl-, 2-Oxo-1-piperidinyl-, Morpholino-, 1-Piperazinyl-, 4-Alkyl-1-piperazinyl-, 4-Alkylcarbonyl-1-piperazinyl-, 4-Alkylsulfonyl-1-piperazinyl-, 4-Alkoxycarbonyl-1-piperazinyl-, 4-Cyano-1-piperazinyl-, 4-Formyl-1-piperazinyl-, 4-Aminocarbonyl-1-piperazinyl-, 4-Alkylaminocarbonyl-1-piperazinyl- oder 4-Dialkylaminocarbonyl-1-piperazinyl- oder eine (R_8NR_7)-CO-NR_6-Gruppe substituiert sein kann, wobei

R_6 und R_7 zusammen eine n-C_{2-3}-Alkylenbrücke und
R_8 ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe darstellen,

eine durch eine 1,4,7,10-Tetraoxacyclododecyl-, 1,4,7,10,13-Pentaoxacyclopentadecyl- oder eine 1,4,7,10,13,16-Hexaoxacyclooctadecylgruppe substituierte Methylgruppe,

eine 2,2,2-Trifluorethylgruppe,

eine durch 2 bis 5 Hydroxygruppen substituierte C_{3-10}-Alkylgruppe,

eine durch eine Hydroxy- und zusätzlich durch eine Aminogruppe substituierte C_{3-5}-Alkylgruppe,

* C L M S *

eine durch eine Phenylgruppe und zusätzlich durch eine Hydroxygruppe substituierte C_{2-4}-Alkylgruppe, die gegebenenfalls zusätzlich durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert sein kann,

eine gegebenenfalls durch eine Phenylgruppe substituierte Alkenyl- oder Alkinylgruppe mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, wobei der Vinyl- oder Ethinylteil nicht mit dem Stickstoffatom verknüpft sein kann,

eine C_{2-4}-Alkylgruppe, die durch eine C_{2-4}-Alkoxygruppe substituiert ist, welche in ω-Position durch eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe substituiert ist,

eine Phenylgruppe,

eine Phenylgruppe, die durch eine Alkylcarbonylamino-, N-Alkylalkylcarbonylamino-, (2-Hydroxyethyl)amino-, Di-(2-hydroxyethyl)amino-, N-Alkyl-2-(hydroxyethyl)amino-, Amino-, Alkylamino- oder Dialkylaminogruppe oder durch eine (R_8NR_7)-CO-NR_6-Gruppe substituiert ist, wobei R_6 bis R_8 wie vorstehend erwähnt definiert sind,

eine Phenylgruppe, die durch eine Pyrrolidino-, Piperidino-, 2-Oxo-pyrrolidino-, 2-Oxo-piperidino-, Morpholino-, 1-Piperazinyl- oder 4-Alkyl-1-piperazinyl-Gruppe substituiert ist, wobei die vorstehend erwähnten heterocyclischen Teile am Kohlenstoffgerüst jeweils durch 1 oder 2 Alkylgruppen oder durch eine Hydroxyalkylgruppe substituiert sein können,

eine C_{3-7}-Cycloalkylgruppe, die durch 1 oder 2 Alkylgruppen, durch eine Phenyl-, Carboxy-, Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Piperazinocarbonyl- oder 4-Alkyl-piperazinocarbonylgruppe substituiert sein kann,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, die durch eine Hydroxymethyl-, Cyano-, Hydroxy-, Alkoxy-, Amino-, Alkylamino-, Dialkylamino-, 2-Hydroxyethylamino-, Di-(2-hydroxyethyl)amino-, N-Alkyl-2-hydroxyethylamino-, N,N-Dialkyl-N-oxido-amino-, Alkoxycarbonylamino-, N-Alkyl-alkoxycarbonylamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkyl-alkylcarbonylamino-, Alkylsulfonylamino-, N-Alkyl-alkylsulfonylamino-, Phenylcarbonylamino-, N-Alkyl-phenylcarbonyl-amino-, Phenylsulfonylamino-, N-Alkylphenylsulfonylamino- oder durch eine (R_8NR_7)-CO-NR_6-Gruppe substituiert ist, wobei R_6 bis R_8 wie vorstehend erwähnt definiert sind,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkylgruppe, die durch eine Pyrrolidino-, Piperidino-, 2-Oxo-pyrrolidino-, 2-Oxo-piperidino-, Morpholino-, 1-Piperazinyl-, 4-Alkyl-1-piperazinyl- oder 4-Alkylcarbonyl-1-piperazinyl-Gruppe substituiert ist, wobei die vorstehend erwähnten heterocyclischen Teile am Kohlenstoffgerüst jeweils durch 1 oder 2 Alkylgruppen oder durch eine Hydroxymethylgruppe substituiert sein können,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Alkylgruppen substituierte C_{5-7}-Cycloalkenylgruppe, wobei der Vinylteil nicht an das Stickstoffatom der $(R_{11}NR_{10})$-Gruppe gebunden sein kann,

eine Tetrahydrofurfurylgruppe,

eine Cyclopentylgruppe, in der die Methylengruppe in 3-Stellung durch ein Sauerstoffatom, eine Imino-, Alkylimino-, Alkylcarbonylimino-, Formylimino-, Aminocarbonylimino-, Alkylaminocarbonylimino-, Alkoxycarbonylimino-, Alkylsulfonylimino-, Dialkylaminocarbonylimino- oder Cyaniminogruppe ersetzt ist,

eine Cyclohexylgruppe, in der die Methylengruppe in 3-Stellung durch eine Imino-, Alkyl-imino-, Alkylcarbonyl-imino-, Alkoxycarbonyl-imino- oder Alkylsulfonyl-imino-Gruppe ersetzt ist,

eine Cyclohexylgruppe, in der die Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom, eine Imino-, N-Alkyl-imino-, N-Phenyl-imino-, N-Phenylalkyl-imino-, N-Formyl-imino-, N-Alkylcarbonyl-imino-, N-Phenylcarbonyl-imino-, N-Alkoxycarbonyl-imino-, N-Cyan-imino-, N-Aminocarbonyl-imino-, N-Alkylaminocarbonyl-imino-, N,N-Dialkylaminocarbonyl-imino-, N-Alkyl-N-oxido-imino-, N-Alkylsulfonyl-imino- oder N-Phenylsulfonyl-imino-Gruppe ersetzt ist,

eine Cyclohexylgruppe, in der eine Methylengruppe durch eine Carbonylgruppe ersetzt ist,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 2 Methylgruppen substituierte Cyclopentyl- oder Cyclohexylgruppe, die durch eine Carboxyalkoxy-, Alkoxycarbonylalkoxy-, Aminocarbonylalkoxy-, Alkylaminocarbonylalkoxy-, Dialkylaminocarbonylalkoxy-, Pyrrolidinocarbonylalkoxy-, Piperidinocarbonylalkoxy-, Morpholinocarbonylalkoxy-, Carboxyalkyl-, Alkoxycarbonylalkyl-, Aminocarbonylalkyl-, Alkylaminocarbonylalkyl-, Dialkylaminocarbonylalkyl-, Pyrrolidinocarbonylalkyl-, Piperidinocarbonylalkyl- oder Morpholinocarbonylalkylgruppe substituiert ist,

eine Cyclohexylmethylgruppe, wobei der Cyclohexylteil durch eine Carboxy-, Aminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Alkoxycarbonyl- oder Hydroxymethylgruppe substituiert ist,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 3 Methylgruppen substituierte Cyclohexyl- oder Cyclohexylmethylgruppe, in denen jeweils im Cyclohexylteil zwei Wasserstoffatome durch eine geradkettige Alkylenbrücke ersetzt sind, wobei diese Brücke 4 oder 5 Kohlenstoffatome enthält, wenn die zwei Wasserstoffatome sich am selben Kohlenstoffatom befinden, oder 3 oder 4 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an benachbarten Kohlenstoffatomen befinden, oder 2 oder 3 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlen-

stoffatomen befinden, die durch ein Kohlenstoffatom getrennt sind, oder 1 oder 2 Kohlenstoffatome enthält, wenn sich die zwei Wasserstoffatome an Kohlenstoffatomen befinden, die durch zwei Kohlenstoffatome getrennt sind,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 3 Methylgruppen substituierte 5-Norbornen-2-yl- oder 5-Norbornen-2-yl-methylgruppe,

eine 3-Chinuclidinyl-, 4-Chinuclidinyl- oder Adamantylgruppe bedeuten, oder

R_{10} ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe und R_{11} eine Hydroxy- oder Alkoxygruppe bedeuten,

deren Tautomere, deren Stereoisomere und deren Salze,

wobei die vorstehend erwähnten Phenylreste jeweils durch ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, durch eine Nitro-, Alkyl-, Alkoxy-, Trifluormethyl- oder Hydroxygruppe substituiert sein können und, sofern nichts anderes erwähnt wurde, die vorstehend erwähnten Alkyl-, Alkylen- und Alkoxyteile jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten sowie, sofern nichts anderes erwähnt wurde, jedes Kohlenstoffatom in den vorstehend erwähnten Alkylen- oder Cycloalkylenteilen, das an ein Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom gebunden ist, an kein weiteres Halogen-, Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom gebunden sein kann.

5. Pyrimido[5,4-d]pyrimidine der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der

R_a ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe,

R_b eine 2-Naphthyl-, 1,2,3,4-Tetrahydro-6-naphthyl- oder 5-Indanylgruppe oder eine durch die Reste R_1 bis R_3 substituierte Phenylgruppe, wobei

R_1 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom,

eine C_{1-4}-Alkyl-, C_{1-4}-Alkoxy-, C_{3-6}-Cycloalkyl-, C_{5-6}-Cycloalkoxy-, Cyano-, Methoxycarbonyl-, Ethoxycarbonyl-, Ethinyl- oder Nitrogruppe,

eine durch 1 bis 3 Fluoratome substituierte Methyl- oder Methoxygruppe,

eine durch 1 bis 5 Fluoratome substituierte Ethyl- oder Ethoxygruppe,

R_2 ein Wasserstoff-, Fluor- oder Chloratom, eine Methyl-, Hydroxy-, Methoxy-, Amino-, C_{1-2}-Alkylamino-, Di-C_{1-2}-alkylamino-, C_{1-2}-Alkylcarbonylamino-, C_{1-2}-Alkylsulfonylamino-, Trifluormethylsulfonylamino- oder Trifluormethylgruppe,

R_3 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor- oder Bromatom oder eine Methylgruppe und

R_c ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, Phenyl-, 4-Methoxyphenyl-, Methylsulfenyl-, Methylsulfinyl- oder Methylsulfonylgruppe,

eine Hydroxygruppe,

eine C_{1-4}-Alkoxygruppe,

eine Ethoxygruppe, die in 2-Stellung durch eine Hydroxy-, Methoxy-, Morpholino- oder (2-Hydroxyethyl)aminogruppe substituiert ist,

eine 2-Propyloxygruppe, die in 1-Stellung durch eine Methoxy- oder Dimethylaminogruppe substituiert ist,

eine Methoxygruppe, die durch eine 2-Tetrahydrofuryl-, 2-Tetrahydropyranyl- oder 3-Methyl-3-oxetanylgruppe substituiert ist,

eine Cyclobutyloxygruppe,

eine gegebenenfalls in 3-Stellung durch eine Hydroxygruppe substituierte Cyclopentyloxygruppe,

eine Cyclopentyloxygruppe, in der die Methylengruppe in 3-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder durch eine Methyl-iminogruppe ersetzt ist,

eine Cyclohexyloxygruppe, die in 2-,3- oder 4-Stellung durch eine Hydroxygruppe oder in 4-Stellung auch durch eine Di-(C_{1-2}-alkyl)amino-, Methoxy-, Carboxy-, Methoxycarbonyl-, Dimethylaminocarbonyl-, Methylaminocarbonyl-, Aminocarbonyl-, Acetylamino-, Methylsulfonylamino-, Methoxycarbonylamino-oder tert.Butyloxycarbonylaminogruppe substituiert sein kann,

eine Cyclohexyloxygruppe, in der die Methylengruppe in 3-Stellung durch eine Methyl-iminogruppe oder die Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder durch eine Methyl-imino-, Acetyl-imino-, tert.Butyloxycarbonyl-imino-, Methoxycarbonyl-imino- oder Methylsulfonyl-iminogruppe ersetzt ist,

eine Allyloxygruppe,

eine 1-Azetidinylgruppe,

eine 1-Pyrrolidinylgruppe, die durch 1 oder 2 Methylgruppen, durch eine Carboxy-, Methoxycarbonyl-, Ethoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl- oder Di-(C_{1-2})-alkylaminocarbonylgruppe oder in 3-Stellung durch eine Amino-, C_{1-2}-Alkylamino-, Di-(C_{1-2}-alkyl)amino-, C_{1-2}-Alkoxycarbonylamino-, C_{1-2}-Alkylcarbonylamino-, C_{1-2}-Alkylsulfonylamino-, Cyanamino-, Formylamino- oder Dimethylaminocarbonylaminogruppe substituiert sein kann,

eine 1-Pyrrolidinylgruppe, in der in 3-Stellung zwei Wasserstoffatome durch eine n-C_{4-5}-Alkylenbrücke ersetzt sind,

eine 1-Piperidinylgruppe, die durch 1 bis 4 Methylgruppen, durch eine Phenyl-, Hydroxy-C_{1-2}-alkyl-, Carboxy-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-, Di-(C_{1-2})-alkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl- oder Morpholinocarbonylgruppe oder in 3- oder 4-Stellung durch eine Hydroxy-, C_{1-2}-Alkoxy-, Amino-, C_{1-2}-Alkylamino-, Di-(C_{1-2})-Alkylamino-, C_{1-2}-Alkylcarbonylamino-, C_{1-2}-Alkoxycarbonylamino-, Formylamino-, Cyanamino-, Di-(C_{1-2}-alkyl)aminocarbonylamino-, C_{1-2}-Alkylsulfonylamino- oder Cyanogruppe substituiert sein kann,

eine 1-Piperidinylgruppe, in der in 3-Stellung oder in 4-Stellung zwei Wasserstoffatome durch eine n-C_{4-5}-Alkylenbrücke oder durch eine -O-CH_2CH_2-O-Brücke ersetzt sind,

eine 1-Piperidinylgruppe, die durch 1 oder 2 Methylgruppen oder eine Phenylgruppe und zusätzlich in 3- oder 4-Stellung durch eine Hydroxygruppe substituiert ist,

eine 1-Piperidinylgruppe, in der in 2,5-Stellung zwei Wasserstoffatome durch eine -CH_2- oder -CH_2CH_2-Brücke ersetzt sind,

eine gegebenenfalls durch 1 bis 2 Methylgruppen substituierte 1-Piperidinylgruppe, in der die Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, C_{1-2}-Alkyl-imino-, (2-Hydroxyethyl)-imino-, 2-(2-Hydroxyethoxy)ethyl-imino-, (2-Aminoethyl)-imino-, C_{1-3}-Alkylaminocarbonylmethyl-imino-, N-Oxido-N-C_{1-2}-alkylimino-, Phenyl-imino-, Benzyl-imino-, Acetyl-imino- oder Methansulfonyl-iminogruppe ersetzt ist,

eine 1-Azacyclohept-1-yl-Gruppe, in der zwei Wasserstoffatome in 3,6-Stellung durch eine -CH_2CH_2-Gruppe ersetzt sein können,

eine 1,2,3,4-Tetrahydro-isochinolin-2-yl- oder 2,3,4,5-Tetrahydro-1H-3-benzazepin-3-yl-Gruppe oder

eine ($R_{10}NR_{11}$)-Gruppe darstellen, in der

R_{10} ein Wasserstoffatom, eine C_{1-4}-Alkylgruppe oder eine 2-Hydroxyethylgruppe und

R_{11} ein Wasserstoffatom,

eine C_{1-6}-Alkyl-, C_{3-6}-Cycloalkyl-methyl- oder Phenyl-C_{1-3}-alkylgruppe,

eine gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methylgruppen substituierte C_{3-6}-Cycloalkyl-, Allyl- oder Propargylgruppe,

eine Phenylgruppe, die durch eine Hydroxy- oder Methylgruppe oder in 4-Stellung durch eine N-C_{1-2}-Alkyl-C_{1-2}-alkylcarbonylamino-, N-C_{1-2}-Alkyl-(2-hydroxyethyl)amino-, Di-(2-hydroxyethyl)amino-, 1-Pyrrolidinyl-, 2-Oxo-1-pyrrolidinyl-, 2-Hydroxymethyl-1-pyrrolidinyl-, 2-Oxo-1-imidazolidinyl-, 3-Methyl-2-oxo-1-imidazolidinyl- oder Morpholinogruppe substituiert sein kann,

eine durch eine Carboxy-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-, Di-C_{1-2}-alkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Piperidinocarbonyl- oder Morpholinocarbonylgruppe substituierte Methylgruppe,

eine gegebenenfalls durch eine Methylgruppe substituierte Ethylgruppe, die in 2-Stellung durch eine Hydroxy-, C_{1-2}-Alkoxy-, Amino-, C_{1-2}-Alkylamino-, Di-C_{1-2}-alkylamino-, Acetylamino-, 1-Pyrrolidinyl-, Morpholino-, 1-Piperazinyl-, 4-Methyl-1-piperazinyl-, 4-Acetyl-1-piperazinyl-, 4-Aminocarbonyl-1-piperazinyl-, 4-Dimethylaminocarbonyl-1-piperazinyl-, 4-Methylaminocarbonyl-1-piperazinyl-, 4-Methylsulfonyl-1-pipera-

zinyl-, 4-Methoxycarbonyl-1-piperazinyl-oder 4-Cyano-1-piperazinylgruppe substituiert ist,

eine 2-Hydroxyethylgruppe, die im Ethylteil durch eine Phenyl-, 3-Hydroxyphenyl-, 4-Hydroxyphenyl-, 4-Nitrophenyl- oder Benzylgruppe substituiert ist, wobei der Ethylteil der vorstehend erwähnten Gruppen zusätzlich durch eine Methyl-, Hydroxymethyl- oder Methoxymethylgruppe substituiert sein kann,

eine durch eine 1,4,7,10-Tetraoxacyclododecyl-, 1,4,7,10,13-Pentaoxacyclopentadecyl- oder eine 1,4,7,10,13,16-Hexaoxacyclooctadecylgruppe substituierte Methylgruppe,

eine 2,2,2-Trifluorethylgruppe,

eine in 3-Stellung durch eine Hydroxy-, Cyano-, Carboxy-, Aminocarbonyl-, Methylaminocarbonyl-, Dimethylaminocarbonyl-, Formylamino, Methoxycarbonylamino-, Morpholino- oder 2-Oxo-1-pyrrolidinylgruppe substituierte Propylgruppe,

eine in 4-Stellung durch eine Hydroxygruppe substituierte Butylgruppe,

eine in 1-Stellung durch eine Hydroxygruppe und zusätzlich in 3-Stellung durch eine Methylgruppe substituierte 3-Butylgruppe,

eine in 1-Stellung durch eine Hydroxygruppe und zusätzlich in 3-Stellung durch eine Methylgruppe substituierte 2-Butylgruppe,

eine in 1-Stellung durch eine Hydroxygruppe und zusätzlich in 4-Stellung durch eine Methylgruppe substituierte 4-Pentylgruppe,

eine 2,3-Dihydroxypropyl-, 3-Amino-2-hydroxy-propyl-, Tris-(3-hydroxypropyl)methyl-, 1,3-Dihydroxy-2-propyl-, 1,3-Dihydroxy-2-methyl-2-propyl- oder Tris-(hydroxymethyl)methylgruppe,

eine 2-Propylgruppe, die in 2-Stellung durch eine Hydroxymethyl-, C_{1-2}-Alkoxymethyl-, Carboxy-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, N-C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-, N,N-Di-C_{1-2}-alkylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl- oder (2-Hydroxyethyl)aminocarbonylgruppe substituiert ist,

eine 4-Tetrahydropyranyl-, Tetrahydrofurfuryl-, 1-Desoxy-1-D-sorbityl- oder 2-(2-Hydroxyethyloxy)ethylgruppe,

eine in 2- oder 3-Stellung durch eine Hydroxygruppe oder in 1-Stellung durch eine Hydroxymethylgruppe substituierte Cyclopentylgruppe,

eine in 2-, 3- oder 4-Stellung durch eine Hydroxymethyl-, Hydroxy-, C_{1-2}-Alkoxy-, (C_{1-4}-Alkoxy)carbonylamino-, Amino-, C_{1-2}-Alkylamino-, Di-C_{1-2}-alkylamino-, Carboxy-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-, Di-C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-, N-Oxido-di-C_{1-2}-alkylamino-, Pyrrolidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, C_{1-2}-Alkylcarbonylamino- oder C_{1-2}-Alkylsulfonylaminogruppe substituierte Cyclohexylgruppe, die zusätzlich durch eine Methylgruppe substituiert sein kann,

eine Cyclohexylgruppe, die in 4-Stellung durch eine 1-Pyrrolidinyl-, 2-Oxo-1-pyrrolidinyl-, 2-Hydroxymethyl-1-pyrrolidinyl-, N-C_{1-2}-Alkyl-(2-hydroxyethyl)amino-, Di-(2-hydroxyethyl)amino-, N-C_{1-2}-Alkyl-C_{1-2}-alkylcarbonylamino-, Morpholino-, 2-Oxo-1-imidazolidinyl-, 3-Methyl-2-oxo-1-imidazolidinyl-, Carboxy-C_{1-2}-alkyl-, Carboxy-C_{1-2}-alkoxy-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-C_{1-2}-alkyl-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-C_{1-2}-alkoxy-, Aminocarbonyl-C_{1-2}-alkyl-, Aminocarbonyl-C_{1-2}-alkoxy-, C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-C_{1-2}-alkyl-, C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-C_{1-2}-alkoxy-, Di-C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-C_{1-2}-alkyl-, Di-C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-C_{1-2}-alkoxy-, Pyrrolidinocarbonyl-C_{1-2}-alkyl-, Pyrrolidinocarbonyl-C_{1-2}-alkoxy-, Morpholinocarbonyl-C_{1-2}-alkyl-, Morpholinocarbonyl-C_{1-2}-alkoxy-, Piperidinocarbonyl-C_{1-2}-alkyl- oder Piperidinocarbonyl-C_{1-2}-alkoxygruppe substituiert ist,

eine Cyclohexylgruppe, in der zwei Wasserstoffatome in 4-Stellung durch eine Oxo-Gruppe oder eine n-C_{4-5}-Alkylenbrücke ersetzt sind,

eine Cyclohexylgruppe, in der die Methylengruppe in 4-Stellung durch eine Imino-, C_{1-2}-Alkyl-imino-, Phenyl-C_{1-2}-alkyl-imino-, N-Methyl-N-oxido-imino-, Formyl-imino-, C_{1-2}-Alkylcarbonyl-imino-, C_{1-2}-Alkylsulfonyl-imino-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-imino-, Cyan-imino-, Aminocarbonyl-imino-, C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl-imino- oder N,N-Di-C_{1-2}-alkylaminocarbonyliminogruppe ersetzt ist,

eine Cyclohexylgruppe, in der die Methylengruppe in 3-Stellung durch eine Imino-, C_{1-2}-Alkyl-imino-, C_{1-2}-Alkylcarbonyl-imino-, C_{1-2}-Alkylsulfonyl-imino- oder C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-iminogruppe ersetzt ist,

eine Cyclopentylgruppe, in der die Methylengruppe in 3-Stellung durch ein Sauerstoffatom oder eine Imino-, C_{1-2}-Alkyl-imino-, Formyl-imino-, C_{1-2}-Alkylcarbonyl-imino-, C_{1-2}-Alkylsulfonyl-imino-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-imino-, Cyan-imino- oder N,N-Di-C_{1-2}-alkylaminocarbonyliminogruppe ersetzt ist,

eine Cyclohexylmethylgruppe, wobei der Cyclohexylteil in 4-Stellung durch eine Carboxy-, C_{1-2}-Alkoxycarbonyl-, N,N-Di-C_{1-2}-Alkylaminocarbonyl- oder Morpholinocarbonylgruppe substituiert ist,

eine Norbornan-2-yl-, Norbornan-2-yl-methyl-, 5-Norbornen-2-yl-methyl-, Bornyl-, 3-Chinuclidinyl- oder Adamantylgruppe oder

R_{10} ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe und R_{11} eine Hydroxy- oder Methoxygruppe bedeuten,

deren Tautomere, deren Stereoisomere und deren Salze.

6. Pyrimido[5,4-d]pyrimidine der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der

R_a ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe,

R_b eine 2-Naphthyl- oder 5-Indanylgruppe oder eine durch die Reste R_1 bis R_3 substituierte Phenylgruppe, wobei

R_1 ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatom, eine Methyl-, Ethyl-, tert.Butyl-, Trifluormethyl-, Ethinyl-, Methoxy-, Cyclopropyl-, Trifluormethoxy-, Cyano-, Ethoxycarbonyl- oder Nitrogruppe,

R_2 ein Wasserstoff-, Fluor- oder Chloratom, eine Amino-, Methyl- oder Trifluormethylgruppe und

R_3 ein Wasserstoff-, Chlor- oder Bromatom darstellen, und

R_c ein Wasserstoffatom, eine Hydroxy-, Methoxy-, Butyloxy-, Cyclopentyloxy-, 2-[(2-Hydroxyethyl)amino]-ethoxy-, Methylsulfenyl-, Methylsulfinyl- oder Methylsulfonylgruppe,

eine 1-Azetidinyl- oder eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Methylgruppen substituierte 1-Pyrrolidinylgruppe,

eine durch eine Hydroxymethylgruppe substituierte 1-Piperidinylgruppe,

eine gegebenenfalls durch eine oder zwei Methylgruppen substituierte 1-Piperidinylgruppe, in der die Methylengruppe in 4-Stellung durch ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, durch eine Carbonyl-, Sulfinyl-, Sulfonyl-, Imino-, Methyl-imino-, N-Oxido-N-methyl-imino-, 2-Propylaminocarbonyl-methyl-imino-, Phenyl-imino-, Benzyl-imino-, Acetyl-imino- oder Methylsulfonyl-iminogruppe ersetzt sein kann,

* C L M S *

eine in 3-Stellung durch eine Hydroxy- oder Diethylaminocarbonylgruppe oder in 4-Stellung durch eine Hydroxy-, Carboxy-, Methoxycarbonyl-, Aminocarbonyl-, Methylaminocarbonyl-, Dimethylaminocarbonyl-, Pyrrolidinocarbonyl-, Morpholinocarbonyl-, Amino-, Acetylamino-, Methoxycarbonylamino-, Formylamino-, Cyanamino-, Dimethylaminocarbonylamino-, Methylsulfonylamino- oder Phenylgruppe substituierte 1-Piperidinylgruppe,

eine 4-Hydroxy-4-phenyl-1-piperidinylgruppe,

eine 1,2,3,4-Tetrahydro-isochinolin-2-yl- oder 2,3,4,5-Tetrahydro-1H-3-benzazepin-3-yl-Gruppe,

eine 1-Piperidinylgruppe, in der in 4-Stellung zwei Wasserstoffatome durch eine $-OCH_2CH_2-O-$Brücke ersetzt sind,

eine 1-Azacyclohept-1-yl-Gruppe, in der zwei Wasserstoffatome in 3- und 6-Stellung durch eine $-CH_2-CH_2-$Gruppe ersetzt sind, oder

eine $(R_{10}NR_{11})$-Gruppe darstellen, in der

R_{10} ein Wasserstoffatom, eine C_{1-4}-Alkylgruppe oder eine 2-Hydroxyethylgruppe und

R_{11} ein Wasserstoffatom,

eine gegebenenfalls durch eine Methylgruppe substituierte Phenylgruppe,

eine Phenylgruppe, die in 4-Stellung durch eine Morpholino- oder 2-(Hydroxymethyl)-1-pyrrolidinylgruppe substituiert ist,

eine C_{1-6}-Alkyl-, C_{3-6}-Cycloalkyl-, Phenyl-C_{1-3}-alkyl-, Cyclopropylmethyl-, Allyl-, Propargyl-, 2-Hydroxyethyl-, 1-Hydroxy-2-propyl-, 3-Hydroxypropyl-, 4-Hydroxybutyl-, 2-Methoxyethyl-, 1-Adamantyl-, Norbornan-2-yl-, Aminocarbonylmethyl-,

2-(Dimethylamino)ethyl-, 3-Chinuclidinyl-, 2,2,2-Trifluorethyl-, 4-Piperidinyl-, 1-Methyl-4-piperidinyl-, 1-Methyl-1-oxido-4-piperidinyl-, 1-Ethoxycarbonyl-4-piperidinyl-, 1-Benzyl-4-piperidinyl-, 2-(2-Hydroxyethoxy)ethyl-, 4-Tetrahydropyranyl-, 1-Hydroxy-2-methyl-2-propyl-, 1-Methoxy-2-methyl-2-propyl-, 2-(Methylaminocarbonyl)-2-propyl-, 2,3-Dihydroxy-1-propyl-, 2-(Morpholino)ethyl-, 1-Desoxy-1-D-sorbityl-, 3-(2-Oxo-1-pyrrolidinyl)-propyl-, Tris-(hydroxymethyl)methyl-, 1,3-Dihydroxy-2-propyl-, 1,3-Dihydroxy-2-methyl-2-propyl- oder Bornylgruppe,

eine 2-Hydroxyethylgruppe, die in 2-Stellung durch eine Phenylgruppe und in 1-Stellung zusätzlich durch eine Methyl- oder Hydroxymethylgruppe substituiert ist,

eine Methylcyclohexyl-, 4-Carboxy-cyclohexyl-, 4-Methoxycarbonyl-cyclohexyl-, 4-Dimethylaminocarbonyl-cyclohexyl-, 4-(1-Pyrrolidinylcarbonyl)-cyclohexyl-, 4-(Morpholinocarbonyl)-cyclohexyl-, 4-[2-(Methoxycarbonyl)ethyl]cyclohexyl-, 4-(2-Carboxy-ethyl)cyclohexyl-, 4-(tert.Butyloxycarbonylamino)-cyclohexyl-, 4-Methoxycyclohexyl-, 4-Aminocyclohexyl-, 4-(Dimethylamino)cyclohexyl-, 4-(N,N-Dimethyl-N-oxido-amino)cyclohexyl-, 4-(Acetylamino)-cyclohexyl-, 4-(Methylsulfonylamino)-cyclohexyl-, 2-Hydroxycyclohexyl-, 4-Hydroxycyclohexyl-, 4-(Hydroxymethyl)-cyclohexyl-, 4-Hydroxy-4-methyl-cyclohexyl- oder 4-Oxocyclohexylgruppe,

eine durch eine 1,4,7,10,13-Pentaoxacyclopentadecyl- oder eine 1,4,7,10,13,16-Hexaoxacyclooctadecylgruppe substituierte Methylgruppe, oder

R_{10} eine Methylgruppe und R_{11} eine Methoxygruppe darstellen, bedeuten,

deren Tautomere, deren Stereoisomere und deren Salze.

7. Folgende Verbindungen der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2:

(1) 4-[(3,4-Dichlorphenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(2) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(3) 4-[(3-Bromphenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(4) 4-[(3-Chlorphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin,

(5) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-amino-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(6) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(trans-4-aminocyclohexyl)-amino]pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(7) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(N-(trans-4-hydroxycyclohexyl)-N-methyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(8) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-methoxycarbonylamino-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(9) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[trans-4-(morpholinocarbonyl)-cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(10) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[trans-4-(pyrrolidinocarbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(11) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[N-(trans-4-hydroxycyclohexyl)-N-methyl-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(12) 4-[(4-Amino-3,5-dichlor-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxycyclohexyl)-amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(13) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[2-(morpholino)-ethylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(14) 4-[(4-Amino-3,5-dibrom-phenyl)amino]-6-[(trans-4-hydroxy-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(15) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-morpholino-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin,

(16) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-methyl-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(17) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(1-hydroxy-2-propyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(18) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(1,3-dihydroxy-2-propylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(19) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[4-amino-1-piperidin-yl]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(20) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(21) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-(4-formylamino-1-piperidinyl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(22) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(1-ethoxycarbonyl-4-piperi-dinyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(23) 4-[(3-Methylphenyl)amino]-6-[(3-chinuclidinyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(24) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[(4-amino-cyclohexyl)amino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(25) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(4-piperidinyl-amino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(26) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(morpholino-carbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(27) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-[trans-4-(pyrroli-dinocarbonyl)cyclohexylamino]-pyrimido[5,4-d]pyrimidin,

(28) 4-[(4-Fluorphenyl)amino)-6-(cyclopropylamino)-pyrimido-[5,4-d]pyrimidin,

(29) 4-[(3-Chlor-4-fluor-phenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin und

(30) 4-[(3,4-Dichlorphenyl)amino]-6-(cyclopropylamino)-pyrimido[5,4-d]pyrimidin

sowie deren Salze.

8. Physiologisch verträgliche Salze der Verbindungen nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 7 mit anorganischen oder organischen Säuren oder Basen.

9. Arzneimittel, enthaltend eine Verbindung nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 7 oder ein physiologisch verträgliches Salz gemäß Anspruch 8 neben gegebenenfalls einem oder mehreren inerten Trägerstoffen und/oder Verdünnungsmitteln.

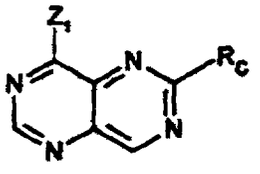
10. Verwendung einer Verbindung nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 8 zur Herstellung eines Arzneimittels, das zur Behandlung von benignen oder malignen Tumoren, insbesondere Tumoren epithelialen und neuroepithelialen Ursprungs, der

Metastasierung sowie der abnormen Proliferation vaskulärer Endothelzellen (Neoangiogenese), geeignet ist.

11. Verfahren zur Herstellung eines Arzneimittels gemäß Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, daß auf nichtchemischem Wege eine Verbindung nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 8 in einen oder mehrere inerte Trägerstoffe und/oder Verdünnungsmittel eingearbeitet wird.

12. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel I gemäß den Ansprüchen 1 bis 8, dadurch gekennzeichnet, daß

a) eine Verbindung der allgemeinen Formel



, (II)

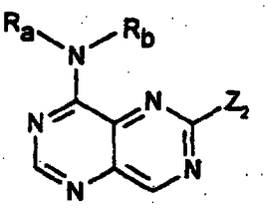
in der
R_c wie in den Ansprüchen 1 bis 7 definiert ist und
Z_1 eine Austrittsgruppe darstellt, mit einem Amin der allgemeinen Formel

$$H-(R_aNR_b) \quad , (III)$$

in der
R_a und R_b wie in den Ansprüchen 1 bis 7 definiert sind, umgesetzt wird oder

b) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel I, in der R_c einen der für R_c in den Ansprüchen 1 bis 7 erwähnten über ein Sauerstoff- oder Stickstoffatom, über eine Mercapto- oder Sulfenylgruppe mit dem Pyrimido[5,4-d]pyrimidin verknüpften Reste darstellt, eine Verbindung der allgemeinen Formel

* C L M S *



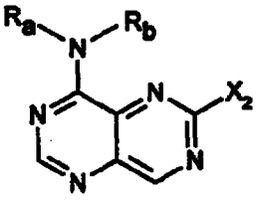
, (IV)

in der
R_a und R_b wie in den Ansprüchen 1 bis 7 definiert sind und
Z_2 eine Austrittsgruppe darstellt, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel

$$X_1 - H \quad , \text{(V)}$$

in der
X_1 einen der für R_c in den Ansprüchen 1 bis 7 erwähnten über ein Sauerstoff- oder Stickstoffatom, über eine Mercapto- oder Sulfenylgruppe mit dem Pyrimido[5,4-d]pyrimidin verknüpften Reste darstellt, umgesetzt wird oder

c) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel I, in der R_c einen der für R_c in den Ansprüchen 1 bis 7 erwähnten über eine Sulfinyl- oder Sulfonylgruppe mit dem Pyrimido-[5,4-d]pyrimidin verknüpften Reste darstellt, eine Verbindung der allgemeinen Formel

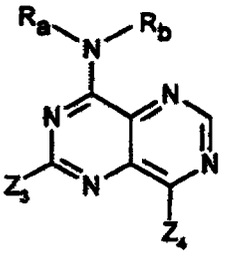


, (VI)

in der
R_a und R_b wie in den Ansprüchen 1 bis 7 definiert sind und
X_2 einen der für R_c in den Ansprüchen 1 bis 7 erwähnten über ein Schwefelatom mit dem Pyrimido[5,4-d]pyrimidin verknüpften Reste darstellt, oxidiert wird oder

* C L M S *

d) zur Herstellung einer Verbindung der allgemeinen Formel I, in der R_c ein Wasserstoffatom darstellt, eine Verbindung der allgemeinen Formel



, (VII)

in der
R_a und R_b wie in den Ansprüchen 1 bis 7 definiert sind,
Z_3 und Z_4, die gleich oder verschieden sein können, jeweils ein Halogenatom darstellen, enthalogeniert wird und

gewünschtenfalls anschließend eine so erhaltene Verbindung der allgemeinen Formel I, die eine Amino-, Alkylamino- oder Iminogruppe enthält, mittels Acylierung oder Sulfonylierung in eine entsprechende Acyl- oder Sulfonylverbindung der allgemeinen Formel I übergeführt wird und/oder

eine so erhaltene Verbindung der allgemeinen Formel I, die eine Amino-, Alkylamino- oder Iminogruppe enthält, mittels Alkylierung oder reduktiver Alkylierung in eine entsprechende Alkylverbindung der allgemeinen Formel I übergeführt werden und/oder

eine so erhaltene Verbindung der allgemeinen Formel I, die eine Carboxygruppe enthält, mittels Veresterung in einen entsprechenden Ester der allgemeinen Formel I übergeführt werden und/oder

eine so erhaltene Verbindung der allgemeinen Formel I, die eine Carboxy- oder Estergruppe enthält, mittels Amidierung in ein entsprechendes Amid der allgemeinen Formel I übergeführt werden und/oder

* C L M S *

eine Verbindung der allgemeinen Formel I, die eine primäre oder sekundäre Hydroxygruppe enthält, mittels Oxidation in eine entsprechende Carbonylverbindung der allgemeinen Formel I übergeführt werden und/oder

erforderlichenfalls ein bei den vorstehend beschriebenen Umsetzungen verwendeter Schutzrest wieder abgespalten wird und/oder

gewünschtenfalls eine so erhaltene Verbindung der allgemeinen Formel I in ihre Stereoisomere aufgetrennt wird und/oder

eine so erhaltene Verbindung der allgemeinen Formel I in ihre Salze, insbesondere für die pharmazeutische Anwendung in ihre physiologisch verträgliche Salze übergeführt wird.