



(19)
Bundesrepublik Deutschland
Deutsches Patent- und Markenamt

(10) **DE 10 2005 016 547 A1** 2006.10.12

(12)

Offenlegungsschrift

(21) Aktenzeichen: **10 2005 016 547.8**

(22) Anmeldetag: **08.04.2005**

(43) Offenlegungstag: **12.10.2006**

(51) Int Cl.⁸: **C07D 471/04 (2006.01)**

A61K 31/437 (2006.01)

A61P 29/00 (2006.01)

(71) Anmelder:
Grünenthal GmbH, 52078 Aachen, DE

(74) Vertreter:
Kutzenberger & Wolff, 50668 Köln

(72) Erfinder:
Frank, Robert, Dr., 52070 Aachen, DE;
Sundermann, Bernd, Dr., 52074 Aachen, DE;
Sundermann, Corinna, Dr., 52074 Aachen, DE

(56) Für die Beurteilung der Patentfähigkeit in Betracht zu ziehende Druckschriften:

EP 05 56 080 A1

WO 04/0 89 366 A1

WO 04/0 48 363 A1

WO 04/0 24 074 A2

WO 02/0 81 475 A1

WO 01/72 748 A1

WO 01/53 298 A1

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

Rechercheantrag gemäß § 43 Abs. 1 Satz 1 PatG ist gestellt.

(54) Bezeichnung: **Substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo(1,2-a)pyridin-2-ylamin-Verbindungen und deren Verwendung zur Herstellung von Arzneimitteln**

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen, Verfahren zu ihrer Herstellung, Arzneimittel, enthaltend diese Verbindungen, und die Verwendung dieser Verbindungen zur Herstellung von Arzneimitteln.

Beschreibung

[0001] Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen, Verfahren zu ihrer Herstellung, Arzneimittel enthaltend diese Verbindungen und die Verwendung dieser Verbindungen zur Herstellung von Arzneimitteln.

[0002] Die Behandlung von Schmerz, insbesondere von neuropathischem Schmerz, hat in der Medizin große Bedeutung. Es besteht ein weltweiter Bedarf an wirksamen Schmerztherapien. Der dringende Handlungsbedarf für eine patientengerechte und zielorientierte Behandlung chronischer und nicht chronischer Schmerzzustände, wobei hierunter die erfolgreiche und zufriedenstellende Schmerzbehandlung für den Patienten zu verstehen ist, dokumentiert sich auch in der großen Anzahl von wissenschaftlichen Arbeiten, die auf dem Gebiet der angewandten Analgetik bzw. der Grundlagenforschung zur Nociception in letzter Zeit erschienen sind.

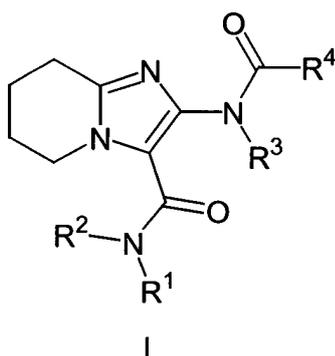
[0003] Einen geeigneten Ansatzpunkt zur Behandlung von Schmerz, insbesondere von neuropathischem Schmerz, stellt der Vanilloid-Rezeptor vom Subtyp 1 (VR1/TRPV1) dar, der häufig auch als Capsaicin-Rezeptor bezeichnet wird. Dieser Rezeptor wird u.a. durch Vanilloide wie z.B. Capsaicin, Hitze und Protonen stimuliert und spielt eine zentrale Rolle bei der Schmerzentstehung. Darüber hinaus ist er für eine Vielzahl weiterer physiologischer und pathophysiologischer Prozesse von Bedeutung wie beispielsweise Migräne; Depressionen; neurodegenerativen Erkrankungen; kognitiven Erkrankungen; Angstzuständen; Epilepsie; Husten; Diarrhöe; Pruritus; Störungen des kardiovaskulären Systems; Störungen der Nahrungsaufnahme; Medikamentenabhängigkeit; Medikamentenmißbrauch und insbesondere Harninkontinenz.

Aufgabenstellung

[0004] Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung bestand daher darin, neue Verbindungen zur Verfügung zu stellen, die sich insbesondere als pharmakologische Wirkstoffe in Arzneimitteln eignen, vorzugsweise in Arzneimitteln zur Behandlung von Störungen oder Krankheiten, die zumindest teilweise durch Vanilloid-Rezeptoren 1 (VR1/TRPV1-Rezeptoren) vermittelt werden.

[0005] Überraschenderweise wurde nun gefunden, dass substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der nachstehend angegebenen allgemeinen Formel I eine ausgezeichnete Affinität zum Vanilloid-Rezeptor vom Subtyp 1 (VR1/TRPV1-Rezeptor) aufweisen und sich daher insbesondere zur Prophylaxe und/oder Behandlung von Störungen oder Krankheiten eignen, die zumindest teilweise durch Vanilloid-Rezeptoren 1 (VR1/TRPV1) vermittelt werden.

[0006] Ein Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der allgemeinen Formel I,



worin

R¹ und R², unabhängig voneinander, jeweils für einen Wasserstoff-Rest;

-C(=O)-OR⁵;

-(CHR⁶)-(CH₂)_m-C(=O)-OR⁷ mit m = 0, 1, 2, 3, 4 oder 5;

-C(=O)-R⁸;

-(CH₂)_n-C(=O)-R⁹ mit n = 1, 2, 3, 4 oder 5;

-C(=O)-NH-R¹⁰;

-(CH₂)_o-C(=O)-NHR¹¹ mit o = 0, 1, 2, 3, 4 oder 5;

-C(=O)-NR¹²R¹³;

-(CH₂)_p-C(=O)-NR¹⁴R¹⁵ mit p = 1, 2, 3, 4 oder 5;

-(CHR¹⁶)-X_q-(CHR¹⁷)_r-Y_s-(CHR¹⁸)_t-Z_u-R¹⁹ mit q = 0 oder 1, r = 0 oder 1, s = 0 oder 1, t = 0 oder 1, u = 0 oder 1,

worin X, Y und Z, unabhängig voneinander, jeweils für O, S, NH, N(CH₃), N(C₂H₅) oder N[CH(CH₃)₂] stehen; für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C₁₋₁₀ aliphatischen Rest; für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest, der mit einer linearen oder verzweigten, ggf. substituierten C_{1,5}-Alkylen-Gruppe überbrückt und/oder mit einem gesättigten, ungesättigten oder aromatischen, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann;

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann, stehen;

oder

R¹ und R² zusammen mit dem sie verbindenden Stickstoffatom als Ringglied einen gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen heterocycloaliphatischen Rest bilden, der mit einem gesättigten, ungesättigten oder aromatischen, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann und/oder über ein gemeinsames Ringatom zusammen mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten 5-, 6- oder 7-gliedrigen cycloaliphatischen Rest eine ggf. substituierte Spiro-Verbindung bilden kann,

wobei jeweils der heterocycloaliphatische Rest und ggf. der cycloaliphatische Rest der Spiro-Verbindung mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus R²⁰, -(CHR²¹)-(CH₂)_v-(CH₂)_w-R²² mit v = 0 oder 1 und w = 0 oder 1, -CH=CH-R²³, -(CH₂)_x-C(=O)-OR²⁴ mit x = 0, 1, 2, 3, 4 oder 5; -(CH₂)_y-C(=O)-R²⁵ mit y = 0, 1, 2, 3, 4 oder 5; -(CH₂)_z-C(=O)-NHR²⁶ mit z = 0, 1, 2, 3, 4 oder 5; -(CH₂)_{aa}-C(=O)-NR²⁷R²⁸ mit aa = 0, 1, 2, 3, 4 oder 5; F; Cl; Br; -CN; -CF₃; -NO₂; Oxo (=O); Thioxo (=S); -C_{1,5}-Alkyl; -OH; -O-C_{1,5}-Alkyl; -SH; -S-C_{1,5}-Alkyl; -NH₂; -NH-C_{1,5}-Alkyl und -N(C_{1,5}-Alkyl)₂ substituiert und/oder jeweils weitere 1, 2, 3, 4 oder 5 Heteroatom(e) unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel als Ringglieder) aufweisen kann;

R³ für einen Wasserstoff-Rest;

für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C₁₋₁₀ aliphatischen Rest, für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest, der über eine lineare oder verzweigte, ggf. substituierte C_{1,5}-Alkylen-, C_{2,5}-Alkenylen- oder C_{2,5}-Alkinylen-Gruppe gebunden sein kann,

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert und/oder über eine lineare oder verzweigte, ggf. substituierte C_{1,5}-Alkylen-, C_{2,5}-Alkenylen- oder C_{2,5}-Alkinylen-Gruppe gebunden sein kann, steht;

R⁴ für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C₁₋₁₀ aliphatischen Rest,

für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest, der über eine lineare oder verzweigte, ggf. substituierte C_{1,5}-Alkylen-, C_{2,5}-Alkenylen- oder C_{2,5}-Alkinylen-Gruppe gebunden sein kann,

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert und/oder über eine lineare oder verzweigte, ggf. substituierte C_{1,5}-Alkylen-, C_{2,5}-Alkenylen- oder C_{2,5}-Alkinylen-Gruppe gebunden sein kann, steht;

R⁵, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R²⁴, R²⁵, R²⁶, R²⁷ und R²⁸, unabhängig voneinander, jeweils für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C₁₋₁₀ aliphatischen Rest, für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest, der mit einem gesättigten, ungesättigten oder aromatischen, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert und/oder über eine lineare oder verzweigte, ggf. substituierte C_{1,5}-Alkylen-, C_{2,5}-Alkenylen- oder C_{2,5}-Alkinylen-Gruppe gebunden sein kann,

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert und/oder über eine lineare oder verzweigte, ggf. substituierte C_{1,5}-Alkylen-, C_{2,5}-Alkenylen- oder C_{2,5}-Alkinylen-Gruppe gebunden sein kann, stehen;

R⁶ für einen Wasserstoff-Rest;

für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C₁₋₁₀ aliphatischen Rest, der 1, 2, 3, 4 oder 5 Heteroatom(e) unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff als Kettenglied(er) aufweisen kann;

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert und/oder über eine lineare oder verzweigte, ggf. substituierte C_{1,5}-Alkylen-, C_{2,5}-Alkenylen- oder C_{2,5}-Alkinylen-Gruppe gebunden sein kann, steht;

R¹⁶, R¹⁷ und R¹⁸, unabhängig voneinander, jeweils

für einen Wasserstoff-Rest;

für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C₁₋₁₀ aliphatischen Rest, der 1, 2, 3, 4 oder 5 Heteroatom(e) unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff als Kettenglied(er) aufweisen kann

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann, stehen;

R¹⁹ für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest, der mit 1, 2, 3, 4 oder 5 linearen oder verzweigten, ggf. substituierten C₁₋₅-Alkylen-Gruppen überbrückt und/oder mit einem gesättigten, ungesättigten oder aromatischen, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann;

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann, steht;

R²⁰ für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C₁₋₁₀ aliphatischen Rest;

für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann, steht;

R²¹ für einen Wasserstoff-Rest;

für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C₁₋₁₀ aliphatischen Rest;

für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann, steht;

und

R²² und R²³, unabhängig voneinander, jeweils

für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann, stehen;

wobei

die vorstehend genannten C₁₋₁₀ aliphatischen Reste jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH und -NH₂ substituiert sein können;

die vorstehend genannten cycloaliphatischen Reste jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Oxo (=O), Thioxo (=S), F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -O-C₁₋₅-Alkyl, -NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -S-CF₃, -SH, -S-C₁₋₅-Alkyl, -C₁₋₅-Alkyl, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-C₁₋₅-Alkyl, -NH-C₁₋₅-Alkyl, -N(C₁₋₅-Alkyl)₂, -(CH₂)-Benzo[b]furanyl, -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl und Benzyl substituiert sein können, wobei jeweils der zyklische Teil der Reste -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl, -(CH₂)-Benzo[b]furanyl und Benzyl mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, -OH, -CF₃, -SF₅, -CN, -NO₂, -C₁₋₅-Alkyl, -O-C₁₋₅-Alkyl, -O-CF₃, -S-CF₃, Phenyl und -O-Benzyl substituiert sein kann

und die vorstehend genannten cycloaliphatischen Reste jeweils ggf. 1, 2, 3, 4 oder 5 Heteroatom(e) unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel als Ringglied(er) aufweisen können;

die vorstehend genannten C₁₋₅-Alkylen-, C₂₋₅-Alkenylen- oder C₂₋₅-Alkinylen-Gruppen jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, -OH, -SH, -NH₂, -CN, NO₂ und Phenyl substituiert sein können;

die Ringe der vorstehend genannten mono- oder polyzyklischen Ringsysteme ggf. jeweils mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Oxo (=O), Thioxo (=S), F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -O-C₁₋₅-Alkyl, -NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -S-CF₃, -SH, -S-C₁₋₅-Alkyl, -C₁₋₅-Alkyl, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-C₁₋₅-Alkyl, -NH-C₁₋₅-Alkyl, -N(C₁₋₅-Alkyl)₂, -(CH₂)-Benzo[b]furanyl, -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl und Benzyl substituiert sein können, wobei jeweils der zyklische Teil der Reste -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl, -(CH₂)-Benzo[b]furanyl und Benzyl mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, -OH, -CF₃, -SF₅, -CN, -NO₂, -C₁₋₅-Alkyl, -O-C₁₋₅-Alkyl, -O-CF₃, -S-CF₃, Phenyl und -O-Benzyl substituiert sein kann

und die Ringe der vorstehend genannten mono- oder polyzyklischen Ringsysteme jeweils 5-, 6- oder 7-gliedrig sind und jeweils ggf. 1, 2, 3, 4 oder 5 Heteroatom(e) als Ringglied(er) aufweisen können, die unabhängig voneinander aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel ausgewählt sind;

und die vorstehend genannten Aryl- oder Heteroaryl-Reste jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten un-

abhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -O-C₁₋₅-Alkyl, -NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -S-CF₃, -SH, -S-C₁₋₅-Alkyl, -C₁₋₅-Alkyl, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-C₁₋₅-Alkyl, -NH-C₁₋₅-Alkyl, -N(C₁₋₅-Alkyl)₂, -NH-C(=O)-O-C₁₋₅-Alkyl, -C(=O)-H, -C(=O)-C₁₋₅-Alkyl, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-C₁₋₅-Alkyl, C(=O)-N-(C₁₋₅-Alkyl)₂, -(CH₂)-Benzo[b]furanyl, -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl und Benzyl substituiert sein können, wobei jeweils der zyklische Teil der Reste -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl, -(CH₂)-Benzo[b]furanyl und Benzyl mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, -OH, -CF₃, -SF₅, -CN, -NO₂, -C₁₋₅-Alkyl, -O-C₁₋₅-Alkyl, -O-CF₃, -S-CF₃, Phenyl und -O-Benzyl substituiert sein kann,

und

die vorstehend genannten Heteroaryl-Reste jeweils ggf. 1, 2, 3, 4 oder 5 Heteroatom(e) unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel als Ringglied(er) aufweisen können;

jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0007] Unter einem mono- oder polyzyklischen Ringsystem werden im Sinne der vorliegenden Erfindung mono- oder polyzyklische Kohlenwasserstoffreste verstanden, die gesättigt, ungesättigt oder aromatisch sein und ggf. 1, 2, 3, 4 oder 5 Heteroatome unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel als Ringglieder aufweisen können. Ein solches mono- bzw. polyzyklisches Ringsystem kann beispielsweise mit einem cycloaliphatischen Rest, einem Aryl-Rest oder einem Heteroaryl-Rest kondensiert (anneliert) sein.

[0008] Sofern ein polyzyklisches Ringsystem wie beispielsweise ein bicyklisches Ringsystem vorliegt, können die verschiedenen Ringe, jeweils unabhängig voneinander, einen unterschiedlichen Sättigungsgrad aufweisen, d.h. gesättigt, ungesättigt oder aromatisch sein. Bevorzugt ist ein polyzyklisches Ringsystem ein bicyklisches Ringsystem.

[0009] Aliphatische Reste im Sinne der vorliegenden Erfindung umfassen gesättigte Alkyl-Reste wie auch ungesättigte Alkenyl-Reste mit wenigstens einer C=C-Doppelbindung und ungesättigte Alkynyl-Reste mit wenigstens einer CC-Dreifachbindung. Beispielhaft seien Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, n-Pentyl, sec-Pentyl, 2-Pentyl, 3-Pentyl, iso-Pentyl, neo-Pentyl, n-Hexyl, 2-Hexyl, 3-Hexyl, n-Heptyl, n-Octyl, n-Nonyl, n-Decyl, -C(H)(C₂H₅)₂, -C(H)(CH₃)-C(H)(CH₃)₂, -(CH₂)-(CH₂)-C(CH₃)₃, -C(H)(n-C₃H₇)₂, -CH₂-CH₂-C(H)(CH₃)-(CH₂)₃-CH₃, Vinyl, Ethinyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, Hexenyl, Hexinyl und -CH=CH-CH=CH-CH₃ als aliphatische Reste genannt.

[0010] Cycloaliphatische Reste im Sinne der vorliegenden Erfindung umfassen sowohl gesättigte wie auch ungesättigte cyclische Kohlenwasserstoffreste, die jeweils ggf. 1, 2, 3, 4 oder 5 Heteroatom(e) unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel als Ringglied(er) aufweisen können. Beispielhaft seien die Reste Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cycloheptenyl, Cyclooctenyl, Imidazolidinyl, Tetrahydrofuranyl (Tetrahydrofuryl), Piperidinyl, Piperazinyl, Morpholinyl, Pyrrolidinyl, Tetrahydrothiophenyl, Tetrahydropyranyl, Thiomorpholinyl, Dioxolanyl, Azepanyl, Diazepanyl und Dithiolanyl genannt.

[0011] Als geeignete Aryl-Reste seien beispielsweise Phenyl und Naphthyl (1-Naphtyl und 2-Naphtyl) genannt.

[0012] Als geeignete Heteroaryl-Reste seien beispielhaft Pyridinyl, Thiophenyl (Thienyl), Furanyl (Furyl), Pyrazolinyl, Pyrimidinyl, Pyridinyl, 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, Pyridazinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, Pyrazinyl, 3-Pyrazinyl, Imidazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, Isoxazolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, Pyrazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, Oxazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 1,2,3-Oxathiazolyl, 1,2,3-Oxadiazolyl, 1,2,4-Oxadiazolyl, 1,2,5-Oxadiazolyl, 1,3,4-Oxadiazolyl, Thiazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 2-Thiophenyl, 3-Thiophenyl, Pyrrolyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isopyrrolyl, 4-Isopyrrolyl, 5-Isopyrrolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,3,4-Thiadiazol-5-yl, Triazolyl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,2,4-Triazol-5-yl, 1,2,3,4-Tetrazol-5-yl, 1,2,3,4-Thiatriazolyl, Chinolinyl, Triazinyl, Chinoxalanyl, Pyranyl, Indolyl, Isoindolyl, Benzo[b]furanyl, Benzo[b]thiophenyl, Indazolyl und Isochinolinyl ge-

nannt.

[0013] Der Fachmann versteht, daß einige der erfindungsgemäßen substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der allgemeinen Formel I in Form von Tautomeren vorliegen können, die ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind und jeweils auch als Wirkstoffe in den untenstehend beschriebenen Arzneimitteln vorliegen können.

[0014] Bevorzugt sind substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin

R^1 für einen Wasserstoff-Rest; $-C(=O)-OR^5$; $-(CHR^6)-(CH_2)_m-C(=O)-OR^7$ mit $m = 0, 1, 2, 3, 4$ oder 5 ; $-C(=O)-NH-R^{10}$; $-(CH_2)_o-C(=O)-NHR^{11}$ mit $o = 0, 1, 2, 3, 4$ oder 5 ; $-(CHR^{16})-X_q-(CHR^{17})_r-Y_s-(CHR^{18})_t-Z_u-R^{19}$ mit $q = 0$ oder 1 , $r = 0$ oder 1 , $s = 0$ oder 1 , $t = 0$ oder 1 , $u = 0$ oder 1 , worin X, Y und Z, unabhängig voneinander, jeweils für O, S, NH und $N(CH_3)$ stehen;

für einen ggf. substituierten Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, $-(CH_2)-(CH_2)-(CN)$, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, $-C(H)(CH_3)-C(H)(CH_3)_2$ und $-(CH_2)-(CH_2)-(C(CH_3)_3)$,

für einen Alkenyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Vinyl, 1-Propenyl und 2-Propenyl,

für einen (hetero)cycloaliphatischen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cycloheptenyl, Imidazolidinyl, Tetrahydrofuranlyl, Tetrahydrothiophenyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Morpholinyl, Piperazinyl, Thiomorpholinyl, Tetrahydropyranlyl, Azepanyl, Diazepanyl, Dithiolanyl, (6,6)-Dimethyl-[3.1.1]-bicycloheptyl, Indanyl, Indenyl, (1,4)-Benzodioxanyl, (1,2,3,4)-Tetrahydronaphthyl, (1,2,3,4)-Tetrahydrochinolinyl und (1,2,3,4)-Tetrahydrochinazolinyl, wobei der (hetero)cycloaliphatische Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, $-CN$, $-CF_3$, $-SF_5$, $-OH$, $-NH_2$, $-O-CF_3$, $-SH$, $-O-CH_3$, $-O-C_2H_5$, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, $-S-CH_3$, $-S-C_2H_5$, $-C(=O)-O-CH_3$, $-C(=O)-O-C_2H_5$, Oxo ($=O$), $-N(CH_3)_2$, $-N(C_2H_5)_2$, $-N(H)(CH_3)$, $-N(H)(C_2H_5)$, $-NO_2$, $-SCF_3$, $-C(=O)-OH$, $-(CH_2)-Benzo[b]furanlyl$, $-O-Phenyl$, $-O-Benzyl$, Phenyl und Benzyl substituiert sein kann, wobei jeweils der zyklische Teil der $-(CH_2)-Benzo[b]furanlyl$, $-O-Phenyl$, $-O-Benzyl$, Benzyl- und Phenyl-Reste mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, $-OH$, $-CF_3$, $-SF_5$, $-CN$, $-NO_2$, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, n-Propyl, $-O-CH_3$, $-O-C_2H_5$, $-O-CF_3$, Phenyl und $-O-Benzyl$ substituiert sein kann,

oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, (1,4)-Benzodioxanyl, Thiophenyl, Furanyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl, Pyrazinyl, Pyranlyl, Triazolyl, Pyridinyl, Imidazolyl, Indolyl, Isoindolyl, Benzo[b]furanlyl, Benzo[b]thiophenyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Pyrimidinyl, Indazolyl, Chinazolinyll, Chinolinyl und Isochinolinyl, wobei der Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, $-CN$, $-NO_2$, $-OH$, $-SH$, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, $-CF_3$, $-O-CF_3$, $-S-CF_3$, $-SF_5$, $-O-CH_3$, $-O-C_2H_5$, $-O-Phenyl$, $-O-Benzyl$, $-NH_2$, $-N(CH_3)_2$, $-N(C_2H_5)_2$, $-N(H)(CH_3)$, $-N(H)(C_2H_5)$, $-NH-C(=O)-O-CH_3$, $-NH-C(=O)-O-C_2H_5$ und $-NH-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ substituiert sein kann, steht, und jeweils die übrigen Reste R^1 und R^2 zusammen sowie R^2-R^{28} die vorstehend genannte Bedeutung haben, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

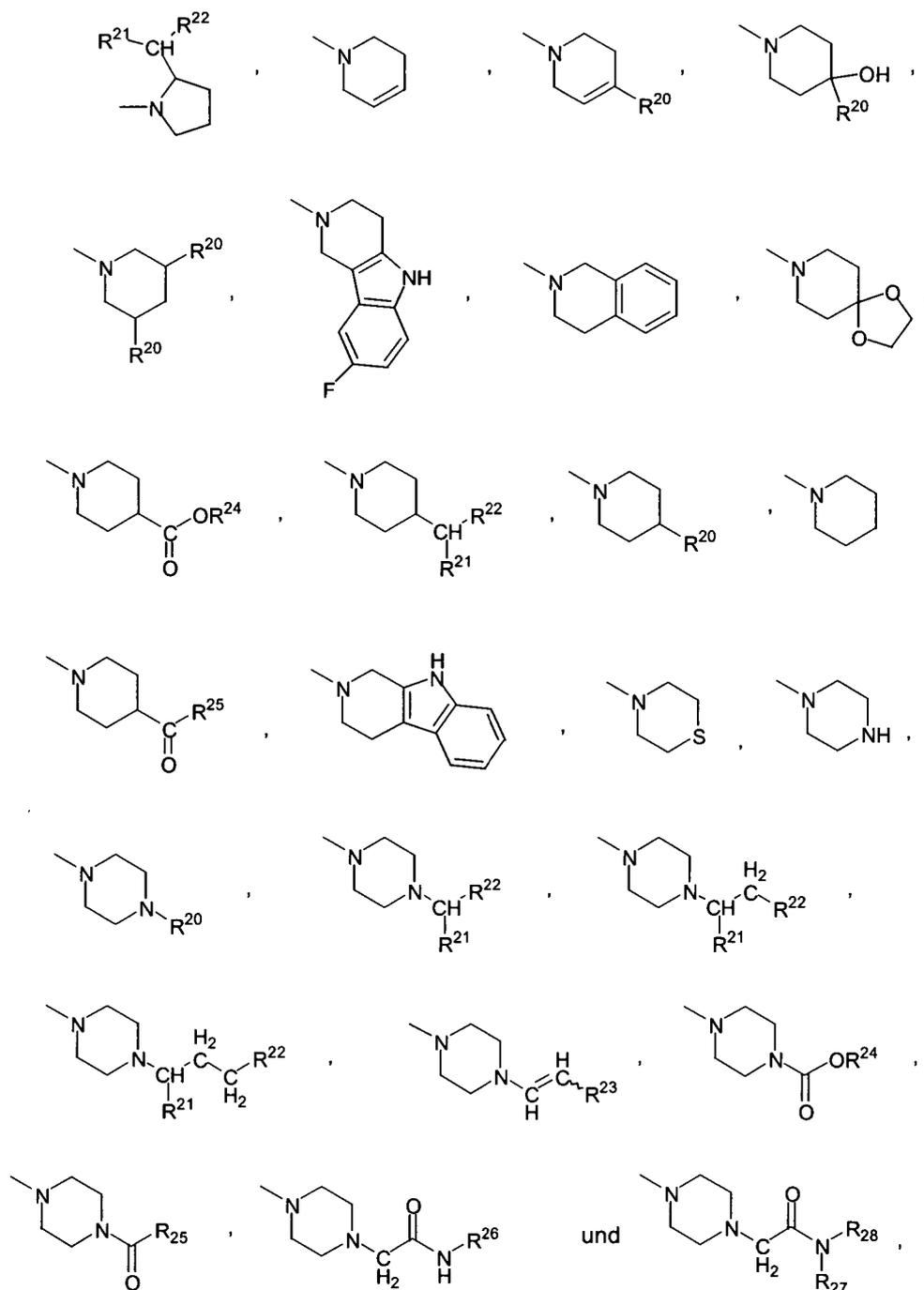
[0015] Weiterhin bevorzugt sind substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin

R^2 für einen Wasserstoff-Rest,

für $-(CHR^{16})-R^{19}$,

oder für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl steht, und jeweils die übrigen Reste R^1 , R^1 und R^2 zusammen sowie R^3-R^{28} die vorstehend genannte Bedeutung haben, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0016] Weiterhin bevorzugt sind auch substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin R^1 und R^2 zusammen mit dem sie verbindenden Stickstoffatom als Ringglied einen Rest bilden ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus



und jeweils die übrigen Reste R^1 und R^2 separat und R^3 – R^{28} die vorstehend genannte Bedeutung haben, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0017] Weiterhin bevorzugt sind auch substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin R^3 für einen Wasserstoff-Rest oder für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl und n-Pentyl steht, und jeweils die übrigen Reste R^1 , R^2 und R^4 – R^{28} die vorstehend genannte Bedeutung haben, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0018] Weiterhin bevorzugt sind auch substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin R^4 für einen Phenyl- oder Naphthyl-Rest steht, der jeweils mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, F, Cl, Br, -CN, -SF₅, -S-CF₃, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃), -N(H)(C₂H₅), -SH, -NO₂, -CF₃, -OCF₃, -OH, -O-CH₃ und -O-C₂H₅ substituiert und/oder über eine -(CH₂)-, -(CH₂)₂- oder -(CH₂)₃-Gruppe gebunden sein kann, und jeweils die übrigen Reste R^1 - R^3 und R^5 - R^{28} die vorstehend genannte Bedeutung haben, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0019] Weiterhin bevorzugt sind auch substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin R^5 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} und R^{15} , unabhängig voneinander, jeweils für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl, wobei der Alkyl-Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH und -NH₂ substituiert sein kann, oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, (1,4)-Benzodioxanyl, Thiophenyl, Furanyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl, Pyrazinyl, Pyranyl, Triazolyl, Pyridinyl, Imidazolyl, Indolyl, Isoindolyl, Benzo[b]furanyl, Benzo[b]thiophenyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Pyrimidinyl, Indazolyl, Chinazolinyl, Chinolinyl und Isochinolinyl, wobei der Rest jeweils über eine -(CH₂)-, -(CH₂)₂- oder -(CH₂)₃-Gruppe gebunden und/oder ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -CF₃, -O-CF₃, -S-CF₃, -SF₅, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-Phenyl, -O-Benzyl, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃), -N(H)(C₂H₅), -NH-C(=O)-O-CH₃, -NH-C(=O)-O-C₂H₅ und -NH-C(=O)-O-C(CH₃)₃ substituiert sein kann, stehen, und jeweils die übrigen Reste R^1 - R^4 , R^6 und R^{16} - R^{28} die vorstehend genannte Bedeutung haben, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0020] Weiterhin bevorzugt sind auch substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin R^6 für einen Wasserstoff-Rest, für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, n-Pentyl, sec-Pentyl, -C(H)(CH₃)-C(H)(CH₃)₂, -(CH₂)-(CH₂)-(C(CH₃)₃), -C(H)(CH₃)(O(C(CH₃)₃)) und n-Hexyl, wobei der Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH und -NH₂ substituiert sein kann, oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, (1,4)-Benzodioxanyl, Thiophenyl, Furanyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl, Pyrazinyl, Pyranyl, Triazolyl, Pyridinyl, Imidazolyl, Indolyl, Isoindolyl, Benzo[b]furanyl, Benzo[b]thiophenyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Pyrimidinyl, Indazolyl, Chinazolinyl, Chinolinyl und Isochinolinyl, wobei der Rest jeweils über eine -(CH₂)-, -(CH₂)₂- oder -(CH₂)₃-Gruppe gebunden und/oder ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -CF₃, -O-CF₃, -S-CF₃, -SF₅, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-Phenyl, -O-Benzyl, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃), -N(H)(C₂H₅), -NH-C(=O)-O-CH₃, -NH-C(=O)-O-C₂H₅ und -NH-C(=O)-O-C(CH₃)₃ substituiert sein kann, steht, und jeweils die übrigen Reste R^1 - R^5 und R^7 - R^{28} die vorstehend genannte Bedeutung haben, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0021] Weiterhin bevorzugt sind auch substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin R^{16} , R^{17} und R^{18} , unabhängig voneinander, jeweils für einen Wasserstoff-Rest,

für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, n-Pentyl, sec-Pentyl, $-C(H)(CH_3)-C(H)(CH_3)_2$, $-(CH_2)-(CH_2)-(C(CH_3)_3)$, $-(CH_2)-O-(CH_3)$ und n-Hexyl, wobei der Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, $-NO_2$, -OH, -SH und $-NH_2$ substituiert sein kann, oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl und Naphthyl, wobei der Rest jeweils mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, $-NO_2$, -OH, -SH, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, $-CF_3$, $-O-CF_3$, $-S-CF_3$, $-SF_5$, $-O-CH_3$, $-O-C_2H_5$, -O-Phenyl, -O-Benzyl, $-NH_2$, $-N(CH_3)_2$, $-N(C_2H_5)_2$, $-N(H)(CH_3)$, $-N(H)(C_2H_5)$, $-NH-C(=O)-O-CH_3$, $-NH-C(=O)-O-C_2H_5$ und $-NH-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ substituiert sein kann, stehen, und jeweils die übrigen Reste R^{1-15} und R^{19-28} die vorstehend genannte Bedeutung haben, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0022] Weiterhin bevorzugt sind auch substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin

R^{19} für einen (hetero)cycloaliphatischen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cycloheptenyl, Imidazolidinyl, Tetrahydrofuranlyl, Tetrahydrothiophenyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Morpholinyl, Piperazinyl, Thiomorpholinyl, Tetrahydropyranlyl, Azepanyl, Diazepanyl, Dithiolanyl, (6,6)-Dimethyl-[3.1.1]-bicycloheptyl, Adamantyl (Tricyclo-[3.3.1.1^{3,7}]-decanyl), Indanyl, Indenyl, (1,4)-Benzodioxanyl, (1,2,3,4)-Tetrahydronaphthyl, (1,2,3,4)-Tetrahydrochinolinyl und (1,2,3,4)-Tetrahydrochinazolinyl, wobei der (hetero)cycloaliphatische Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, $-CF_3$, $-SF_5$, -OH, $-NH_2$, $-O-CF_3$, -SH, $-O-CH_3$, $-O-C_2H_5$, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, $-S-CH_3$, $-S-C_2H_5$, $-C(=O)-O-CH_3$, $-C(=O)-O-C_2H_5$, Oxo (=O), $-N(CH_3)_2$, $-N(C_2H_5)_2$, $-N(H)(CH_3)$, $-N(H)(C_2H_5)$, $-NO_2$, $-SCF_3$, $-C(=O)-OH$, $-(CH_2)-Benzo[b]furanlyl$, -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl und Benzyl substituiert sein kann,

oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, (1,4)-Benzodioxanyl, Thiophenyl, Furanyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl, Pyrazinyl, Pyranyl, Triazolyl, Pyridinyl, Imidazolyl, Indolyl, Isoindolyl, Benzo[b]furanlyl, Benzo[b]thiophenyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Pyrimidinyl, Indazolyl, Chinazolinyll, Chinolinyl und Isochinolinyl, wobei der Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, $-NO_2$, -OH, -SH, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, $-CF_3$, $-O-CF_3$, $-S-CF_3$, $-SF_5$, $-O-CH_3$, $-O-C_2H_5$, -O-Phenyl, -O-Benzyl, $-NH_2$, $-N(CH_3)_2$, $-N(C_2H_5)_2$, $-N(H)(CH_3)$, $-N(H)(C_2H_5)$, $-NH-C(=O)-O-CH_3$, $-NH-C(=O)-O-C_2H_5$ und $-NH-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ substituiert sein kann, steht, und jeweils die übrigen Reste R^{1-18} und R^{20-28} die vorstehend genannte Bedeutung haben, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0023] Weiterhin bevorzugt sind auch substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin

R^{20} für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl und n-Pentyl,

für einen (hetero)cycloaliphatischen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyclopentyl, Cyclohexyl, Piperidinyl und Cycloheptyl, wobei der (hetero)cycloaliphatische Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, $-CF_3$, $-SF_5$, -OH, $-NH_2$, $-O-CF_3$, -SH, $-O-CH_3$, $-O-C_2H_5$, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl substituiert sein kann,

oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, Thiophenyl, Furanyl, Pyridinyl, Imidazolyl, Indolyl, Benzo[b]furanlyl, Benzo[b]thiophenyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Pyrimidinyl und Chinolinyl, wobei der Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, F, Cl, Br, -CN, $-SF_5$, $-O-CF_3$, $-S-CF_3$, $-NH_2$, $-N(CH_3)_2$, $-N(C_2H_5)_2$, $-N(H)(CH_3)$, $-N(H)(C_2H_5)$, -SH, $-NO_2$, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, $-O-CH_3$ und $-O-C_2H_5$ substituiert sein kann, steht, und jeweils die übrigen Reste R^{1-19} und R^{21-28} die vorstehend genannte Bedeutung haben, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren,

in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0024] Weiterhin bevorzugt sind auch substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin R^{21} für einen Wasserstoff-Rest

oder für einen Phenyl- oder Naphthyl-Rest, der mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, F, Cl und Br substituiert sein kann, steht,

und jeweils die übrigen Reste R^1 – R^{20} und R^{22} – R^{28} die vorstehend genannte Bedeutung haben, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0025] Weiterhin bevorzugt sind auch substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin

R^{22} und R^{23} , unabhängig voneinander, jeweils für einen (hetero)cycloaliphatischen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Pyrrolidinyl, Morpholinyl und Thiomorpholinyl, wobei der (hetero)cycloaliphatische Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -NH₂, -O-CF₃, -SH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl substituiert sein kann,

oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, Thiophenyl, Furanyl, Pyridinyl, Imidazolyl, Indolyl, Benzo[b]furanyl, Benzo[b]thiophenyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Pyrimidinyl und Chinolinyl, wobei der Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, F, Cl, Br, -CN, -SF₅, -O-CF₃, -S-CF₃, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃), -N(H)(C₂H₅), -SH, -NO₂, -CF₃, -OCF₃, -OH, -O-CH₃ und -O-C₂H₅ substituiert sein kann, stehen, und jeweils die übrigen Reste R^1 – R^{21} und R^{24} – R^{28} die vorstehend genannte Bedeutung haben, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0026] Weiterhin bevorzugt sind auch substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin

R^{24} für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl und tert-Butyl steht,

R^{25} für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, Furanyl, Pyrazinyl und Pyrimidinyl, der über eine -(CH₂)-, -(CH₂)₂- oder -(CH₂)₃-Gruppe gebunden und/oder mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl und iso-Propyl substituiert sein kann, steht,

R^{26} für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl und iso-Propyl steht,

R^{27} für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, iso-Propyl und n-Propyl oder für einen Phenyl-Rest steht,

und

R^{28} für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, iso-Propyl und n-Propyl oder für einen Phenyl-Rest steht,

und jeweils die übrigen Reste R^1 – R^{23} die vorstehend genannte Bedeutung haben, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0027] Besonders bevorzugt sind substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin

R^1 für -C(=O)-OR⁵; -(CHR⁶)-C(=O)-OR⁷; -C(=O)-NHR¹¹; -(CH₂)-C(=O)-NHR¹¹; -(CHR¹⁶)-R¹⁹; -(CHR¹⁶)-(CHR¹⁷)-R¹⁹; -(CHR¹⁶)-(CHR¹⁷)-O-R¹⁹; -(CHR¹⁶)-(CHR¹⁷)-(CHR¹⁸)-R¹⁹; -(CHR¹⁶)-(CHR¹⁷)-S-(CHR¹⁸)-R¹⁹; -(CHR¹⁶)-(CHR¹⁷)-(CHR¹⁸)-N(CH₃)-R¹⁹,

für einen ggf. substituierten Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CN}$, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ und $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)_3$,
für einen Alkenyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus 1-Propenyl und 2-Propenyl,

für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, (6,6)-Dimethyl-[3.1.1]-bicycloheptyl, Indanyl und Indenyl, wobei der Rest jeweils mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, n-Propyl und -O-Benzyl substituiert sein kann,

für einen Pyrrolidinyl-Rest, der mit einem $-(\text{CH}_2)-$ Benzo[b]furanyl- oder Benzyl-Rest substituiert sein kann, wobei der zyklische Teil des Benzyl-Rests jeweils mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, -OH, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, n-Propyl, $-\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{CH}_3$, $-\text{O}-\text{C}_2\text{H}_5$, Phenyl und -O-Benzyl substituiert sein kann,

oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl und (1,4)-Benzodioxanyl steht, wobei der Rest jeweils mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -O-Phenyl, -O-Benzyl, $-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_3$, $-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_2\text{H}_5$ und $-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$ substituiert sein kann;

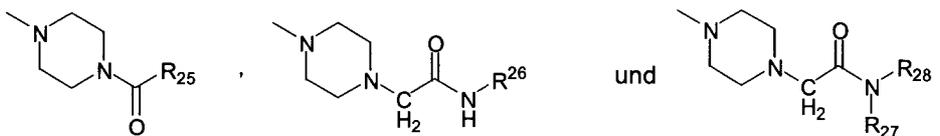
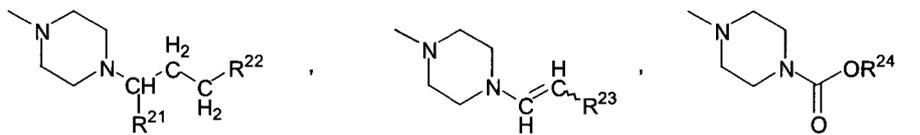
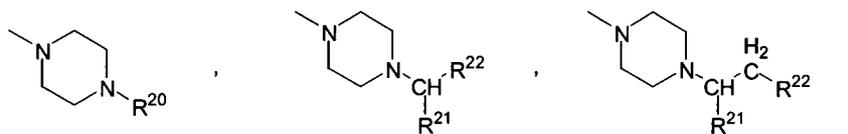
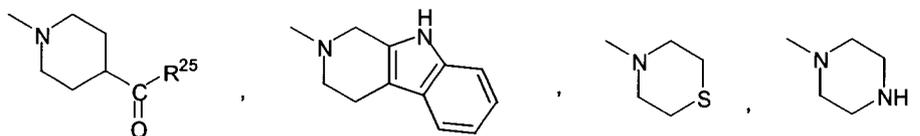
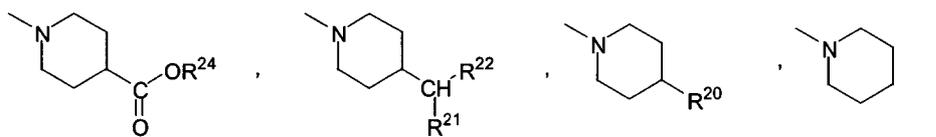
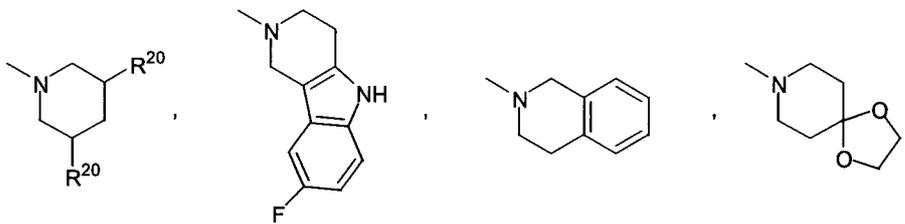
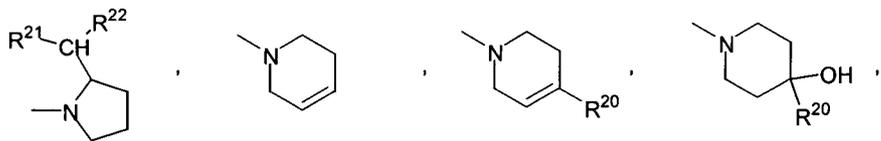
R^2 für einen Wasserstoff-Rest,

$-(\text{CHR}^{16})-\text{R}^{19}$,

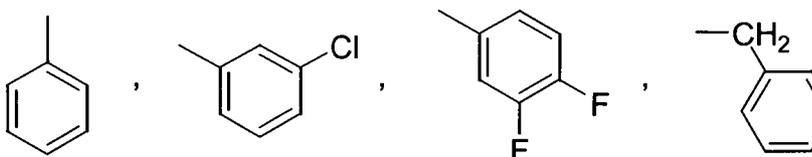
oder für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl steht;

oder

R^1 und R^2 zusammen mit dem sie verbindenden Stickstoffatom als Ringglied einen Rest bilden, der ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus



R³ für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl;
 R⁴ für einen Rest steht, der ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus



R⁵, R⁷ und R¹¹, unabhängig voneinander, jeweils

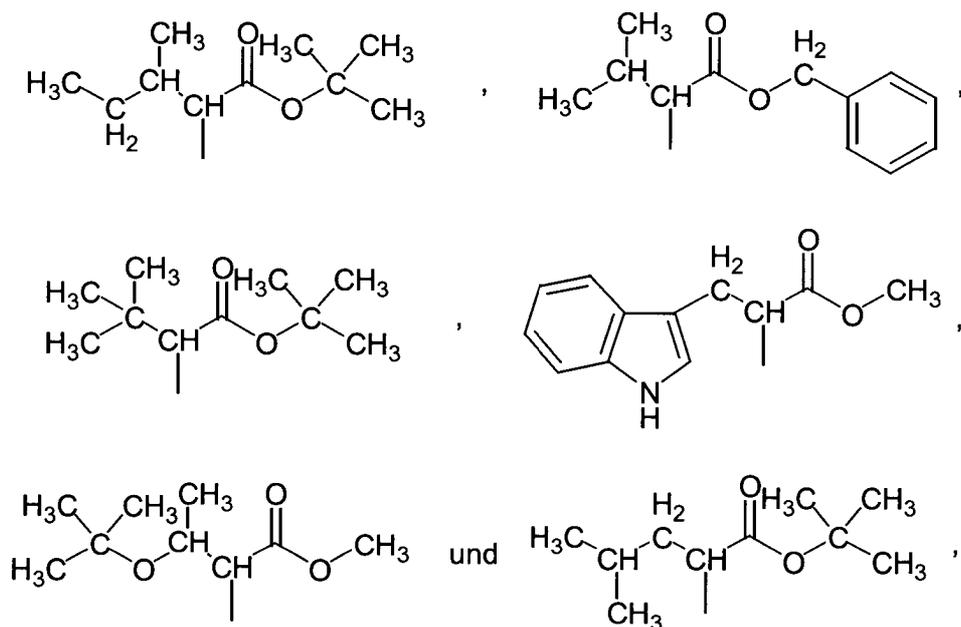
für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl;
 oder für einen Benzyl- oder Naphthyl-Rest stehen;
 R⁶ für einen Wasserstoff-Rest,
 für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, n-Pentyl, sec-Pentyl, neo-Pentyl und -C(H)(CH₃)(O(C(CH₃)₃)),
 oder für einen Indolyl-Rest, der über eine -(CH₂)₂-Gruppe gebunden ist, steht;
 R¹⁶ für einen Wasserstoff-Rest,
 für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, iso-Propyl, n-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl und -(CH₂)₂-O-(CH₃),
 oder für einen Phenyl-Rest steht;
 R¹⁷ für einen Wasserstoff-Rest,
 für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, iso-Propyl, n-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl und tert-Butyl oder für einen Phenyl-Rest steht;
 R¹⁸ für einen Wasserstoff-Rest
 oder für einen Phenyl-Rest steht;
 R¹⁹ für einen (hetero)cycloaliphatischen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Tetrahydrofuranlyl, Tetrahydrothiophenyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Adamantyl (Tricyclo-[3.3.1.1^{3,7}]-decanyl) und (1,4)-Benzodioxanyl, wobei der (hetero)cycloaliphatische Rest jeweils mit 1 oder 2 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend Methyl, Ethyl, iso-Propyl und n-Propyl substituiert sein kann,
 oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, (1,4)-Benzodioxanyl, Thiophenyl, Furanyl, Pyridinyl, Imidazolyl, Indolyl und Isoindolyl, wobei der Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -CF₃, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-CF₃, -O-Phenyl, -O-Benzyl, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃) und -N(H)(C₂H₅) substituiert sein kann, steht;
 R²⁰ für einen Methyl- oder Ethyl-Rest,
 für einen (hetero)cycloaliphatischen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyclopentyl, Cyclohexyl, Piperidinyl und Cycloheptyl,
 oder für einen Phenyl- oder Pyridinyl-Rest, der mit der mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, F, Cl, Br, -CF₃, -OH, -O-CH₃ und -O-C₂H₅ substituiert sein kann, steht;
 R²¹ für einen Wasserstoff-Rest
 oder für einen Phenyl-Rest, der mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, F, Cl und Br substituiert sein kann, steht;
 R²² für einen Pyrrolidinyl- oder Morpholinyl-Rest
 oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, Thiophenyl, Benzo[b]furanlyl, Benzo[b]thiophenyl und Chinolinyl, wobei der Rest jeweils mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, F, Cl, Br, -OH, -O-CH₃ und -O-C₂H₅ substituiert sein kann, steht;
 R²³ für einen Phenyl-Rest steht;
 R²⁴ für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl und tert-Butyl steht;
 R²⁵ für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, Furanyl, Pyrazinyl und Pyrimidinyl steht, der über eine -(CH₂)₂-Gruppe gebunden und/oder mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl und iso-Propyl substituiert sein kann;
 R²⁶ für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl und iso-Propyl steht;
 R²⁷ für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, iso-Propyl und n-Propyl steht und
 R²⁸ für einen Phenyl-Rest steht;
 jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0028] Ganz besonders bevorzugt sind substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin Ver-

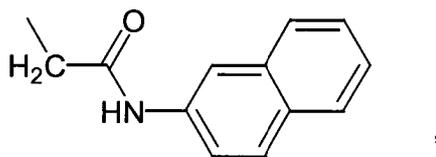
bindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, worin

R¹ für -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅,

für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus



für den folgenden Rest



für einen ggf. substituierten Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, -CH₂-CH₂-CN, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -CH(CH₃)-CH(CH₃)₂ und -CH₂-CH₂-C(CH₃)₃,

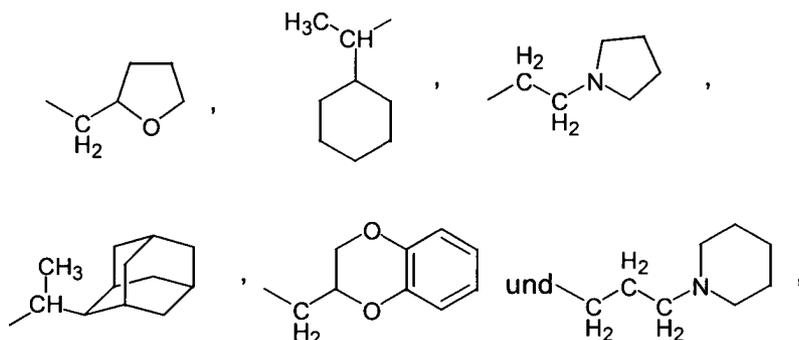
für einen Alkenyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus 1-Propenyl und 2-Propenyl,

für einen cycloaliphatischen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyclopentyl, Cyclohexyl, (6,6)-Dimethyl-[3.1.1]-bicycloheptyl, Adamantyl (Tricyclo-[3.3.1.1^{3,7}]-decanyl), Indanyl und Indenyl, wobei der cycloaliphatische Rest jeweils mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, Methyl, Ethyl, n-Propyl und -O-Benzyl substituiert sein kann,

für einen Pyrrolidiny-Rest, der mit einem -(CH₂)-Benzo[b]furanyl- oder Benzyl-Rest substituiert sein kann, wobei der zyklische Teil des Benzyl-Rests mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, -OH, -CF₃, -O-CH₃, -O-C₂H₅, Phenyl und -O-Benzyl substituiert sein kann,

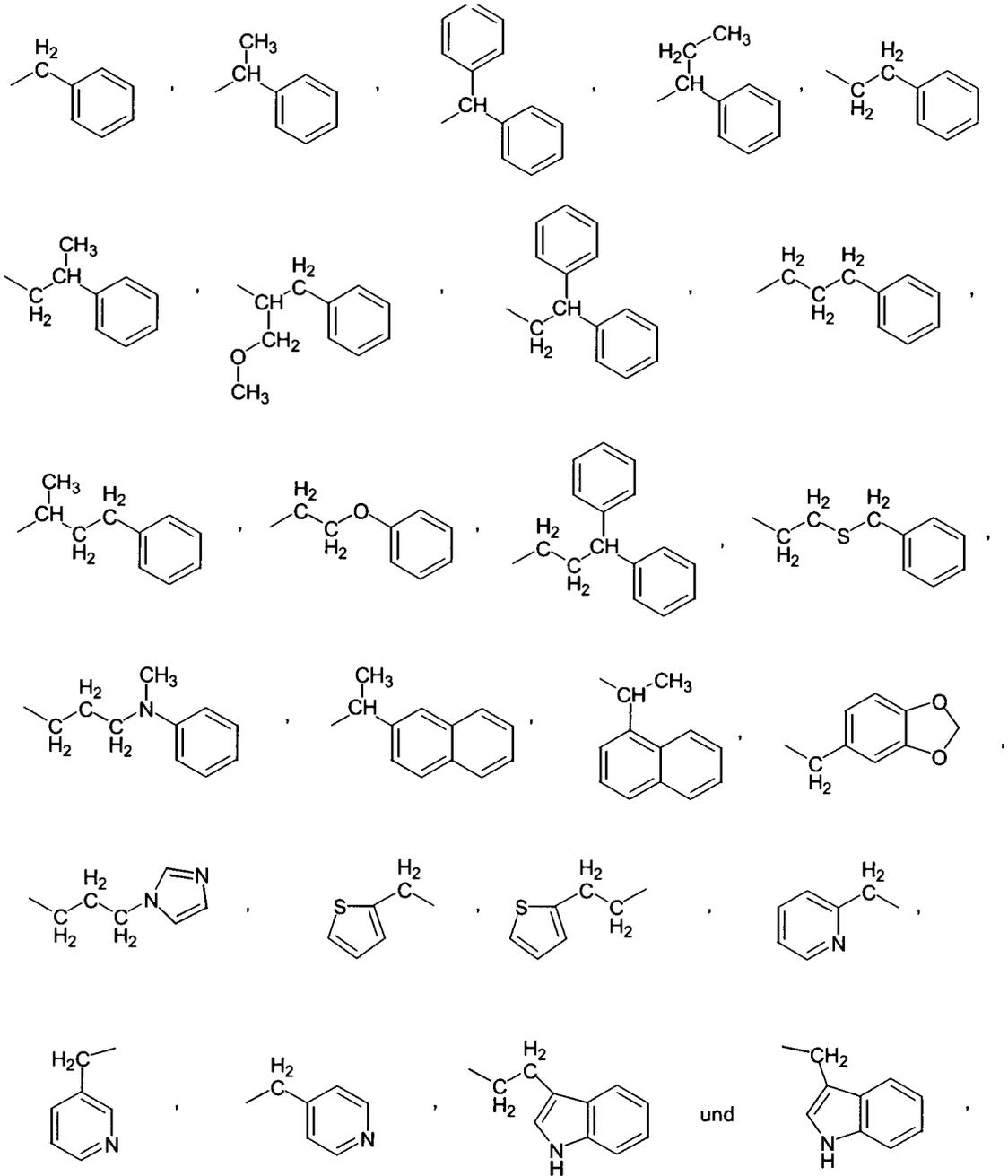
für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl und (1,4)-Benzodioxanyl, wobei der Rest jeweils mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -O-Phenyl, -O-Benzyl, -NH-C(=O)-O-CH₃, -NH-C(=O)-O-C₂H₅ und -NH-C(=O)-O-C(CH₃)₃ substituiert sein kann,

für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus



wobei jeweils der (hetero)cycloaliphatische Teil mit 1 oder 2 Substituenten unabhängig voneinander ausge-

wählt aus der Gruppe bestehend Methyl, Ethyl, iso-Propyl und n-Propyl substituiert sein kann, oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus



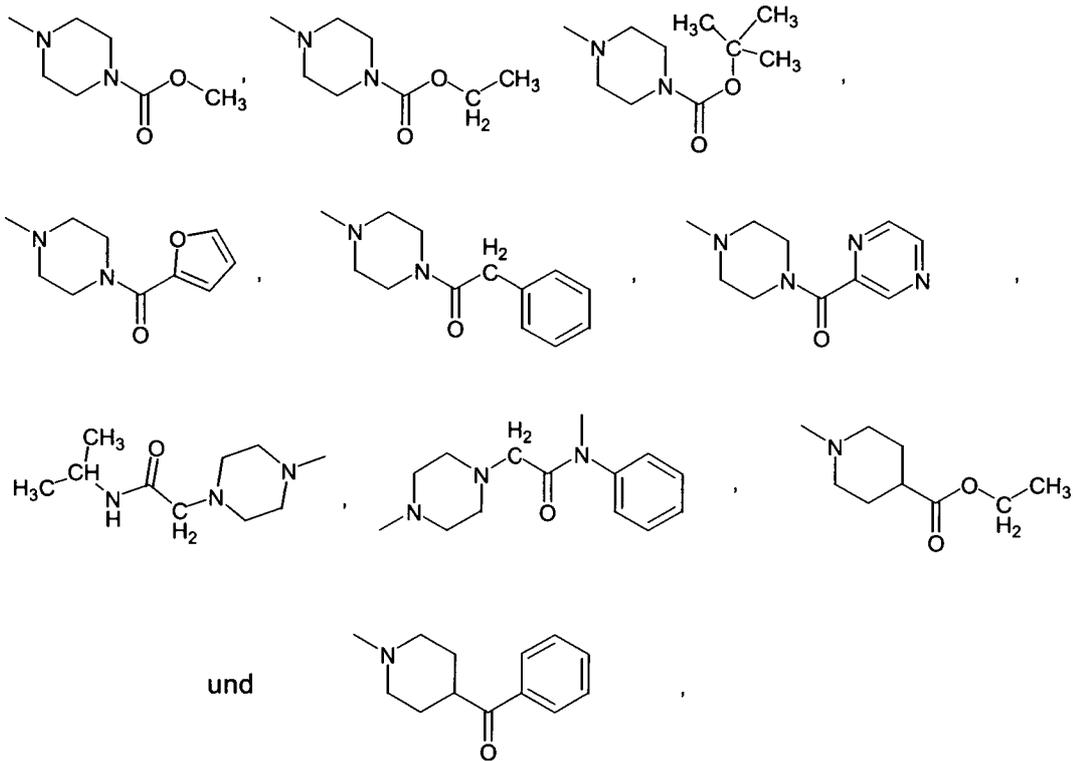
wobei jeweils der (hetero)aromatische Teil mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, $-\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{CH}_3$, $-\text{O}-\text{C}_2\text{H}_5$, $-\text{O}-\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{Phenyl}$, $-\text{O}-\text{Benzyl}$, $-\text{NH}_2$, $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$, $-\text{N}(\text{H})(\text{CH}_3)$ und $-\text{N}(\text{H})(\text{C}_2\text{H}_5)$ substituiert sein kann, steht

R^2 für einen Wasserstoff-Rest,

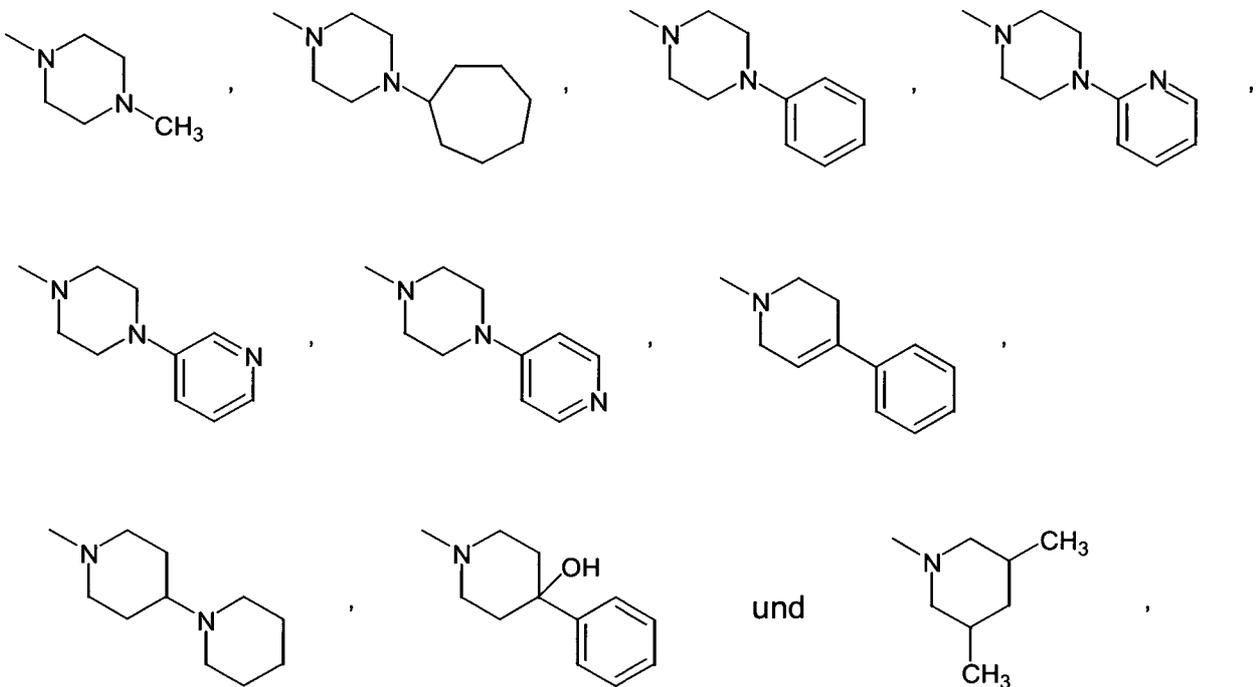
für einen Benzyl-Rest, der 1-, 2- oder 3-fach mit $-\text{O}-\text{CH}_3$ substituiert sein kann,

oder für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl steht, oder

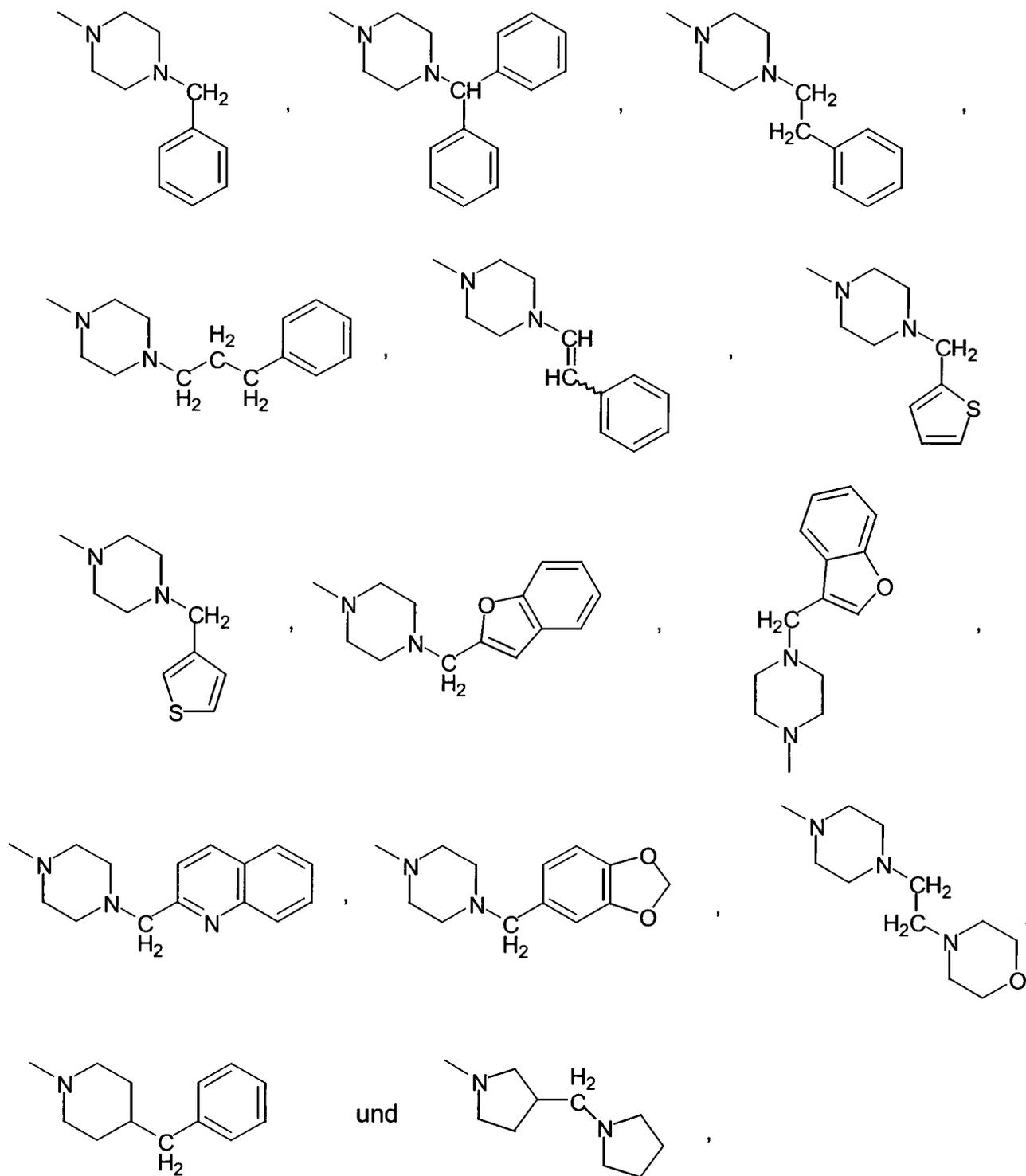
R^1 und R^2 zusammen mit dem sie verbindenden Stickstoffatom als Ringglied einen Rest bilden ausgewählt aus der Gruppe aus



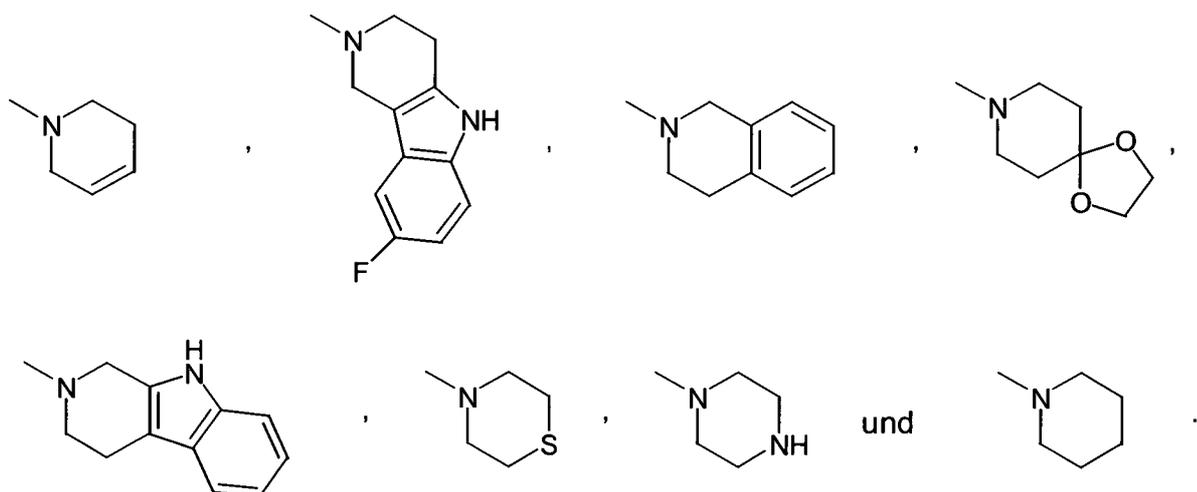
wobei jeweils ggf. der (hetero)aromatische Teil der vorstehend genannten Reste mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl und iso-Propyl substituiert sein kann,
 oder R¹ und R² zusammen mit dem sie verbindenden Stickstoffatom als Ringglied einen Rest bilden ausgewählt aus der folgenden Gruppe



wobei jeweils der (hetero)aromatische Teil der vorstehend genannten Reste mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, F, Cl, Br, -CF₃, -OH, -O-CH₃ und -O-C₂H₅ substituiert sein kann,
 oder R¹ und R² zusammen mit dem sie verbindenden Stickstoffatom als Ringglied einen Rest bilden ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus

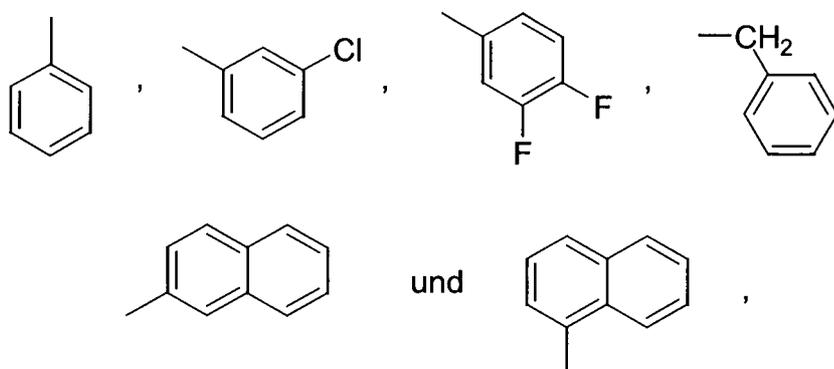


wobei jeweils der (hetero)aromatische Teil der vorstehend genannten Reste mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, F, Cl, Br, -OH, -O-CH₃ und -O-C₂H₅ substituiert sein kann, oder R¹ und R² zusammen mit dem sie verbindenden Stickstoffatom als Ringglied einen Rest bilden ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus



R³ für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl steht;

R⁴ für einen Rest steht, der ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus



jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0029] Noch weiter bevorzugt sind substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der allgemeinen Formel I ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus

- [1] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-thiophen-2-yl-ethyl)-amid,
- [2] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(2,5-dimethoxy-phenyl)-ethyl]-amid,
- [3] N-{3-[4-(2-Ethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,
- [4] 2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [3-(2-methyl-piperidin-1-yl)-propyl]-amid,
- [5] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-phenyl-propyl)-amid,
- [6] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-pyrrolidin-1-yl-ethyl)-amid,
- [7] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure ethyl-pyridin-4-ylmethyl-amid,
- [8] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-thiophen-2-yl-ethyl)-amid,
- [9] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3-imidazol-1-yl-propyl)-amid,
- [10] 3-Chlor-N-{3-[4-(3-chlor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,
- [11] 3-Chlor-N-methyl-N-[3-(4-phenyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyri-

din-2-yl]-benzamid,

[12] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure indan-1-ylamid,

[13] N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(2-morpholin-4-yl-ethyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,

[14]

3-Chlor-N-methyl-N-{3-[4-(3-trifluormethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,

[15] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3,5-bis-trifluormethyl-benzylamid,

[16] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-methyl-cyclohexyl)-amid,

[17] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-methoxy-benzylamid,

[18] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-p-tolyl-ethyl)-amid,

[19] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1,2-dimethyl-propyl)-amid,

[20] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-methyl-cyclohexyl)-amid,

[21] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-phenyl-propyl)-amid,

[22] 4-[2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl]-piperazin-1-carbonsäure ethyl ester,

[23]

3-Chlor-N-methyl-N-(3-{4-[(methyl-phenyl-carbamoyl)-methyl]-piperazin-1-carbonyl}-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-benzamid,

[24] 3-Chlor-N-{3-[4-(furan-2-carbonyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,

[25] N-Methyl-N-[3-(4-p-tolyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,

[26] N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(3-phenyl-propyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,

[27] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,6,6-trimethyl-bicyclo[3.1.1]hept-3-yl)-amid,

[28] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3-phenyl-propyl)-amid,

[29] Naphthalen-1-carbonsäure {3-[4-(4-methoxy-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-methylamid,

[30] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(4-trifluormethyl-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid,

[31] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-ethyl-phenyl)-amid,

[32] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3-methoxy-benzyl)-(tetrahydro-furan-2-ylmethyl)-amid,

[33] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,3-dichlor-benzylamid,

[34] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-benzofuran-2-ylmethyl-pyrrolidin-3-yl)-methylamid,

[35] 3-Chlor-N-{3-[4-(4-chlor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,

[36]

2-({2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-3-(1H-indol-3-yl)-propionsäure methyl ester,

[37] N-Butyl-3-chlor-N-[3-(4-phenylacetyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,

[38]

2-({2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-3-methyl-pentansäure-tert-butyl ester,

[39] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-naphtha-

len-1-yl-ethyl)-amid,

[40] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure allyl-methyl-amid,

[41] N-Butyl-N-[3-(3,6-dihydro-2H-pyridin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-3,4-difluor-benzamid,

[42] 2-({2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-4-methyl-pentansäure-benzyl ester,

[43] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-ethoxy-benzylamid,

[44]

N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(5-methyl-pyrazin-2-carbonyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,

[45]

N-[3-(4-Benzo[1,3]dioxol-5-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-3-chlor-N-methyl-benzamid,

[46] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,2-diphenyl-ethyl)-amid,

[47] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-difluor-benzylamid,

[48] N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(2-fluor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,

[49] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-p-tolyl-ethyl)-amid,

[50] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (pyridin-2-ylmethyl)-amid,

[51] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-trifluormethyl-benzylamid,

[52] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure indan-1-ylamid,

[53] 3-Chlor-N-methyl-N-[3-(4-chinolin-2-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,

[54] N-Butyl-3,4-difluor-N-[3-(4-methyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,

[55] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-difluor-benzylamid,

[56] N-[3-(4-Benzhydnl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-butyl-3,4-difluor-benzamid,

[57]

4-Methyl-2-({2-[methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-pentansäure-benzyl ester,

[58] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-pyrrolidin-1-yl-ethyl)-amid,

[59] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2-benzyloxy-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid,

[60] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (pyridin-3-ylmethyl)-amid,

[61]

3-Chlor-N-{3-[4-(4-fluor-phenyl)-3,6-dihydro-2H-pyridin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,

[62] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure cyclohexylamid,

[63] N-[3-(4-Cycloheptyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-methyl-benzamid,

[64] Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(4-thiophen-3-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid,

[65] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-dimethoxy-benzylamid,

[66] 1-[2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl]-piperidin-4-carbonsäure ethyl ester,

[67] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-benzyloxy-benzyl)-amid,

- loxy-cyclohexyl)-amid,
 [68] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(4-phenoxy-phenyl)-ethyl]-amid,
 [69] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(7-methyl-1H-indol-3-yl)-ethyl]-amid,
 [70] Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(4-phenyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid,
 [71] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(3-trifluormethyl-phenyl)-ethyl]-amid,
 [72] N-Butyl-3-chlor-N-[3-(4-pyridin-2-yl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,
 [73] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-methoxy-benzylamid,
 [74] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-difluor-benzylamid,
 [75] 3-Chlor-N-methyl-N-[3-(4-pyridin-2-yl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,
 [76] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-biphenyl-4-ylmethyl-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid,
 [77] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,3-dihydro-benzo[1,4]dioxin-2-ylmethyl)-amid,
 [78] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(1-N-indol-3-yl)-ethyl]-methyl-amid,
 [79] N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(3-trifluormethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,
 [80] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(1H-indol-3-yl)-ethyl]-methyl-amid,
 [81] 3-Chlor-N-{3-[4-hydroxy-4-(3-trifluormethyl-phenyl)-piperidin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,
 [82] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-methoxymethyl-2-phenyl-ethyl)-amid,
 [83] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2,6-dichlor-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid,
 [84] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2-brom-4,5-dimethoxy-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid,
 [85] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure benzo[1,3]dioxol-5-ylamid,
 [86] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-methoxymethyl-2-phenyl-ethyl)-amid,
 [87] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2,6-dichlor-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-amid,
 [88] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-trifluor-methoxy-benzylamid,
 [89] N-Butyl-3,4-difluor-N-{3-[4-(isopropylcarbamoyl-methyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,
 [90] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-methyl-3-phenyl-propyl)-amid,
 [91] 2-({2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-3-methyl-buttersäurebenzylester,
 [92] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (thiophen-2-ylmethyl)-amid,
 [93] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-methyl-cyclohexyl)-amid,
 [94] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure benzyl-methyl-amid,
 [95] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(2,6-di-

chlor-benzylsulfanyl)-ethyl]-amid,

[96] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,3-dihydro-benzo[1,4]dioxin-2-ylmethyl)-amid,

[97] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 4-trifluor-methyl-benzylamid,

[98] N-[3-(4-Benzyl-piperidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-methyl-benzamid,

[99] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-trifluormethoxy-benzylamid,

[100] 3-Chlor-N-{3-[4-(2,5-dimethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,

[101] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2,6-dichlor-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid,

[102] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-chlor-6-methyl-benzylamid,

[103] N-Butyl-3-chlor-N-[3-(3,5-dimethyl-piperidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,

[104] 2-({2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-3,3-dimethyl-buttersäure tert-butylester,

[105] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-cyclohexyl-ethyl)-amid,

[106] 3-Chlor-N-methyl-N-[3-(4-phenethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,

[107] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-phenoxy-ethyl)-amid,

[108] Naphthalen-1-carbonsäure [3-(4-benzofuran-2-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-methylamid,

[109] N-[3-([1,4']Bipiperidinyl-1'-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-butyl-3-chlor-benzamid,

[110]

N-Butyl-3-chlor-N-[3-(8-fluor-1,3,4,5-tetrahydro-pyrido[4,3-b]indol-2-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,

[111] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 4-dimethylamino-benzylamid,

[112] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-methyl-3-phenyl-propyl)-amid,

[113] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-methyl-benzylamid,

[114] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,3-dihydro-benzo[1,4]dioxin-6-yl)-amid,

[115] Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(4-chinolin-2-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid,

[116] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-cyano-ethyl)-methylamid,

[117] 2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-p-tolyl-ethyl)-amid,

[118] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(4-fluor-phenyl)-ethyl]-amid,

[119]

N-Butyl-N-{3-[4-(5-chlor-2-methyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-3,4-difluor-benzamid,

[120] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure cyclohexylamid,

[121] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (benzo[1,3]dioxol-5-ylmethyl)-amid,

[122] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-methoxy-benzylamid,

[123] 3-tert-Butoxy-2-({2-[(3-chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-buttersäure methyl ester,

[124] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-benzylo-

- xy-cyclohexyl)-amid,
- [125] N-{3-[4-(4-Fluor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,
- [126] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (naphthalen-2-yl-carbamoylmethyl)-amid,
- [127] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 4-trifluor-methoxy-benzylamid,
- [128] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3,3-di-phenyl-propyl)-amid,
- [129] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-ben-zyloxy-phenyl)-amid,
- [130] N-{3-[4-(5-Brom-2-ethoxy-benzyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-2-phenyl-acetamid,
- [131] N-[3-(3,4-Dihydro-1H-isochinolin-2-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-methyl-benzamid,
- [132] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-phenyl-propyl)-amid,
- [133] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,3-dime-thyl-benzylamid,
- [134] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(4-phen-oxo-phenyl)-ethyl]-amid,
- [135] N-{3-[4-(4-Ethoxy-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-2-phenyl-acetamid,
- [136] Naphthalen-1-carbonsäure {3-[4-(2-ethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imida-zo[1,2-a]pyridin-2-yl}-methyl-amid,
- [137] N-[3-(4-Benzo[1,3]dioxol-5-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-butyl-3,4-difluor-benzamid,
- [138] N-Butyl-N-{3-[4-(2,5-dimethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-3,4-difluor-benzamid,
- [139] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [(4-chlor-phenyl)-phenyl-methyl]-amid,
- [140] N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(4-chlor-benzyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo(1,2-a]pyri-din-2-yl}-benzamid,
- [141] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-naph-thalen-2-yl-ethyl)-amid,
- [142] 2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-fluor-ben-zylamid,
- [143] N-[3-(1,4-Dioxa-8-aza-spiro[4.5]decane-8-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyri-din-2-yl]-N-methyl-2-phenyl-acetamid,
- [144] Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(1,3,4,9-tetrahydro-b-carbolin-2-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahy-dro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid,
- [145] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-me-thyl-3-phenyl-propyl)-amid,
- [146] 3-Chlor-N-methyl-N-{3-[4-(2,4,6-trimethoxy-benzyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,
- [147] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure benzhy-dryl-amid,
- [148] Naphthalen-1-carbonsäure {3-[4-(2-chlor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imida-zo[1,2-a]pyridin-2-yl}-methyl-amid,
- [149] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (thio-phen-2-ylmethyl)-amid,
- [150] N-Butyl-N-{3-[4-(4-chlor-benzyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyri-din-2-yl}-3,4-difluor-benzamid,
- [151] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3-phenyl-pro-pyl)-amid,
- [152] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo(1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-tert-bu-

- tyl-phenyl)-amid,
 [153] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-ethyl-phenyl)-amid,
 [154] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure cyclohexylamid,
 [155] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [3-(methyl-phenyl-amino)-propyl]-amid,
 [156] 2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(3-trifluor-methyl-phenyl)-ethyl]-amid,
 [157] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 4-chlor-benzyla-mid,
 [158] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-flu-or-benzylamid,
 [159] 2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure p-tolylamid,
 [160] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-pheno-xy-ethyl)-amid,
 [161] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-ben-zyloxy-cyclohexyl)-amid,
 [162] Naphthalen-1-carbonsäure {3-[4-(4-fluor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imida-zo[1,2-a]pyridin-2-yl}-methyl-amid,
 [163] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2- a]pyridin-3-carbonsäure [2-(4-chlor-phenyl)-propyl]-amid,
 [164] N-Butyl-3,4-difluor-N-[3-(thiomorpholin-4-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyri-din-2-yl]-benzamid,
 [165] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carboxylsäure (1-ada-mantan-1-yl-ethyl)-amid,
 [166] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [(4-chlor-phe-nyl)-phenyl-methyl]-amid,
 [167] N-Methyl-N-{3-[4-(4-trifluormethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]py-ridin-2-yl}-benzamid,
 [168] 2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-biphe-nyl-4-ylmethyl-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid,
 [169] N-[3-(4-Benzoyl-piperidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-3-chlor-N-me-thyl-benzamid,
 [170] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-tert-butyl-phenyl)-amid,
 [171] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3,3-di-methyl-butyl)-amid,
 [172] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2-brom-4,5-dimethoxy-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid,
 [173] Naphthalen-1-carbonsäure methyl-{3-[4-(3-phenyl-allyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imi-dazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-amid,
 [174] Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(4-phenethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imida-zo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid,
 [175] N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-hydroxy-4-(3-trifluormethyl-phenyl)-piperidin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidaz-o[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,
 [176] N-Methyl-2-phenyl-N-{3-[4-(3-phenyl-propyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imida-zo[1,2-a]pyridin-2-yl}-acetamid,
 [177] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-fluor-benzyla-mid,
 [178] N-Butyl-N-{3-[4-(2-chlor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyri-din-2-yl}-3,4-difluor-benzamid,
 [179] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2- a]pyridin-3-carbonsäure benzo[1,3]dioxol-5-ylamid,
 [180] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3,3-di-phenyl-propyl)-amid,
 [181] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,3-dihy-dro-benzo[1,4]dioxin-6-yl)-amid,
 [182] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(3,4-dimetho-

xy-phenyl)-ethyl]-amid,

[183] Naphthalen-1-carbonsäure [3-(4-benzoyl-piperidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-methyl-amid,

[184] 4-Methyl-2-({2-[methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-valeriansäure tert-butylester,

[185] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-phenoxy-phenyl)-amid,

[186] N-Methyl-2-phenyl-N-[3-(4-phenyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-acetamid,

[187]

N-Butyl-3,4-difluor-N-{3-[4-(5-trifluormethyl-pyridin-2-yl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,

[188] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-dichlor-6-methyl-benzylamid,

[189] [4-({2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-phenyl]-carbaminsäure tert-butyl ester,

[190] N-Methyl-2-phenyl-N-[3-(2-pyrrolidin-1-ylmethyl-pyrrolidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-acetamid

und

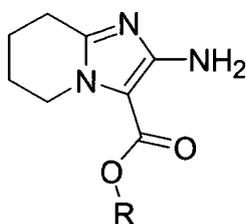
[191] 4-[2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl]-piperazin-1-carbonsäure tert-butyl ester,

jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

[0030] Ebenfalls bevorzugt sind erfindungsgemäße substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der allgemeinen Formel I, die im FLIPR-Assay in einer Konzentration von 10 μM eine Hemmung des Ca^{2+} -Ionen-Einstroms in Dorsalwurzelganglien von Ratten von wenigstens 30 %, bevorzugt von wenigstens 50 %, besonders bevorzugt von wenigstens 70 %, ganz besonders bevorzugt von wenigstens 80 %, noch weiter bevorzugt von wenigstens 90 %, im Vergleich zur maximal erreichbaren Hemmung des Ca^{2+} -Ionen-Einstroms mit Capsaicin in einer Konzentration von 10 μM aufweisen.

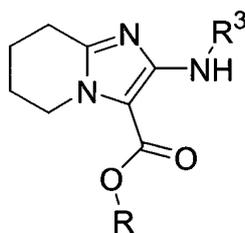
[0031] Dabei wird Im FLIPR-Assay der Ca^{2+} -Einstrom mit Hilfe eines Ca^{2+} -sensitiven Farbstoffs (Typ Fluo-4, Molecular Probes Europe BV, Leiden Niederlande) im Fluorescent Imaging Plate Reader (FLIPR, Molecular Devices, Sunnyvale, USA) quantifiziert, wie untenstehend beschrieben.

[0032] Ein weiterer Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist ein Verfahren zur Herstellung von erfindungsgemäßen Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I gemäß dem wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel II,



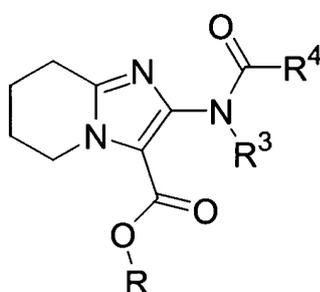
II

worin R für einen linearen oder verzweigten C_{1-6} -Alkyl-Rest, vorzugsweise für einen Methyl- oder Ethyl-Rest steht, in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens eines Reduktionsmittels, ggf. in Gegenwart wenigstens einer organischen Säure, vorzugsweise in Gegenwart von Essigsäure, mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel $\text{R}^3\text{-C(=O)-H}$, worin R^3 die vorstehend genannte Bedeutung mit Ausnahme des Wasserstoff-Restes hat, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel III,



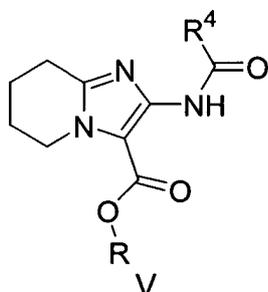
III

worin R die vorstehend genannte Bedeutung und R³ die vorstehend genannte Bedeutung mit Ausnahme des Wasserstoff-Restes haben, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird und wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel III in einem Reaktionsmedium ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel R⁴-C(=O)-X, worin R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung hat und X für eine Abgangsgruppe, vorzugsweise für einen Halogen-Rest, besonders bevorzugt für ein Chlor- oder Bromatom steht, oder in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens eines Kupplungsreagenzes ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit einer Verbindung der allgemeinen Formel R⁴-C(=O)-OH, worin R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung hat, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel IV,



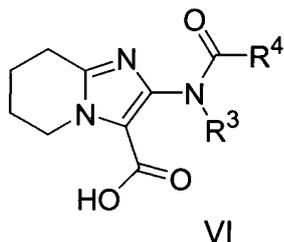
IV

worin R und R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung haben und R³ die vorstehend genannte Bedeutung mit Ausnahme des Wasserstoff-Restes hat, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird, oder wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel II, worin R die vorstehend genannte Bedeutung hat, in einem Reaktionsmedium ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel R⁴-C(=O)-X, worin R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung hat und X für eine Abgangsgruppe, vorzugsweise für einen Halogen-Rest, besonders bevorzugt für ein Chlor- oder Bromatom steht, oder in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens eines Kupplungsreagenzes ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit einer Verbindung der allgemeinen Formel R⁴-C(=O)-OH, worin R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung hat, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel V,

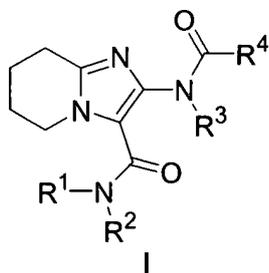


worin R und R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung haben, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird und wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel V in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens einer Base, vorzugsweise wenigstens eines Metallhydrids, mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel R³-X, worin R³ die vorstehend genannte Bedeutung mit Ausnahme des Wasserstoff-Restes hat und X für eine Abgangsgruppe, vorzugsweise für einen Halogen-Rest, besonders bevorzugt für ein Chlor- oder Bromatom steht, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel IV, worin R, R³ und R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung haben wobei R³ nicht gleich Wasserstoff ist, umgesetzt wird und diese ggf.

gereinigt und/oder isoliert wird,
und wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel IV in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens einer Base, vorzugsweise in Gegenwart wenigstens eines Metallhydroxids, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel VI,



worin R^3 die vorstehend genannte Bedeutung mit Ausnahme des Wasserstoff-Restes hat und R^4 die vorstehend genannte Bedeutung hat, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird und wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel VI in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens eines Kupplungsreagenzes ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel HNR^1R^2 , worin R^1 die vorstehend genannte Bedeutung hat und R^2 für Wasserstoff steht, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel I,



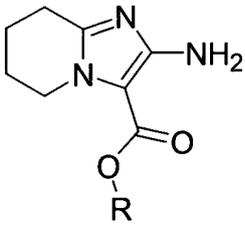
worin R^3 die vorstehend genannte Bedeutung mit Ausnahme des Wasserstoff-Restes hat, R^1 und R^4 die vorstehend genannte Bedeutung haben und R^2 für Wasserstoff steht, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird

und ggf. wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel I, worin R^3 die vorstehend genannte Bedeutung mit Ausnahme des Wasserstoff-Restes hat, R^1 und R^4 die vorstehend genannte Bedeutung haben und R^2 für Wasserstoff steht, in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens einer Base, vorzugsweise eines Metallhydrids, mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel R^2-X , worin R^2 die vorstehend genannte Bedeutung mit Ausnahme des Wasserstoff-Restes hat und X für eine Abgangsgruppe, vorzugsweise einen Halogen-Rest, besonders bevorzugt für ein Chlor- oder Bromatom steht, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel I, worin R^1 und R^4 die vorstehend genannte Bedeutung haben sowie R^2 und R^3 die vorstehend genannte Bedeutung mit Ausnahme des Wasserstoff-Restes haben, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird

oder

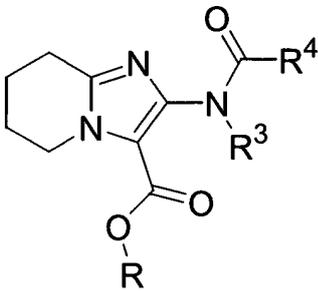
wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel VI in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens eines Kupplungsreagenzes ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel HNR^1R^2 , worin R^1 und R^2 die vorstehend genannte Bedeutung mit Ausnahme des Wasserstoff-Restes haben, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel I, worin R^1 , R^2 und R^3 die vorstehend genannte Bedeutung mit Ausnahme des Wasserstoff-Restes haben und R^4 die vorstehend genannte Bedeutung hat, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird.

[0033] Ein weiterer Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist ein Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I gemäß dem wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel II,



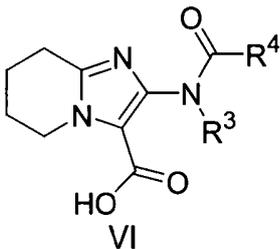
II

worin R für einen linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl-Rest, vorzugsweise für einen Methyl- oder Ethyl-Rest steht, in einem Reaktionsmedium ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel R⁴-C(=O)-X, worin R⁴ die Bedeutung die vorstehend genannte Bedeutung hat und X für eine Abgangsgruppe, vorzugsweise für einen Halogen-Rest, besonders bevorzugt für ein Chlor- oder Bromatom steht, oder in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens eines Kupplungsreagenzes ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit einer Verbindung der allgemeinen Formel R⁴-C(=O)-OH, worin R⁴ die Bedeutung vorstehend genannte Bedeutung hat, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel IV,



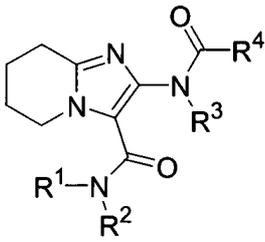
IV

worin R und R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung haben und R³ gleich Wasserstoff ist, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird, und wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel IV in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens einer Base, vorzugsweise in Gegenwart wenigstens eines Metallhydroxids, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel VI,



VI

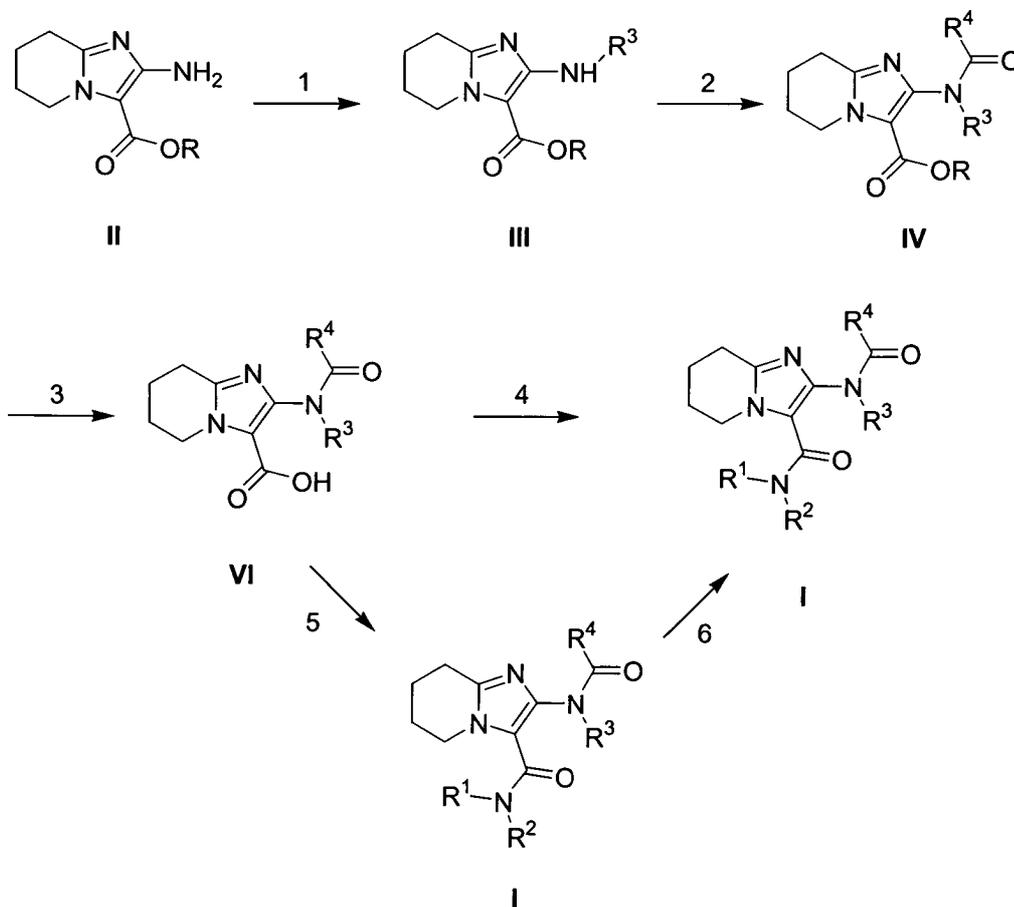
worin R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung hat und R³ gleich Wasserstoff ist, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/isoliert wird, und wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel VI in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens eines Kupplungsreagenzes ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel HNR¹R², worin R¹ und R² die vorstehend genannte Bedeutung haben, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel I,



I

worin R^1 , R^2 und R^4 die vorstehend genannte Bedeutung haben und R^3 gleich Wasserstoff ist, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird.

[0034] Die erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung substituierter 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I sind auch in den nachfolgenden Schemata 1 bis 3 wiedergegeben.



Schema 1

[0035] In Stufe 1 werden Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel II mit Aldehyden der allgemeinen Formel $R^3-C(=O)-H$, worin R^3 die vorstehend genannte Bedeutung mit Ausnahme des Wasserstoff-Restes hat, in einem Reaktionsmedium, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Diethylether, Tetrahydrofuran, Methanol, Ethanol, Dichlormethan, Dichlorethan, Chloroform, Toluol und entsprechenden Mischungen, unter Zusatz eines Reduktionsmittels, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Natriumborhydrid, Natriumacetoxyborhydrid oder Natriumcyanoborhydrid, ggf. in Gegenwart wenigstens einer organischen Säure, vorzugsweise in Gegenwart von Essigsäure, bei Temperaturen von vorzugsweise -70°C bis 100°C zu Verbindungen der allgemeinen Formel III umgesetzt.

[0036] In Stufe 2 werden Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel III mit Carbonsäuren der allgemeinen Formel $R^4-C(=O)-OH$, worin R^4 die vorstehend genannte Bedeutung hat, in einem Reak-

tionsmedium, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Diethylether, Tetrahydrofuran, Acetonitril, Methanol, Ethanol, Dimethylformamid, Dichlormethan und entsprechenden Mischungen, ggf. in Gegenwart wenigstens eines Kupplungsreagenzes, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus 1-Benzotriazolyl-oxo-tris-(dimethylamino)-phosphonium hexafluorophosphat (BOP), Dicyclohexylcarbodiimid (DCC), N'-(3-Dimethylaminopropyl)-N-ethylcarbodiimid (EDCI), N-[(Dimethylamino)-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]pyridino-1-ylmethyl]-N-methylmethanaminium hexafluorophosphat N-oxid (HATU), O-(Benzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetramethyluronium hexafluorophosphat (HBTU) und 1-Hydroxy-7-azabenzotriazol (HOAt), ggf. in Gegenwart wenigstens einer anorganischen Base, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Kaliumcarbonat und Cäsiumcarbonat, oder wenigstens einer organischen Base, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Triethylamin, Pyridin, Dimethylaminopyridin und Diisopropylethylamin vorzugsweise bei Temperaturen von -70°C bis 100°C zu Verbindungen der allgemeinen Formel IV umgesetzt.

[0037] Alternativ werden Verbindungen der allgemeinen Formel III mit Carbonsäurederivaten bzw. Kohlen-säurederivaten der allgemeinen Formel $\text{R}^4\text{-C(=O)-X}$, wobei R^4 die vorstehend genannte Bedeutung hat und X für einen Halogen-Rest, vorzugsweise Chlor oder Brom, steht, in einem Reaktionsmedium, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Diethylether, Tetrahydrofuran, Acetonitril, Methanol, Ethanol, Dimethylformamid, Dichlormethan und entsprechenden Mischungen, ggf. in Gegenwart wenigstens einer organischen Base, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Triethylamin, Dimethylaminopyridin, Pyridin und Diisopropylamin, oder wenigstens einer anorganischen Base bei Temperaturen von vorzugsweise -70°C bis 100°C zu Verbindungen der allgemeinen Formel IV umgesetzt.

[0038] Ebenfalls können Verbindungen der allgemeinen Formel II mit Carbonsäuren der allgemeinen Formel $\text{R}^4\text{-C(=O)-OH}$ oder Verbindungen der allgemeinen Formel $\text{R}^4\text{-C(=O)-X}$, wie vorstehend in Stufe 2 beschrieben, zu Verbindungen der allgemeinen Formel IV, worin R und R^4 die vorstehend genannte Bedeutung haben und R^3 gleich Wasserstoff ist, umgesetzt werden.

[0039] In Stufe 3 werden Verbindungen der allgemeinen Formel IV in einem geeigneten Reaktionsmedium, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Dioxan, Tetrahydrofuran, Diethylether, Methanol, Ethanol, Isopropanol, Wasser und entsprechenden Mischungen, unter Zusatz wenigstens einer anorganischen Base, vorzugsweise unter Zusatz wenigstens eines Metallhydroxids, beispielsweise Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid oder Lithiumhydroxid, bei Temperaturen von vorzugsweise 0°C bis 30°C zu Verbindungen der allgemeinen Formel VI umgesetzt. Vorzugsweise erfolgt die Reaktion in einem Reaktionsmedium, das aus Methanol, Dioxan und einer 4 M Natriumhydroxid-Lösung in Wasser mit einem Verhältnis der entsprechenden Volumina von 15:4:1 besteht.

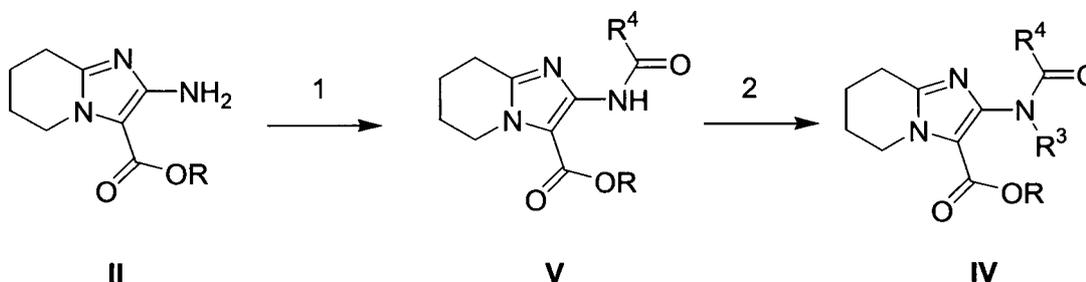
[0040] In Stufe 4 werden Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel VI mit Aminen der allgemeinen Formel HNR^1R^2 , worin R^1 und R^2 die vorstehend genannte Bedeutung haben, in einem Reaktionsmedium, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Diethylether, Tetrahydrofuran, Acetonitril, Methanol, Ethanol, Dimethylformamid, Dichlormethan und entsprechenden Mischungen, ggf. in Gegenwart wenigstens eines Kupplungsreagenzes, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus 1-Benzotriazolyl-oxo-tris-(dimethylamino)-phosphonium hexafluorophosphat (BOP), Dicyclohexylcarbodiimid (DCC), N'-(3-Dimethylaminopropyl)-N-ethylcarbodiimid (EDCI), N-[(Dimethylamino)-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]pyridino-1-ylmethyl]-N-methylmethanaminium hexafluorophosphat N-oxid (HATU), O-(Benzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetramethyluronium hexafluorophosphat (HBTU) und 1-Hydroxy-7-azabenzotriazol (HOAt), ggf. in Gegenwart wenigstens einer anorganischen Base, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Kaliumcarbonat und Cäsiumcarbonat, oder einer organischen Base, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Triethylamin, Pyridin, Dimethylaminopyridin und Diisopropylethylamin vorzugsweise bei Temperaturen von -70°C bis 100°C zu Verbindungen der allgemeinen Formel I umgesetzt.

[0041] In Stufe 5 werden Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel VI mit Aminen der allgemeinen Formel HNR^1R^2 , worin R^1 die vorstehend genannte Bedeutung hat und R^2 für Wasserstoff steht, mit den Methoden wie vorstehend in Schema 1, Stufe 4 beschrieben zu Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin R^1 , R^3 und R^4 die vorstehend genannte Bedeutung haben, R^3 nicht gleich Wasserstoff ist und R^2 für Wasserstoff steht, umgesetzt.

[0042] In Stufe 6 werden Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin R^1 , R^3 und R^4 die vorstehend genannte Bedeutung haben, R^3 nicht gleich Wasserstoff ist und R^2 für Wasserstoff steht, mit Verbindungen der allgemeinen Formel $\text{R}^2\text{-X}$, worin R^2 die vorstehend genannte Bedeutung hat und nicht gleich Wasserstoff ist und X für einen Halogen-Rest, bevorzugt Chlor, steht, in einem Reaktionsmedium, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Dimethylformamid, Heptan, Hexan, Toluol, Tetrahydrofuran, Diethylether und entspre-

chenden Mischungen, unter Zusatz wenigstens eines Metallhydrids, vorzugsweise unter Zusatz wenigstens eines Metallhydridsalzes ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Lithiumhydrid, bei Temperaturen von vorzugsweise 0 °C bis 40 °C zu Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin R¹, R², R³ und R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung haben wobei R² und R³ nicht gleich Wasserstoff sind, umgesetzt.

[0043] Die Verbindungen der allgemeinen Formel IV lassen sich ebenfalls wie in Schema 2 beschrieben erhalten.

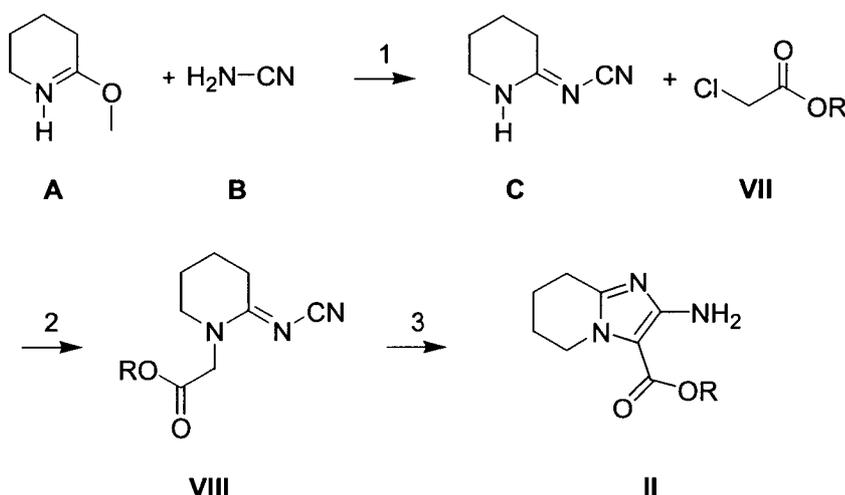


Schema 2

[0044] In Stufe 1 werden Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel II mit Carbonsäuren der allgemeinen Formel R⁴-C(=O)-OH, worin R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung hat, oder mit Carbonsäurederivaten bzw. Kohlensäurederivaten der allgemeinen Formel R⁴-C(=O)-X, wobei R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung hat und X für einen Halogen-Rest, vorzugsweise Chlor oder Brom, steht, mit den gleichen Methoden, wie unter Schema 1, Stufe 2, beschrieben, zu Verbindungen der allgemeinen Formel V umgesetzt.

[0045] In Stufe 2 werden Verbindungen der allgemeinen Formel V mit Verbindungen der allgemeinen Formel R³-X, worin R³ die vorstehend genannte Bedeutung hat und nicht gleich Wasserstoff ist und X für einen Halogen-Rest, bevorzugt Chlor, steht, mit den gleichen Methoden, wie unter Schema 1, Stufe 6, beschrieben, zu Verbindungen der allgemeinen Formel IV umgesetzt.

[0046] Die Verbindungen der allgemeinen Formel II lassen sich wie in Schema 3 beschrieben erhalten.



Schema 3

[0047] In Stufe 1 wird 6-Methoxy-2,3,4-5-tetrahydropyridin (A) in einem Reaktionsmedium, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methanol, Ethanol und Isopropanol, mit Cyanamid B vorzugsweise bei einer Temperatur von 0°C bis 30 °C zur gewünschten Verbindung Piperidin-2-yliden-cyanamid (C) umgesetzt. 6-Methoxy-2,3,4-5-tetrahydropyridin (A) wurde gemäß den Referenzen „Product class 18: pyridopyridazines; Sako, M.; Science of Synthesis 2004, 1109–1153“; „Synthesis of pyrido[4,3-d]pyrimidin-5(6H)-ones via anionic cycloaddition of methyl-2,4-dimethoxy-6-methyl-5-pyrimidinecarboxylate with imines; Wada, A. et al.; Chemical and Pharmaceutical Bulletin 1991, 1189–1192“ und „Reaction of lactim ethers with 2-(carboethoxymethyl)-piperidines; Takahata, N. et al. Fukuokan Kagaku Toronkai Koen Yoshishu, 12th (1979), 296–300“ erhalten.

ten. Die entsprechenden Teile der Referenzen gelten hiermit als Teil der Offenbarung.

[0048] Die Verbindung C aus Stufe 1 wird ohne weitere Aufreinigung in Stufe 2 mit einer Verbindung der allgemeinen Formel VII, worin R für einen linearen oder verzweigten C_{1-6} -Alkyl-Rest, vorzugsweise für einen Methyl- oder Ethyl-Rest steht, in einem Reaktionsmedium, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Acetonitril, Dichlormethan, Chloroform, Dimethylformamid, Dimethylacetamid und Dimethylsulfoxid, unter Zusatz einer anorganischen Base, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Kaliumcarbonat, Natriumcarbonat, Lithiumcarbonat und Magnesiumcarbonat, vorzugsweise bei einer Temperatur von 50°C bis 150°C zu einer Verbindung der allgemeinen Formel VIII, worin R die vorstehend genannte Bedeutung hat, umgesetzt.

[0049] In Stufe 3 wird eine Verbindung der allgemeinen Formel VIII in einem Reaktionsmedium, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methanol, Ethanol und Isopropanol, unter Zusatz eines Alkalimetallalkoholat-Salzes, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliummethanolat und Kaliumethanolat, vorzugsweise bei einer Temperatur von 50°C bis 120 °C zu einer Verbindung der allgemeinen Formel II umgesetzt.

[0050] Die Verbindungen der vorstehend angegebenen Formeln $R^3-C(=O)-H$, $R^4-C(=O)-OH$, $R^4-C(=O)-X$, HNR^1R^2 , R^2-X , R^3-X , B und VII sind jeweils am Markt käuflich erhältlich und können auch nach üblichen, dem Fachmann bekannten Verfahren hergestellt werden.

[0051] Die vorstehend beschriebenen Umsetzungen können jeweils unter üblichen, dem Fachmann geläufigen Bedingungen, beispielsweise in Hinblick auf Druck oder Reihenfolge der Zugabe der Komponenten durchgeführt werden. Ggf. kann die unter den jeweiligen Bedingungen optimale Verfahrensführung vom Fachmann durch einfache Vorversuche ermittelt werden. Die nach den vorstehend beschriebenen Umsetzungen erhaltenen Zwischen- und Endprodukte können jeweils, falls gewünscht und/oder erforderlich, nach üblichen, dem Fachmann bekannten Methoden gereinigt und/oder isoliert werden. Geeignete Reinigungsverfahren sind beispielsweise Extraktionsverfahren und chromatographische Verfahren wie Säulenchromatographie oder präparative Chromatographie. Sämtliche der vorstehend beschriebenen Verfahrensschritte sowie jeweils auch die Reinigung und/oder Isolierung von Zwischen- oder Endprodukten können teilweise oder vollständig unter einer Inertgasatmosphäre, vorzugsweise unter Stickstoffatmosphäre, durchgeführt werden.

[0052] Die erfindungsgemäßen substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend genannten allgemeinen Formel I sowie entsprechende Stereoisomere können sowohl in Form ihrer freien Basen, ihrer freien Säuren wie auch in Form entsprechender Salze, insbesondere physiologisch verträglicher Salze, isoliert werden. Die freien Basen der jeweiligen erfindungsgemäßen substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend genannten allgemeinen Formel I sowie entsprechender Stereoisomere können beispielsweise durch Umsetzung mit einer anorganischen oder organischen Säure, vorzugsweise mit Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Methansulfonsäure, p-Toluolsulfonsäure, Kohlensäure, Ameisensäure, Essigsäure, Oxasäure, Bernsteinsäure, Weinsäure, Mandelsäure, Fumarsäure, Milchsäure, Citronensäure, Glutaminsäure oder Asparaginsäure, in die entsprechenden Salze, vorzugsweise physiologisch verträglichen Salze, überführt werden. Die freien Basen der jeweiligen substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend genannten allgemeinen Formel I und entsprechender Stereoisomere können ebenfalls mit der freien Säure oder einem Salz eines Zuckerersatzstoffes, wie z.B. Saccharin, Cyclamat oder Acesulfam, in die entsprechenden physiologisch verträglichen Salze überführt werden.

[0053] Entsprechend können die freien Säuren der substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend genannten allgemeinen Formel I und entsprechender Stereoisomere durch Umsetzung mit einer geeigneten Base in die entsprechenden physiologisch verträglichen Salze überführt werden. Beispielhaft seien die Alkalimetallsalze, Erdalkalimetallsalze oder Ammoniumsalze $[NH_xR_{4-x}]^+$, worin $x = 0, 1, 2, 3$ oder 4 ist und R für einen linearen oder verzweigten C_{1-4} -Alkyl-Rest steht, genannt.

[0054] Die erfindungsgemäßen substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend genannten allgemeinen Formel I und entsprechende Stereoisomere können ggf., ebenso wie die entsprechenden Säuren, die entsprechenden Basen oder Salze dieser Verbindungen, nach üblichem, dem Fachmann bekannten Methoden auch in Form ihrer Solvate, vorzugsweise in Form ihrer Hydrate, erhalten werden.

[0055] Sofern die erfindungsgemäßen substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend genannten allgemeinen Formel I nach ihrer Herstellung in Form einer Mischung ihrer Stereoisomeren, vorzugsweise in Form ihrer Racemate oder anderer Mischungen ihrer verschiedenen Enantiomeren und/oder Diastereomeren erhalten werden, können diese nach üblichen, dem Fachmann bekannten Verfahren getrennt und ggf. isoliert werden. Beispielhaft seien chromatographische Trennverfahren, insbesondere Flüssigkeitschromatographie-Verfahren unter Normaldruck oder unter erhöhtem Druck, bevorzugt MPLC- und HPLC-Verfahren, sowie Verfahren der fraktionierten Kristallisation genannt. Dabei können insbesondere einzelne Enantiomeren, z.B. mittels HPLC an chiraler stationärer Phase oder mittels Kristallisation mit chiralen Säuren, etwa (+)-Weinsäure, (-)-Weinsäure oder (+)-10-Camphersulfonsäure, gebildete diastereomere Salze voneinander getrennt werden.

[0056] Die erfindungsgemäßen substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend genannten allgemeinen Formel I und entsprechende Stereoisomere sowie jeweils die entsprechenden Säuren, Basen, Salze und Solvate sind toxikologisch unbedenklich und eignen sich daher als pharmazeutische Wirkstoffe in Arzneimitteln.

[0057] Ein weiterer Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist daher ein Arzneimittel enthaltend wenigstens eine erfindungsgemäße 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindung der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form eines entsprechenden Salzes, oder jeweils in Form eines entsprechenden Solvates, sowie ggf. einen oder mehrere pharmazeutisch verträgliche Hilfsstoffe.

[0058] Diese erfindungsgemäßen Arzneimittel eignen sich insbesondere zur Vanilloid-Rezeptor 1-(VR1/TRPV1)-Regulation, vorzugsweise zur Vanilloid-Rezeptor 1-(VR1/TRPV1)-Hemmung und/oder zur Batrachotoxin-(BTX)-Rezeptor-Regulation, vorzugsweise zur Batrachotoxin-(BTX)-Rezeptor-Hemmung und/oder zur Opioid-Rezeptor-Regulation, vorzugsweise zur μ -Opioid-Rezeptor-Regulation.

[0059] Ebenfalls bevorzugt eignen sich die erfindungsgemäßen Arzneimittel zur Prophylaxe und/oder Behandlung von Störungen oder Krankheiten, die zumindest teilweise durch Vanilloid-Rezeptoren 1 und/oder durch Batrachotoxin-Rezeptoren und/oder durch Opioid-Rezeptoren, insbesondere durch μ -Opioid-Rezeptoren, vermittelt werden.

[0060] Bevorzugt eignet sich das erfindungsgemäße Arzneimittel daher zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Schmerz, vorzugsweise von Schmerz ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus akutem Schmerz, chronischem Schmerz und neuropathischem Schmerz; zur Prophylaxe und/oder Behandlung von einer oder mehreren Erkrankungen ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Migräne; Depressionen; Harninkontinenz; Husten; neurodegenerativen Erkrankungen, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Morbus Parkinson, Morbus Huntington, Morbus Alzheimer und multipler Sklerose; Störungen der Nahrungsmittelaufnahme, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Bulimie, Anorexie, Fettsucht und Kachexie; Angstzuständen; kognitiven Dysfunktionen, vorzugsweise Gedächtnisstörungen; kognitive Mangelzustände (attention deficit syndrom, ADS); Epilepsie; Diarrhoe und Pruritus; zur Prophylaxe und/oder Behandlung von Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenmißbrauch und Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenabhängigkeit, vorzugsweise zur Prophylaxe und/oder Verminderung von Entzugserscheinungen bei Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenabhängigkeit; zur Prophylaxe und/oder Verminderung einer Toleranzentwicklung gegenüber Medikamenten, insbesondere Medikamenten auf Basis von Opioiden; zur Regulation der Nahrungsaufnahme; zur Modulation der Bewegungsaktivität; zur Regulation des kardiovaskulären Systems; zur Lokalanästhesie; zur Vigilanzsteigerung; zur Libidosteigerung; zur Diurese und/oder zur Antinatriurese.

[0061] Besonders bevorzugt eignet sich das erfindungsgemäße Arzneimittel daher zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Schmerz, vorzugsweise von Schmerz ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus akutem Schmerz, chronischem Schmerz und neuropathischem Schmerz; zur Prophylaxe und/oder Behandlung von einer oder mehreren Erkrankungen ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Migräne; Depressionen; neurodegenerativen Erkrankungen, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Morbus Parkinson, Morbus Huntington, Morbus Alzheimer und multipler Sklerose; Angstzuständen; kognitiven Dysfunktionen, vorzugsweise Gedächtnisstörungen; kognitive Mangelzustände (attention deficit syndrom, ADS); Epilepsie; zur Prophylaxe und/oder Behandlung von Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenmißbrauch und Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenabhängigkeit, vorzugsweise zur Prophylaxe und/oder Ver-

minderung von Entzugserscheinungen bei Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenabhängigkeit; zur Prophylaxe und/oder Verminderung einer Toleranzentwicklung gegenüber Medikamenten, insbesondere Medikamenten auf Basis von Opioiden.

[0062] Ganz besonders bevorzugt eignet sich das erfindungsgemäße Arzneimittel zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Schmerz, vorzugsweise von Schmerz ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus akutem Schmerz, chronischem Schmerz und neuropathischem Schmerz.

[0063] Ein weiterer Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist die Verwendung wenigstens einer erfindungsgemäßen 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindung der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form eines entsprechenden Salzes, oder jeweils in Form eines entsprechenden Solvates, sowie ggf. eines oder mehrerer pharmazeutisch verträglicher Hilfsstoffe zur Herstellung eines Arzneimittels zur Vanilloid-Rezeptor 1-(VR1/TRPV1)-Regulation, vorzugsweise zur Vanilloid-Rezeptor 1-(VR1/TRPV1)-Hemmung, und/oder zur Batrachotoxin-(BTX)-Rezeptor-Regulation, vorzugsweise zur Batrachotoxin-(BTX)-Rezeptor-Hemmung und/oder zur Opioid-Rezeptor-Regulation, vorzugsweise zur μ -Opioid-Rezeptor-Regulation.

[0064] Bevorzugt ist die Verwendung wenigstens einer substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindung der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form eines entsprechenden Salzes, oder jeweils in Form eines entsprechenden Solvates, sowie ggf. eines oder mehrerer pharmazeutisch verträglicher Hilfsstoffe zur Herstellung eines Arzneimittels zur Prophylaxe und/oder Behandlung von Störungen oder Krankheiten, die zumindest teilweise durch Vanilloid-Rezeptoren 1 und/oder durch Batrachotoxin-Rezeptoren und/oder durch Opioid-Rezeptoren vermittelt werden.

[0065] Besonders bevorzugt ist die Verwendung wenigstens einer substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindung der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form eines entsprechenden Salzes, oder jeweils in Form eines entsprechenden Solvates, sowie ggf. eines oder mehrerer pharmazeutisch verträglicher Hilfsstoffe zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Schmerz, vorzugsweise von Schmerz ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus akutem Schmerz, chronischem Schmerz und neuropathischem Schmerz; zur Prophylaxe und/oder Behandlung von einer oder mehreren Erkrankungen ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Migräne; Depressionen; Harninkontinenz; Husten; neurodegenerativen Erkrankungen, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Morbus Parkinson, Morbus Huntington, Morbus Alzheimer und multipler Sklerose; Störungen der Nahrungsmittelaufnahme, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Bulimie, Anorexie, Fettsucht und Kachexie; Angstzuständen; kognitiven Dysfunktionen, vorzugsweise Gedächtnisstörungen; kognitive Mangelzustände (attention deficit syndrom, ADS); Epilepsie; Diarrhoe und Pruritus; zur Prophylaxe und/oder Behandlung von Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenmißbrauch und Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenabhängigkeit, vorzugsweise zur Prophylaxe und/oder Verminderung von Entzugserscheinungen bei Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenabhängigkeit; zur Prophylaxe und/oder Verminderung einer Toleranzentwicklung gegenüber Medikamenten, insbesondere Medikamenten auf Basis von Opioiden; zur Regulation der Nahrungsaufnahme; zur Modulation der Bewegungsaktivität; zur Regulation des kardiovaskulären Systems; zur Lokalanästhesie; zur Vigilanzsteigerung; zur Libidosteigerung; zur Diurese und/oder zur Antinatriurese.

[0066] Ganz besonders bevorzugt ist die Verwendung wenigstens einer substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindung der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form eines entsprechenden Salzes, oder jeweils in Form eines entsprechenden Solvates, sowie ggf. eines oder mehrerer pharmazeutisch verträglicher Hilfsstoffe zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Schmerz, vorzugsweise von Schmerz ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus akutem Schmerz, chronischem Schmerz und neuropathischem Schmerz; zur Prophylaxe und/oder Behandlung von einer oder mehreren Erkrankungen ausgewählt

aus der Gruppe bestehend aus Migräne; Depressionen; neurodegenerativen Erkrankungen, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Morbus Parkinson, Morbus Huntington, Morbus Alzheimer und multipler Sklerose; Angstzuständen; kognitiven Dysfunktionen, vorzugsweise Gedächtnisstörungen; kognitive Mangelzustände (attention deficit syndrom, ADS); Epilepsie; zur Prophylaxe und/oder Behandlung von Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenmißbrauch und Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenabhängigkeit, vorzugsweise zur Prophylaxe und/oder Verminderung von Entzugserscheinungen bei Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenabhängigkeit; zur Prophylaxe und/oder Verminderung einer Toleranzentwicklung gegenüber Medikamenten, insbesondere Medikamenten auf Basis von Opioiden.

[0067] Noch weiter bevorzugt ist die Verwendung wenigstens einer substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindung der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form eines entsprechenden Salzes, oder jeweils in Form eines entsprechenden Solvates, sowie ggf. eines oder mehrerer pharmazeutisch verträglicher Hilfsstoffe zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Schmerz, vorzugsweise von Schmerz ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus akutem Schmerz, chronischem Schmerz und neuropathischem Schmerz.

[0068] Das erfindungsgemäße Arzneimittel eignet sich zur Verabreichung an Erwachsene und Kinder einschließlich Kleinkindern und Säuglingen. Das erfindungsgemäße Arzneimittel kann als flüssige, halb feste oder feste Arzneiform, beispielsweise in Form von Injektionslösungen, Tropfen, Säften, Sirupen, Sprays, Suspensionen, Tabletten, Patches, Kapseln, Pflastern, Zäpfchen, Salben, Cremes, Lotionen, Gelen, Emulsionen, Aerosolen oder in multipartikulärer Form, beispielsweise in Form von Pellets oder Granulaten, ggf. zu Tabletten verpreßt, in Kapseln abgefüllt oder in einer Flüssigkeit suspendiert, vorliegen und als solche auch verabreicht werden.

[0069] Neben wenigstens einer substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindung der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I, ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihres Racemates oder in Form von Mischungen der Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder ggf. in Form eines entsprechenden Salzes oder jeweils in Form eines entsprechenden Solvates, enthält das erfindungsgemäße Arzneimittel üblicherweise weitere physiologisch verträgliche pharmazeutische Hilfsstoffe, die beispielsweise ausgewählt werden können aus der Gruppe bestehend aus Trägermaterialien, Füllstoffen, Lösungsmitteln, Verdünnungsmitteln, oberflächenaktiven Stoffen, Farbstoffen, Konservierungsstoffen, Sprengmitteln, Gleitmitteln, Schmiermitteln, Aromen und Bindemitteln.

[0070] Die Auswahl der physiologisch verträglichen Hilfsstoffe sowie die einzusetzenden Mengen derselben hängt davon ab, ob das Arzneimittel oral, subkutan, parenteral, intravenös, intraperitoneal, intradermal, intramuskulär, intranasal, buccal, rectal oder örtlich, zum Beispiel auf Infektionen an der Haut, der Schleimhäute und an den Augen, appliziert werden soll. Für die orale Applikation eignen sich bevorzugt Zubereitungen in Form von Tabletten, Dragees, Kapseln, Granulaten, Pellets, Tropfen, Säften und Sirupen, für die parenterale, topische und inhalative Applikation Lösungen, Suspensionen, leicht rekonstituierbare Trockenzubereitungen sowie Sprays. Die in dem erfindungsgemäßen Arzneimittel zum Einsatz kommenden erfindungsgemäßen substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen in einem Depot in gelöster Form oder in einem Pflaster, gegebenenfalls unter Zusatz von die Hautpenetration fördernden Mitteln, sind geeignete perkutane Applikationszubereitungen. Oral oder perkutan anwendbare Zubereitungsformen können die jeweilige erfindungsgemäße substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindung auch verzögert freisetzen.

[0071] Die Herstellung der erfindungsgemäßen Arzneimittel erfolgt mit Hilfe von üblichen, aus dem Stande der Technik bekannten Mitteln, Vorrichtungen, Methoden und Verfahren, wie sie beispielsweise in „Remington's Pharmaceutical Sciences“, Herausgeber A.R. Gennaro, 17. Auflage, Mack Publishing Company, Easton, Pa, 1985, insbesondere in Teil 8, Kapitel 76 bis 93 beschrieben sind. Die entsprechende Beschreibung wird hiermit als Referenz eingeführt und gilt als Teil der Offenbarung. Die an den Patienten zu verabreichende Menge der jeweiligen erfindungsgemäßen substituierten 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel I kann variieren und ist beispielsweise abhängig vom Gewicht oder Alter des Patienten sowie von der Applikationsart, der Indikation und dem Schweregrad der Erkrankung. Üblicherweise werden 0,001 bis 100 mg/kg, vorzugsweise 0,05 bis 75 mg/kg, besonders bevorzugt 0,05 bis 50 mg/kg, Körpergewicht des Patienten wenigstens einer solchen erfindungsgemäßen Verbin-

dung appliziert.

Pharmakologische Methoden:

I. Funktionelle Untersuchung am Vanilloid-Rezeptor 1 (VRI/TRPV1-Rezeptor)

[0072] Die agonistische bzw. antagonistische Wirkung der zu untersuchenden Substanzen am Vanilloid-Rezeptor 1 (VR1/TRPV1) der Spezies Ratte kann mit folgendem Assay bestimmt werden. Gemäß diesem Assay wird der Ca^{2+} -Einstrom durch den Rezeptorkanal mit Hilfe eines Ca^{2+} -sensitiven Farbstoffs (Typ Fluo-4, Molecular Probes Europe BV, Leiden Niederlande) im Fluorescent Imaging Plate Reader (FLIPR, Molecular Devices, Sunnyvale, USA) quantifiziert.

Methode:

Komplett-Medium: 50 mL HAMS F12 Nutrient Mixture (Gibco Invitrogen GmbH, Karlsruhe, Deutschland) mit 10 Vol-% FCS (fetal calf serum, Gibco Invitrogen GmbH, Karlsruhe, Deutschland, hitzeinaktiviert); 2mM L-Glutamin (Sigma, München, Deutschland); 1 Gew-% AA-Lösung (Antibiotika/Antimykotika-Lösung, PAA, Pasching, Österreich) und 25 ng/ml Medium NGF (2.5 S, Gibco Invitrogen GmbH, Karlsruhe, Deutschland)

[0073] Zellkultur-Platte: Poly-D-Lysin-beschichtete, schwarze 96-Loch-Platten mit klarem Boden (96 well black/clear plate, BD Biosciences, Heidelberg, Deutschland) werden zusätzlich mit Laminin (Gibco Invitrogen GmbH, Karlsruhe, Deutschland) beschichtet, indem Laminin auf eine Konzentration 100 $\mu\text{g}/\text{mL}$ mit PBS (Ca-Mg-free PBS, Gibco Invitrogen GmbH, Karlsruhe, Deutschland) verdünnt wird. Es werden Aliquots mit einer Konzentration von 100 $\mu\text{g}/\text{mL}$ an Laminin entnommen und bei $-20\text{ }^\circ\text{C}$ gelagert. Die Aliquots werden mit PBS im Verhältnis 1:10 auf 10 $\mu\text{g}/\text{mL}$ Laminin verdünnt und jeweils 50 μL der Lösung in eine Vertiefung der Zellkultur-Platte pipettiert. Die Zellkultur-Platten werden mindestens zwei Stunden bei $37\text{ }^\circ\text{C}$ inkubiert, die überstehende Lösung abgesaugt und die Vertiefungen werden jeweils zweimal mit PBS gewaschen. Die beschichteten Zellkultur-Platten werden mit überstehendem PBS aufbewahrt und dieses erst direkt vor der Aufgabe der Zellen entfernt.

Präparation der Zellen:

[0074] Enthaupteten Ratten wird die Wirbelsäule entnommen und diese direkt in kalten, d. h. in einem Eisbad befindlichen, HBSS-Puffer (Hank's buffered saline solution, Gibco Invitrogen GmbH, Karlsruhe, Deutschland) versetzt mit 1 Vol-% (Volumenprozent) einer AA-Lösung (Antibiotika/Antimykotika-Lösung, PAA, Pasching, Österreich) gelegt. Die Wirbelsäule wird längs durchtrennt und zusammen mit Fascien dem Wirbelkanal entnommen. Anschließend werden die Dorsalwurzelganglien (DRGs; dorsal root ganglia) entnommen und wiederum in kaltem HBSS-Puffer versetzt mit 1 Vol-% einer AA-Lösung aufbewahrt. Die vollständig von Blutresten und Spinalnerven befreiten DRGs werden jeweils in 500 μL kalte Collagenase Typ 2 (PAA, Pasching, Österreich) überführt und 35 Minuten bei $37\text{ }^\circ\text{C}$ inkubiert. Nach Zugabe von 2.5 Vol-% Trypsin (PAA, Pasching, Österreich) wird weitere 10 Minuten bei $37\text{ }^\circ\text{C}$ inkubiert. Nach der vollständigen Inkubation wird die Enzymlyösung vorsichtig ab pipettiert und die zurückgebliebenen DRGs werden jeweils mit 500 μL Komplett-Medium versetzt.

[0075] Die DRGs werden jeweils mehrfach suspendiert, mittels einer Spritze durch Kanülen Nr. 1, Nr. 12 und Nr. 16 gezogen und in 50 mL Falcon-Röhrchen überführt und dieses mit Komplett-Medium auf 15 mL aufgefüllt. Der Inhalt jedes Falcon-Röhrchen wird jeweils durch einen 70 μm Falcon-Filtereinsatz filtriert und 10 Minuten bei 1200 Umdrehungen und Raumtemperatur zentrifugiert. Das resultierende Pellet wird jeweils in 250 μL Komplett-Medium aufgenommen und die Zellzahl ermittelt.

[0076] Die Anzahl der Zellen in der Suspension wird auf 3 mal 10^5 pro mL eingestellt und jeweils 150 μL dieser Suspension in eine Vertiefung der wie vorstehend beschrieben beschichteten Zellkultur-Platten gegeben. Im Brutschrank werden die Platten bei $37\text{ }^\circ\text{C}$, 5 Vol-% CO_2 und 95 % relativer Luftfeuchtigkeit zwei bis drei Tage stehen gelassen.

[0077] Anschließend werden die Zellen mit 2 μM Fluo-4 und 0,01 Vol-% Pluronic F127 (Molecular Probes Europe BV, Leiden Niederlande) in HBSS-Puffer (Hank's buffered saline solution, Gibco Invitrogen GmbH, Karlsruhe, Deutschland) für 30 min bei $37\text{ }^\circ\text{C}$ beladen, 3 \times mit HBSS-Puffer gewaschen und nach einer weiteren Inkubation von 15 Minuten bei Raumtemperatur zur Ca^{2+} -Messung im FLIPR-Assay eingesetzt. Die Ca^{2+} -abhängige Fluoreszenz wird dabei vor und nach Zugabe von Substanzen gemessen ($\lambda_{\text{ex}} = 488\text{ nm}$, $\lambda_{\text{em}} = 540$

nm). Die Quantifizierung erfolgt durch die Messung der höchsten Fluoreszenzintensität (FC, Fluorescence Counts) über die Zeit.

FLIPR-Assay:

[0078] Das FLIPR-Protokoll besteht aus 2 Substanzzugaben. Zunächst werden die zu testenden Verbindungen (10 μM) auf die Zellen pipettiert und der Ca^{2+} -Einstrom mit der Kontrolle (Capsaicin 10 μM) verglichen. Daraus ergibt sich die Angabe in % Aktivierung bezogen auf das Ca^{2+} -Signal nach Zugabe von 10 μM Capsaicin (CP). Nach 5 Minuten Inkubation werden 100 nM Capsaicin appliziert und ebenfalls der Einstrom von Ca^{2+} ermittelt.

[0079] Desensitisierende Agonisten und Antagonisten führen zu einer Unterdrückung des Ca^{2+} -Einstroms. Es werden % Inhibierung im Vergleich zu der maximal erreichbaren Inhibierung mit 10 μM Capsaicin berechnet.

[0080] Es werden Dreifach-Bestimmungen ($n = 3$) durchgeführt und diese in mindestens 3 unabhängigen Experimenten wiederholt ($N = 4$).

II. Methode zur Bestimmung der Affinität zur Batrachotoxin-(BTX)-Bindungsstelle des Natriumkanals:

[0081] Die Bindungsstelle 2 des Natriumkanals ist die sogenannte Batrachotoxin-(BTX) Bindungsstelle. Als Ligand wird [^3H]-Batrachotoxinin A20 α -Benzoat (10 nM im Ansatz) eingesetzt. Die Ionenkanal-Partikel (Synaptosomen) werden aus dem Ratten Cerebrocortex angereichert, wie in der Veröffentlichung von Gray und Whittaker, 1962, J. Anat. 76, 79–88 beschrieben. Die entsprechende Beschreibung wird hiermit als Referenz eingeführt und gilt als Teil der vorliegenden Offenbarung. Als unspezifische Bindung ist die Radioaktivität definiert, die in Gegenwart von Veratridin (3×10^{-4} M im Ansatz) gemessen wird.

[0082] Die Assaybedingungen werden entsprechend der Veröffentlichung von Pauwels, Leysen und Laduron durchgeführt, wie in Eur. J. Pharmacol. 124, 291–298 beschrieben. Die entsprechende Beschreibung wird hiermit als Referenz eingeführt und gilt als Teil der vorliegenden Offenbarung.

[0083] Abweichend von dieser Vorschrift wird der Gesamtansatz auf 250 μl verkleinert, so daß der Assay auf 96-well Mikrotiterplatten durchgeführt werden kann. Die Inkubationszeit in diesen Mikrotiterplatten beträgt zwei Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20–25°C).

[0084] Folgende Kenndaten wurden für den K_D -Wert der Bindungsstelle ermittelt:
 K_D : 24,63 \pm 1,56 nM.

III. Methode zur Bestimmung der Affinität zum humanen μ -Opioidrezeptor

[0085] Die Rezeptoraffinität zum humanen μ -Opioidrezeptor wird in einem homogenen Ansatz in Mikrotiterplatten bestimmt. Hierzu werden Verdünnungsreihen der jeweils zu prüfenden substituierten 5,6,7,8-Tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindung der allgemeinen Formel I mit einer Rezeptormembranpräparation (15–40 μg Protein pro 250 μl Inkubationsansatz) von CHO-K1-Zellen, welche den humanen μ -Opioidrezeptor (μ -Opiat-Rezeptor) exprimieren (RB-HOM-Rezeptormembran-Präparation der Firma NEN, Zaventem, Belgien) in Gegenwart von 1 nmol/l des radioaktiven Liganden [^3H]-Naloxon (NET719, Firma NEN, Zaventem, Belgien) sowie von 1 mg WGA-SPA-Beads (Wheat germ agglutinin SPA Beads der Firma Amersham/Pharmacia, Freiburg, Deutschland) in einem Gesamtvolumen von 250 μl für 90 Minuten bei Raumtemperatur inkubiert. Als Inkubationspuffer wird 50 mmol/l Tris-HCl supplementiert mit 0,05 Gew.-% Natriumazid und mit 0,06 Gew.-% bovinem Serumalbumin verwendet. Zur Bestimmung der unspezifischen Bindung wird zusätzlich 25 $\mu\text{mol/l}$ Naloxon zugegeben. Nach Beendigung der neunzigminütigen Inkubationszeit werden die Mikrotiterplatten für 20 Minuten bei 1000 g ab zentrifugiert und die Radioaktivität in einem β -Counter (Microbeta-Trilux, Firma PerkinElmer Wallac, Freiburg, Deutschland) vermessen. Es wird die prozentuale Verdrängung des radioaktiven Liganden aus seiner Bindung zum humanen μ -Opiatrezeptor bei einer Konzentration der zu prüfenden Verbindungen von 1 $\mu\text{mol/l}$ bestimmt und als Prozent Hemmung der spezifischen Bindung angegeben.

Ausführungsbeispiel

[0086] Im folgenden wird die Erfindung anhand von Beispielen erläutert. Diese Erläuterungen sind lediglich beispielhaft und schränken den allgemeinen Erfindungsgedanken nicht ein.

[0087] Die Ausbeuten der hergestellten Verbindungen sind nicht optimiert.

[0088] Alle Temperaturen sind unkorrigiert.

Abkürzungen:

aq.	wässrig
Äq.	Stoffmengenäquivalent
BOP	1-Benzotriazolyl-oxyl-tris-(dimethylamino)-phosphonium hexafluorophosphat
DCC	Dicyclohexylcarbodiimid
DCE	Dichlorethan
DCM	Dichlormethan
DIPEA	Diisopropylethylamin
DMF	Dimethylformamid
EDCI	N'-(3-Dimethylaminopropyl)-N-ethylcarbodiimid
EtOAc	Ethylacetat
ges.	gesättigt
HATU	N-[(Dimethylamino)-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]pyridino-1-ylmethyl]-N-methylmethanaminium hexafluorophosphat N-oxid
HBTU	O-(Benzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetramethyluronium hexafluorophosphat
HOAt	1-Hydroxy-7-azabenzotriazol
HPTLC	high performance thin layer chromatography
MeOH	Methanol
NMR	Kernresonanzspektroskopie
RT	Raumtemperatur

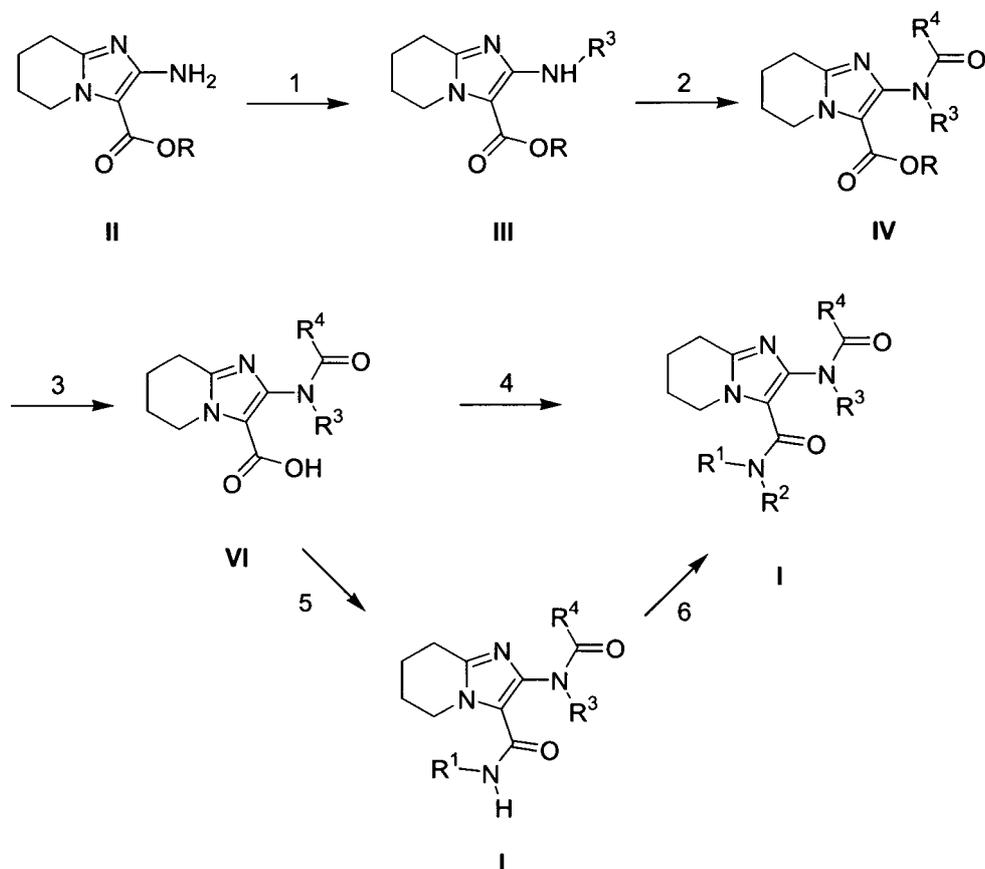
[0089] Die eingesetzten Chemikalien und Lösungsmittel wurden kommerziell bei den herkömmlichen Anbietern (Acros, Avocado, Aldrich, Bachem, Fluka, Lancaster, Maybridge, Merck, Sigma, TCI, etc.) bezogen oder nach den für den Fachmann bekannten Methoden synthetisiert.

[0090] Als stationäre Phase für die Säulenchromatographie wurde Kieselgel 60 (0.040–0.063 mm) der Firma E. Merck, Darmstadt, eingesetzt.

[0091] Die dünnschicht-chromatographischen Untersuchungen wurden mit HPTLC-Fertigplatten, Kieselgel 60 F 254, der Firma E. Merck, Darmstadt, durchgeführt. Die Mischungsverhältnisse von Lösungsmitteln, Laufmitteln oder für chromatographische Untersuchungen sind stets in Volumen/Volumen angegeben. Die Analytik erfolgte durch Massenspektroskopie und NMR.

Allgemeine Vorschriften für die Herstellung beispielgemäßer substituierter 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen

Allgemeines Syntheschema 1:



[0092] In Stufe 1 wurde die Umsetzung von Verbindungen der allgemeinen Formel II mit Aldehyden der allgemeinen Formel $R^3-C(=O)-H$ in organischen Lösungsmitteln oder Lösungsmittelgemischen, beispielsweise von Diethylether, Tetrahydrofuran, Methanol, Ethanol, Dichlormethan, Dichlorethan, Chloroform und Toluol, unter Zusatz eines Reduktionsmittels, beispielsweise unter Zusatz von Natriumborhydrid, Natriacetoxborhydrid oder Natriumcyanoborhydrid, ggf. unter Zusatz einer organischen Säure, beispielsweise unter Zusatz von Essigsäure, bei Temperaturen von -70°C bis 100°C zu Verbindungen der allgemeinen Formel III durchgeführt.

[0093] In Stufe 2 wurde die Umsetzung von Verbindungen der allgemeinen Formel III mit Carbonsäuren der allgemeinen Formel $R^4-C(=O)-OH$ in organischen Lösungsmitteln oder Lösungsmittelgemischen, beispielsweise von Diethylether, Tetrahydrofuran, Acetonitril, Methanol, Ethanol, Dimethylformamid und Dichlormethan, ggf. unter Zusatz wenigstens eines Kupplungsreagenzes, beispielsweise unter Zusatz von BOP, DCC, EDCI, HATU, HBTU oder HOAt, ggf. unter Zusatz wenigstens einer anorganischen Base, beispielsweise unter Zusatz von Kaliumcarbonat oder Cäsiumcarbonat, oder einer organischen Base, beispielsweise unter Zusatz von Triethylamin, Pyridin, Dimethylaminopyridin oder Diisopropylethylamin bei Temperaturen von -70°C bis 100°C zu Verbindungen der allgemeinen Formel IV durchgeführt.

[0094] Alternativ wurden Verbindungen der allgemeinen Formel III mit Carbonsäurederivaten bzw. Kohlen säurederivaten der allgemeinen Formel $R^4-C(=O)-X$, wobei X für einen Halogen-Rest steht, in organischen Lösungsmitteln oder Lösungsmittelgemischen, beispielsweise von Diethylether, Tetrahydrofuran, Acetonitril, Methanol, Ethanol, Dimethylformamid und Dichlormethan, mit oder ohne Zusatz einer organischen Base, beispielsweise unter Zusatz von Triethylamin, Dimethylaminopyridin, Pyridin oder Diisopropylamin bei Temperaturen von -70°C bis 100°C zu Verbindungen der allgemeinen Formel IV umgesetzt.

[0095] In Stufe 3 wurde die Umsetzung von Verbindungen der allgemeinen Formel IV in organischen Lösungsmitteln oder Lösungsmittelgemischen, beispielsweise von Dioxan, Tetrahydrofuran, Diethylether, Methanol, Ethanol, Isopropanol und Wasser, unter Zusatz einer anorganischen Base, beispielsweise unter Zusatz von Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid oder Lithiumhydroxid, bei Temperaturen von 0°C bis 30°C zu Verbindun-

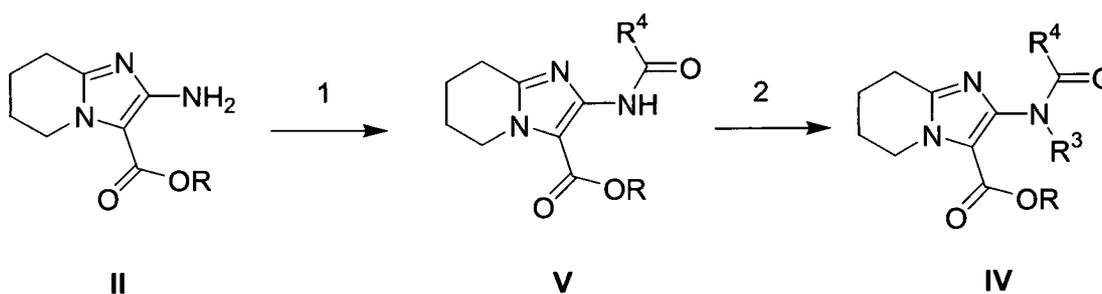
gen der allgemeinen Formel VI durchgeführt. Vorzugsweise erfolgte die Umsetzung in einem Lösungsmittelgemisch, das aus Methanol, Dioxan und einer 4 M Natriumhydroxid-Lösung in Wasser mit einem Verhältnis der entsprechenden Volumina von 15:4:1 bestand („Tesser Base“).

[0096] In Stufe 4 wurde die Umsetzung von Verbindungen der allgemeinen Formel I mit Aminen der allgemeinen Formel HNR^1R^2 in organischen Lösungsmitteln oder Lösungsmittelgemischen, beispielsweise von Diethylether, Tetrahydrofuran, Acetonitril, Methanol, Ethanol, Dimethylformamid und Dichlormethan, ggf. unter Zusatz wenigstens eines Kupplungsreagenzes, beispielsweise unter Zusatz von BOP, DCC, EDCI, HATU, HBTU oder HOAt, ggf. unter Zusatz wenigstens einer anorganischen Base, beispielsweise unter Zusatz von Kaliumcarbonat oder Cäsiumcarbonat, oder einer organischen Base, beispielsweise unter Zusatz von Triethylamin, Pyridin, Dimethylaminopyridin oder Diisopropylethylamin bei Temperaturen von -70°C bis 100°C zu Verbindungen der allgemeinen Formel I durchgeführt.

[0097] In Stufe 5 wurden Verbindungen der vorstehend angegebenen allgemeinen Formel VI mit Aminen der allgemeinen Formel HNR^1R^2 , worin R^2 für Wasserstoff steht, mit den Methoden wie vorstehend im Allgemeinen Syntheschema 1, Stufe 4 beschrieben zu Verbindungen der allgemeinen Formel I umgesetzt.

[0098] In Stufe 6 wurden Verbindungen der allgemeinen Formel Ia mit Verbindungen der allgemeinen Formel $\text{R}^2\text{-X}$, worin X für einen Halogen-Rest steht, in organischen Lösungsmitteln oder Lösungsmittelgemischen, beispielsweise von Dimethylformamid, Heptan, Hexan, Toluol, Tetrahydrofuran und Diethylether, unter Zusatz eines Metallhydridsalzes, beispielsweise unter Zusatz von Natriumhydrid, Kaliumhydrid oder Lithiumhydrid, bei Temperaturen von 0°C bis 40°C zu Verbindungen der allgemeinen Formel I umgesetzt.

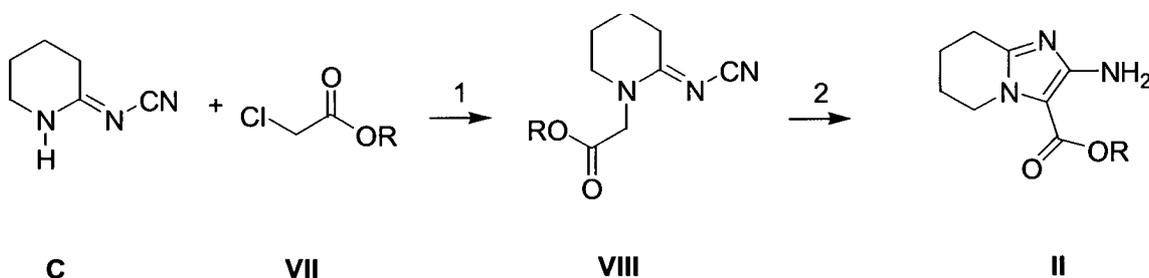
Allgemeines Syntheschema 2:



[0099] Die Verbindungen der allgemeinen Formel II lassen sich mit den gleichen Methoden, wie im Allgemeinen Syntheschema 1, Stufe 2, beschrieben, zu Verbindungen der allgemeinen Formel V umsetzen.

[0100] Die Verbindungen der allgemeinen Formel V lassen sich mit den gleichen Methoden, wie im Allgemeinen Syntheschema 1, Stufe 6, beschrieben, zu Verbindungen der allgemeinen Formel IV umsetzen.

Allgemeines Syntheschema 3:



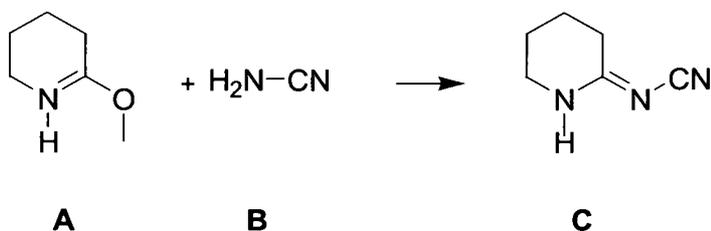
[0101] In Stufe 1 erfolgte die Umsetzung von Piperidin-2-yliden-cyanamid (C) mit einer Verbindung der allgemeinen Formel VII, worin R für einen linearen oder verzweigten C_{1-6} -Alkyl-Rest steht, in organischen Lösungsmitteln oder Lösungsmittelgemischen, beispielsweise von Acetonitril, Dichlormethan, Chloroform, Dimethylformamid, Dimethylacetamid und Dimethylsulfoxid, unter Zusatz einer anorganischen Base, beispielsweise unter Zusatz von Kaliumcarbonat, Natriumcarbonat, Lithiumcarbonat oder Magnesiumcarbonat, bei einer Temperatur von 50°C bis 150°C zu einer Verbindung der allgemeinen Formel VIII.

[0102] In Stufe 2 wurde eine Verbindung der allgemeinen Formel VIII in organischen Lösungsmitteln oder Lö-

sungsmittelgemischen, beispielsweise von Methanol, Ethanol und Isopropanol, unter Zusatz eines Alkalimetallalkoholat-Salzes, beispielsweise von Natriummethanolat, Natriummethanolat, Kaliummethanolat und Kaliummethanolat, bei einer Temperatur von 50°C bis 120 °C zu einer Verbindung der allgemeinen Formel II umgesetzt.

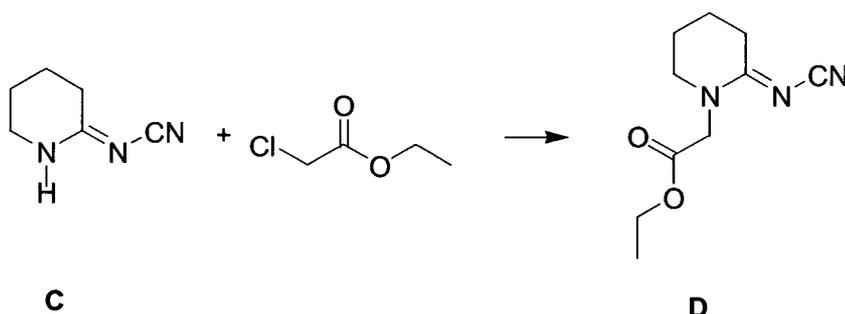
[0103] Im folgenden werden die vorstehend beschriebenen Vorschriften für die Herstellung substituierter 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen anhand einiger Beispielverbindungen detailliert erläutert:

a) Synthese von Piperidin-2-yliden-cyanamid



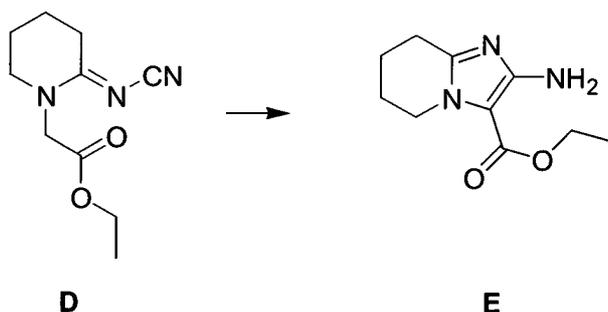
[0104] 6-Methoxy-2,3,4-5-tetrahydropyridin (A) (9.01 g, 79.6 mmol) wurde in MeOH (90 mL) gelöst und anschließend wurde Cyanamid (B) (3.35 g, 79.6 mmol, 1 Äq.) langsam hinzu gefügt. Nach 5 Minuten wurde ein weißer Niederschlag beobachtet. Die resultierende Suspension wurde für weitere 72 Stunden bei RT gerührt und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Piperidin-2-yliden-cyanamid (C) wurde als weißes Pulver erhalten, das direkt weiter verwendet wurde.

b) Synthese von (2-Cyanoimino-piperidin-1-yl)-essigsäureethylester



[0105] Piperidin-2-yliden-cyanamid (C) (9.67 g, 78.5 mmol) wurde unter leichtem Erwärmen in Acetonitril (150 mL) gelöst. Anschließend wurden Kaliumcarbonat (13.0 g, 94.2 mmol, 1.2 Äq.) und Ethylchloroacetat (11.7 mL, 109.9 mmol, 1.4 Äq.) hinzu gegeben und die resultierende Suspension wurde für 16 Stunden auf 85°C erwärmt. Anschließend wurde ein weitere Menge Ethylchloroacetat (1.67 mL, 15.7 mmol, 0.2 Äq.) hinzu gegeben. Die Reaktionsmischung wurde 6 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Die abgekühlte Suspension wurde filtriert und der feste Rückstand mit DCM gewaschen. Das Filtrat wurde im Vakuum eingedunstet und nach säulenchromatographischer Reinigung (SiO₂, Heptan/EtOAc 2:3) wurden 16.16 g (98 %) des gewünschten Produkts (2-Cyanoimino-piperidin-1-yl)-essigsäureethylester (D) erhalten.

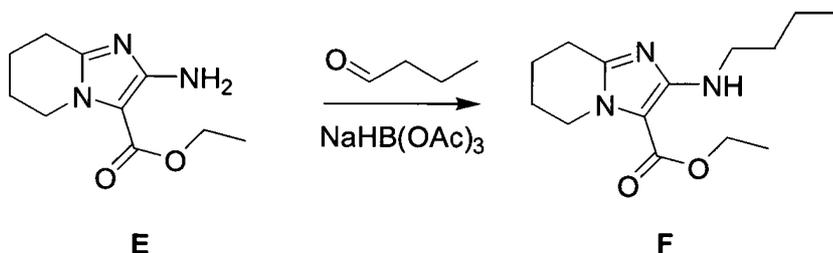
c) Synthese von 2-Amino-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]-pyridin-3-carboxylsäureethylester



[0106] Zu einer Lösung aus Natriummethanolat (5.20 g, 76.7 mmol, 1.0 Äq.) in Ethanol (500 mL) wurde Verbin-

dung D (16.05 g, 76.7 mmol) gegeben und die resultierende Reaktionsmischung wurde 30 Minuten unter Rückfluß erhitzt. Das Lösungsmittel wurde im Vakuum entfernt und das Rohprodukt wurde mittels Säulenchromatographie (Hydromatrix als Adsorbent, SiO₂, DCM/3 % MeOH → DCM/ 5 % MeOH) gereinigt. Es wurden 9.27 g des gewünschten Produkts E erhalten. Die Säule wurde mit Methanol gewaschen, das Lösungsmittel im Vakuum entfernt und der Rückstand aus Heptan umkristallisiert, um weitere 3.26 g des gewünschten Produkts 2-Amino-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]-pyridin-3-carboxyl-säureethylester (E) zu erhalten. Insgesamt wurden 12.53 g (78 %) des gewünschten Produkts 2-Amino-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]-pyridin-3-carboxyl-säureethylester (E) erhalten.

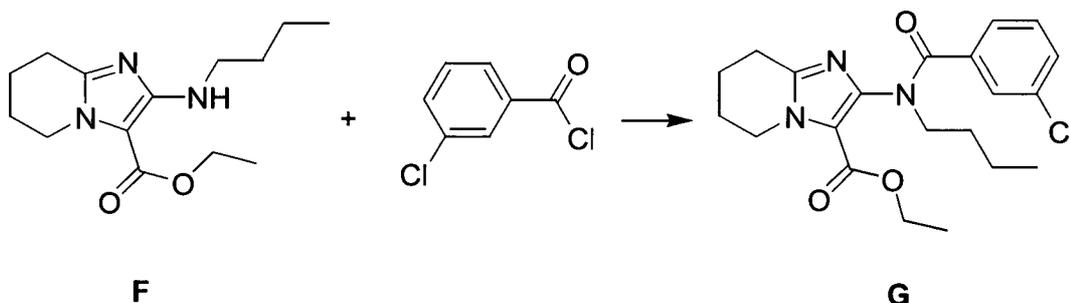
d) Synthese von 2-Butylamino-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo(1,2-a)pyridin-3-carboxylsäureethylester



[0107] Verbindung E wurde in DCE (150 mL) gelöst und n-Butylaldehyd (49.7 mmol, 4.4 mL, 1.5 Äq.) wurde hinzu gegeben. Anschließend wurde Natriumtriacetoxyborhydrid (11.93 g, 56.3 mmol, 1.7 Äq.) portionsweise hinzu gefügt und die Reaktionsmischung wurde 4 Stunden bei RT gerührt. Die Reaktionsmischung wurde mit DCM (500 mL) verdünnt und mit ges. aq. NaHCO₃-Lösung (500 mL) gewaschen. Die wäßrigen Phasen wurden mit DCM (100 mL) extrahiert und die vereinigten organischen Phasen wurden mit ges. aq. NaCl-Lösung (500 mL) gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Das Rohprodukt wurde mittels Säulenchromatographie (SiO₂, Heptan/EtOAc 4:1 → 3:1) gereinigt und es wurden 5.7 g (65 %) des gewünschten Produkts 2-Butylamino-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carboxylsäureethylester (F) erhalten.

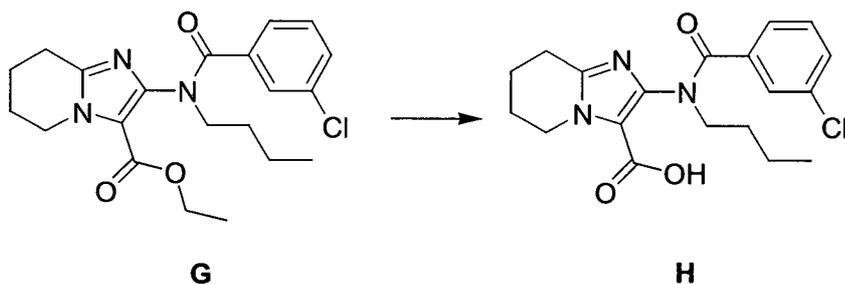
e) Synthese der Beispielverbindungen 43, 91 und 133

1) Synthese von Verbindung 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo(1,2-a)pyridin-3-carbonsäureethylester



[0108] Verbindung F (3.1 g, 11.7 mmol) und Triethylamin (2.46 ml, 17.5 mmol, 1.5 Äq.) wurden in DCM (70 mL) gelöst und die Reaktionsmischung wurde in einem Eisbad gekühlt. Anschließend wurde 3-Chlorbenzoylchlorid (1.65 mL, 12.85 mmol, 1.1 Äq.) tropfenweise hinzu gegeben. Nach 90 Minuten wurde die Reaktionsmischung mit DCM (130 mL) verdünnt und anschließend mehrfach mit 0.5 M KHSO₄ in Wasser (200 mL), ges. aq. NaHCO₃-Lösung (200 mL) und ges. aq. NaCl-Lösung (200 mL) gewaschen. Die organische Phase wurde über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Das Rohprodukt 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäureethylester wurde mittels Säulenchromatographie (SiO₂, DCM → DCM/5 % MeOH) gereinigt und direkt in der nächsten Stufe eingesetzt.

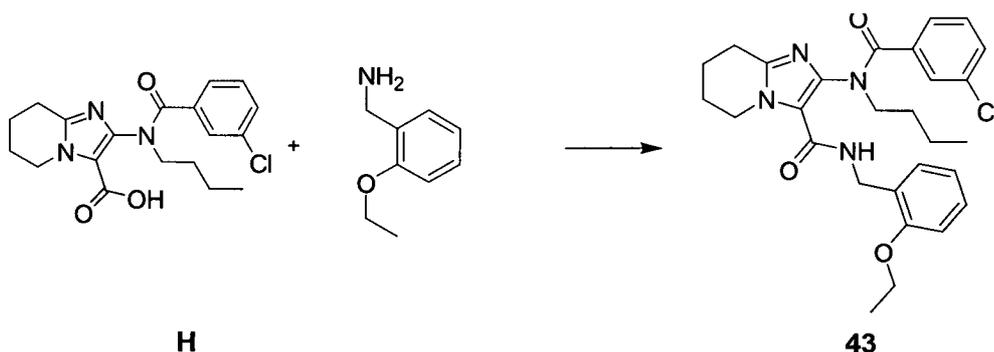
2) Synthese von 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure



[0109] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäureethylester (11.7 mmol) wurde in einer Lösung aus 190 mL MeOH/Dioxan/ 4 M NaOH in Wasser im Verhältnis 15/4/1 gelöst und die Lösung wurde über Nacht bei RT gerührt. Das Lösungsmittel wurde im Vakuum entfernt, EtOAc (700 mL) wurde hinzu gefügt und die organische Phase wurde mit 0.5 M KHSO₄ in Wasser (700 mL) gewaschen. Die wäßrige Phase wurde mit EtOAc extrahiert (300 mL) und die vereinigten organischen Phasen wurden mit ges. aq. NaCl-Lösung (700 mL) gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel wurde im Vakuum entfernt. Es wurden 4.13 g (94 % über zwei Stufen) des gewünschten Produkts 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure erhalten.

3) Synthese von Beispielverbindung 43:

2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-ethoxy-benzylamid

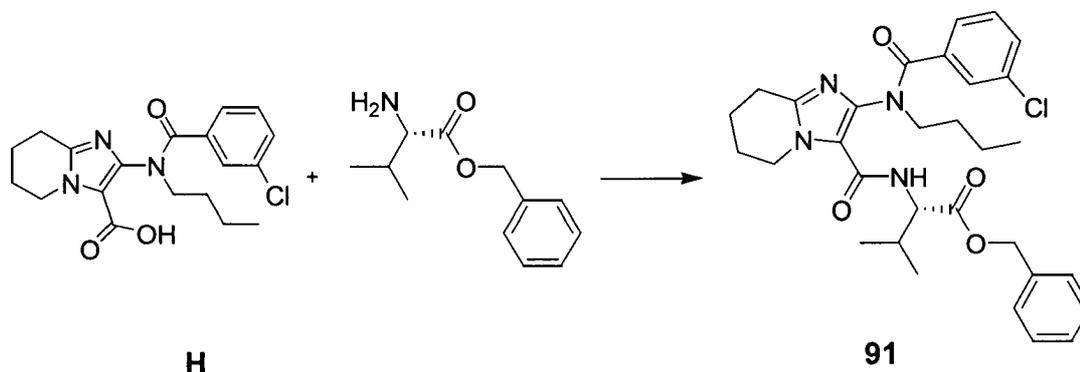


[0110] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (130 mg, 0.45 mmol), EDCI (72.9 mg, 0.38 mmol, 1.0 Äq.) und HOAt (4.7 mg, 0.035 mmol, 0.1 Äq.) wurden in DCM (3.5 mL) gelöst. ortho-Phenetidin (51.5 µL, 0.35 mmol) wurde hinzu gegeben und die Lösung wurde 16 Stunden bei RT gerührt. Das Lösungsmittel wurde im Vakuum entfernt, EtOAc (30 mL) wurde hinzu gegeben und die organische Phase wurde mehrfach mit einer 0.5 M Lösung von KHSO₄ in Wasser (30 mL) und ges. aq. NaHCO₃-Lösung (35 mL) gewaschen. Die wäßrigen Phasen wurden mehrfach mit Ethylacetat ausgeschüttelt. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit ges. aq. NaCl-Lösung (40 mL) gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel wurde im Vakuum entfernt. Das Rohprodukt wurde mittels Säulenchromatographie (SiO₂, DCM → DCM/MeOH 98/2) gereinigt. Es wurden 130 mg (73 %) des gewünschten Produkts 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-ethoxy-benzylamid erhalten.

MS: [M⁺] 509.6

4) Synthese von Beispielverbindung 91:

2-((2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl)-amino)-3-(S)-methyl-buttersäurebenzylester

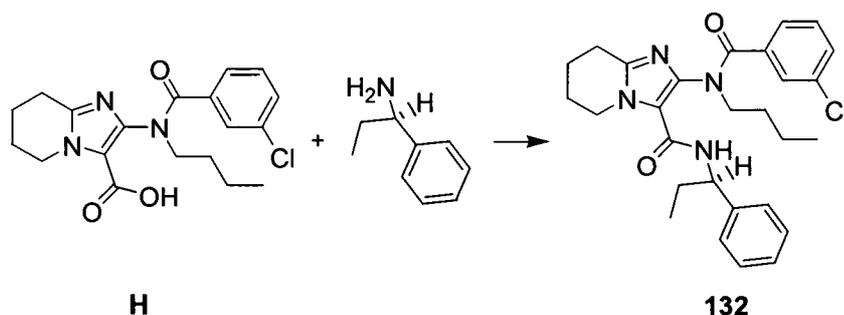


[0111] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (0.50 g, 1.33 mmol), L-Valinbenzylesterhydrochlorid (324 mg, 1.33 mmol), DIPEA (172 mg, 1.33 mmol) und HOAt (18 mg, 0.13 mmol) wurden in 10 mL DCM gelöst. Die Lösung wurde auf 0 °C gekühlt und EDCI (280 mg, 1.46 mmol) wurde hinzu gegeben.

[0112] Anschließend wurde die Lösung 1 Stunde bei 0 °C und über Nacht bei RT gerührt. DCM (50 mL) und ges. aq. NaCl-Lösung (50 mL) wurden hinzu gegeben und die wäßrige Phase wurde mit DCM (50 mL) extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Das Rohprodukt wurde mittels Säulenchromatographie (SiO₂, DCM/MeOH 98/2) gereinigt. Es wurden 473 mg (63 %) des gewünschten Produkts 2-((2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl)-amino)-3-(S)-methyl-buttersäurebenzylester erhalten.

5) Synthese von Beispielverbindung 132:

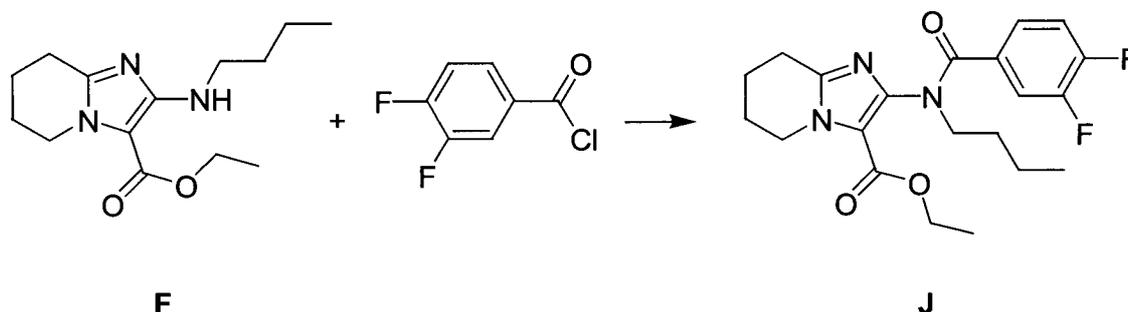
2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-(R)-phenyl-propyl)-amid



[0113] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (0.50 g, 1.33 mmol), R-(+)-1-Phenylpropylamin (180 mg, 1.33 mmol) und HOAt (18 mg, 0.13 mmol) wurden in 5 mL DCM gelöst. Die Lösung wurde auf 0 °C gekühlt und EDCI (280 mg, 1.46 mmol) wurde hinzu gegeben. Die Reaktionsmischung wurde 1 Stunde bei 0 °C und anschließend bei RT über Nacht gerührt. Es wurden DCM (50 mL) und ges. aq. NaCl-Lösung (50 mL) hinzu gegeben und die wäßrige Phase wurde mit 50 mL DCM extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel wurde im Vakuum entfernt. Das Rohprodukt wurde mittels Säulenchromatographie (SiO₂, DCM/MeOH 98/2) gereinigt und es wurden 492 mg (75 %) des gewünschten Produkts 2-((2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl)-amino)-1-(R)-phenylpropylamid erhalten.

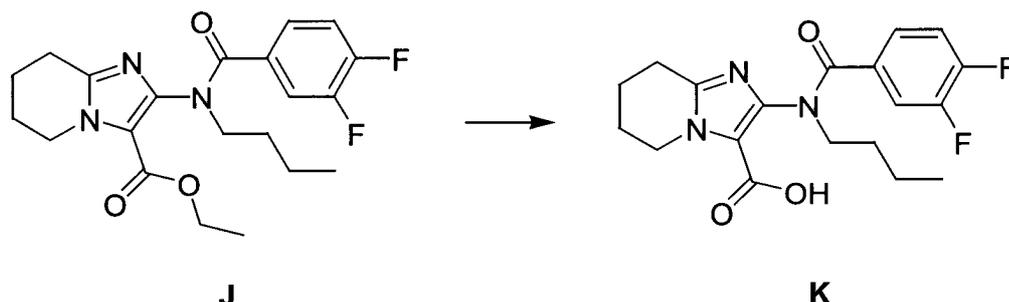
f) Synthese der Beispielverbindungen 16, 93 und 180

1) Synthese von 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäureethylester



[0114] Verbindung F (3.2 g, 12.1 mmol) und Triethylamin (2.54 mL, 18.1 mmol, 1.5 Äq.) wurden in DCM (70 mL) gelöst und die Lösung wurde auf 0 °C gekühlt. 3,4-Difluorbenzoylchlorid (1.66 mL, 13.3 mmol, 1.1 Äq.) wurde tropfenweise hinzu gefügt. Nach 90 Minuten wurde die Reaktionsmischung mit DCM (130 mL) verdünnt und mit 0.5 M KHSO₄ in Wasser (200 mL), ges. aq. NaHCO₃-Lösung (200 mL) und ges. aq. NaCl-Lösung (200 mL) gewaschen. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt und das Rohprodukt 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäureethylester wurde direkt in der nächsten Stufe eingesetzt.

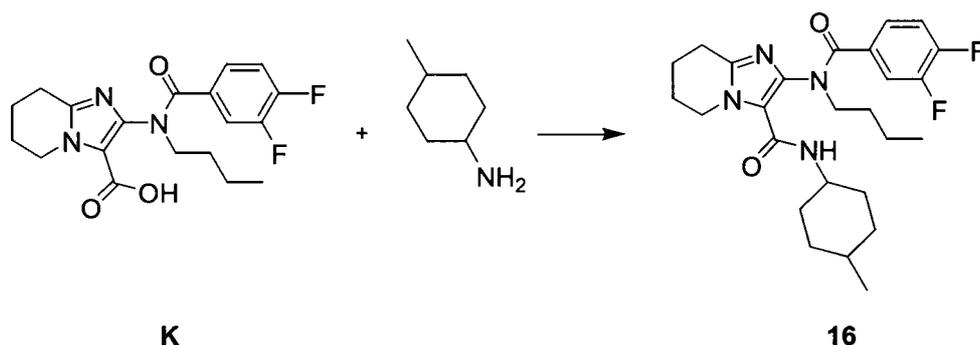
2) Synthese von 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure



[0115] Verbindung J (12.1 mmol) wurde in einer Lösung aus 200 mL MeOH/Dioxan/ 4 M NaOH in Wasser im Verhältnis 15/4/1 gelöst und die Lösung wurde über Nacht bei RT gerührt. Das Lösungsmittel wurde im Vakuum entfernt, EtOAc (700 mL) wurde hinzu gefügt und die organische Phase wurde mit 0.5 M KHSO₄ in Wasser (700 mL) gewaschen. Die wäßrige Phase wurde mit EtOAc extrahiert (300 mL) und die vereinigten organischen Phasen wurden mit ges. aq. NaCl-Lösung (700 mL) gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel wurde im Vakuum entfernt. Es wurden 4.38 g (96 % über zwei Stufen) des gewünschten Produkts 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure erhalten.

3) Synthese von Beispielverbindung 16:

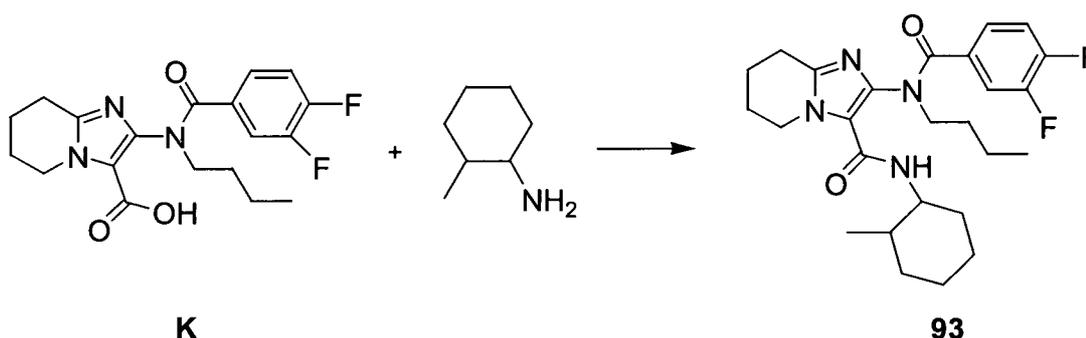
2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo(1,2-a)pyridin-3-carbonsäure (4-methyl-cyclohexyl)-amid



[0116] Verbindung K (0.50 g, 1.33 mmol), 4-Methyl-cyclohexylamin (149 mg, 1.33 mmol, Mischung von cis- und trans-Isomeren), DIPEA (172 mg, 1.33 mmol) und HOAt (18 mg, 0.13 mmol) wurden in 10 mL DCM gelöst. Die Lösung wurde auf 0 °C gekühlt und EDCI (280 mg, 1.46 mmol) wurde hinzu gegeben. Anschließend wurde die Lösung 1 Stunde bei 0 °C und über Nacht bei RT gerührt. DCM (50 mL) und ges. aq. NaCl-Lösung (50 mL) wurden hinzu gegeben und die wäßrige Phase wurde mit DCM (50 mL) extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Das Rohprodukt wurde mittels Säulenchromatographie (SiO₂, DCM/MeOH 98/2) gereinigt. Es wurden 418 mg (67 %) des gewünschten Produkts 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-methyl-cyclohexyl)-amid erhalten.

4) Synthese von Beispielverbindung 93:

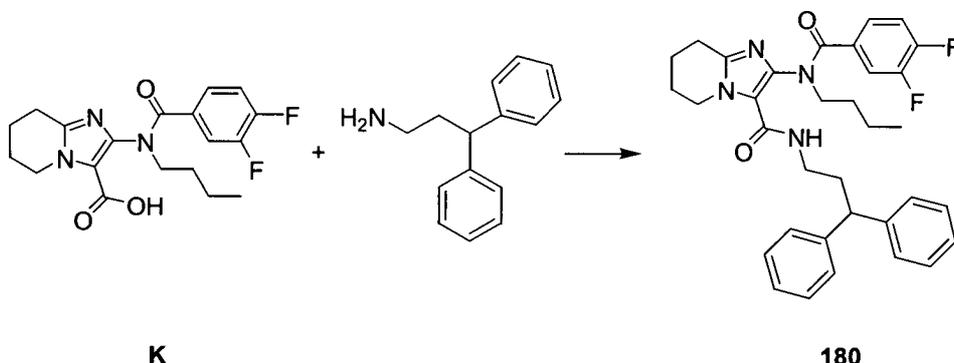
2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-methyl-cyclohexyl)-amid



[0117] Verbindung K (0.50 g, 1.33 mmol), 2-Methyl-cyclohexylamin (149 mg, 1.33 mmol, Mischung von cis- und trans-Isomeren), DIPEA (172 mg, 1.33 mmol) und HOAt (18 mg, 0.13 mmol) wurden in 10 mL DCM gelöst. Die Lösung wurde auf 0 °C gekühlt und EDCI (280 mg, 1.46 mmol) wurde hinzu gegeben. Anschließend wurde die Lösung 1 Stunde bei 0 °C und über Nacht bei RT gerührt. DCM (50 mL) und ges. aq. NaCl-Lösung (50 mL) wurden hinzu gegeben und die wäßrige Phase wurde mit DCM (50 mL) extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Das Rohprodukt wurde mittels Säulenchromatographie (SiO₂, DCM/MeOH 98/2) gereinigt. Es wurden 272 mg (43 %) des gewünschten Produkts 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-methyl-cyclohexyl)-amid erhalten.

5) Synthese von Beispielverbindung 180:

2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3,3-Biphenyl-propyl)-amid

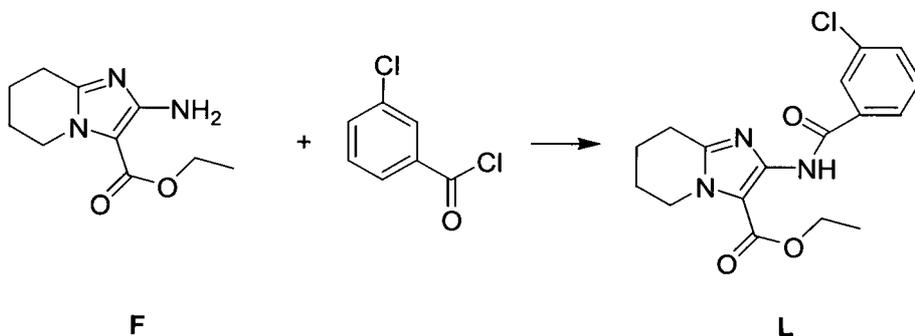


[0118] Verbindung K (0.50 g, 1.32 mmol), 3,3-Diphenylpropylamin (279 mg, 1.32 mmol) und HOAt (18 mg, 0.13 mmol) wurden in 10 mL DCM gelöst. Die Lösung wurde auf 0 °C gekühlt und EDCI (278 mg, 1.45 mmol) wurde hinzu gegeben. Die Reaktionsmischung wurde 1 Stunde bei 0 °C und bei RT über Nacht gerührt. DCM (50 mL) und ges. aq. NaCl-Lösung (50 mL) wurden hinzu gegeben und die wäßrige Phase wurde mit DCM (50 mL) extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel wurde im Vakuum entfernt. Das Rohprodukt wurde mittels Säulenchromatographie (SiO₂, DCM/MeOH 98/2) gereinigt. Es wurden 507 mg (67 %) des gewünschten Produkts 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3,3-Biphenyl-propyl)-amid erhalten.

no]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3,3-diphenyl-propyl)-amid erhalten.

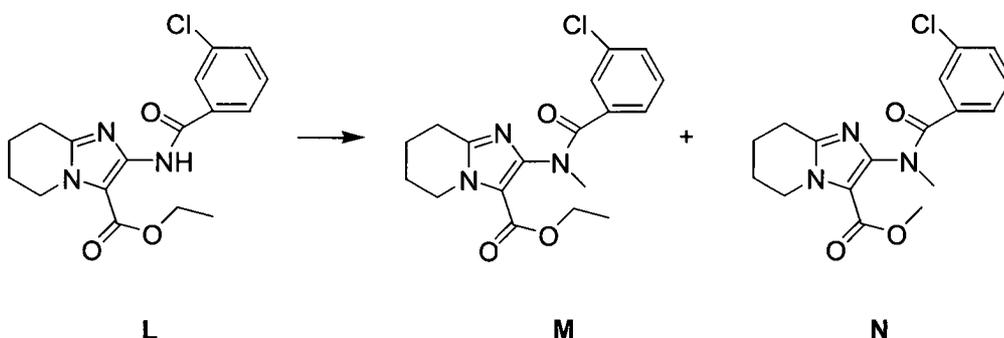
g) Synthese der Beispielverbindung 121

1) Synthese von 2-(3-Chlorbenzoylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]-pyridin-3-carboxylsäureethylester



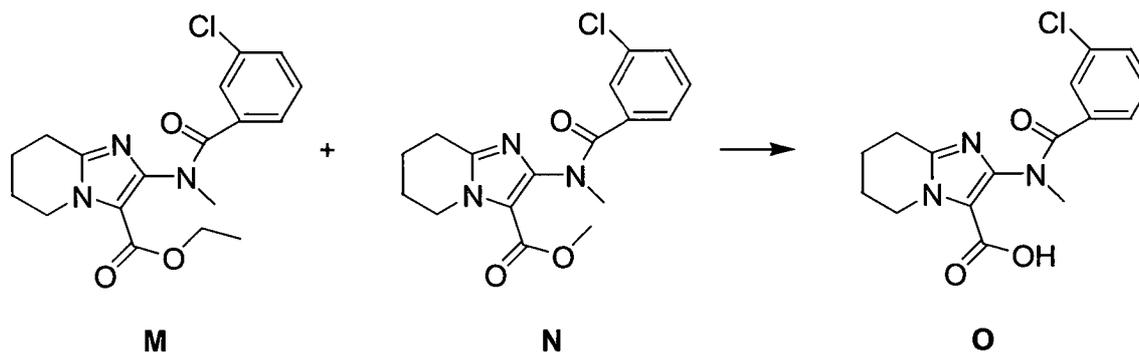
[0119] Verbindung F (521 mg, 2.5 mmol) wurde in Dioxan (10 mL) gelöst und anschließend tropfenweise mit 3-Chlorbenzoylchlorid (320 μ L, 2.5 mmol) versetzt. Die Reaktionsmischung wurde über Nacht bei RT gerührt und es wurden zusätzliche Mengen des Säurechlorid (16 μ L, 0.12 mmol) hinzu gegeben. Nach einer Stunde wurde die Reaktionsmischung mit EtOAc (250 mL) verdünnt und anschließend nacheinander mit ges. aq. NaHCO_3 -Lösung (250 mL) und 0.5 M KHSO_4 in Wasser (250 mL) gewaschen. Die wäßrigen Phasen wurden mit EtOAc (50 mL) gewaschen und die vereinigten organischen Phasen wurden wiederum mit ges. aq. NaCl -Lösung (250 mL) gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel wurde im Vakuum entfernt. Es wurden 481.6 mg (55 %) des gewünschten Produkts 2-(3-Chlorbenzoylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]-pyridin-3-carboxylsäureethylester (L) erhalten.

2) Synthese von 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäureethylester und 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäuremethylester



[0120] Natriumhydrid (60%-ige Suspension in Paraffinöl, 148.9 mg, 3.7 mmol, 3.7 Äq.) wurde zwei Mal mit Heptan gewaschen und in DMF aufgenommen. Eine Lösung von Verbindung L (350 mg, 1.0 mmol) in DMF wurde tropfenweise hinzu gegeben. Nach 25 Minuten bei RT wurde eine Lösung von Methyljodid in DMF (1.6 M, 1.9 mL, 3 mmol, 3 Äq.) langsam hinzugegeben und die Reaktionsmischung wurde bei RT über Nacht gerührt. Es wurde weiteres Methyljodid (62 μ L, 1.0 mmol, 1 Äq.) hinzu gegeben und nochmals über Nacht gerührt. Die Reaktionsmischung wurde mit EtOAc (300 mL) verdünnt und in 0.5 M KHSO_4 in Wasser (300 mL) gegossen. Die Phasen wurden getrennt und die wäßrige Phase wurde mit EtOAc (300 mL) extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit ges. aq. NaCl -Lösung (70 mL) gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel wurde im Vakuum entfernt. Es wurden 0.294 g einer Mischung von 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäureethylester und 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäuremethylester erhalten, die direkt in der nächsten Stufe eingesetzt wurde.

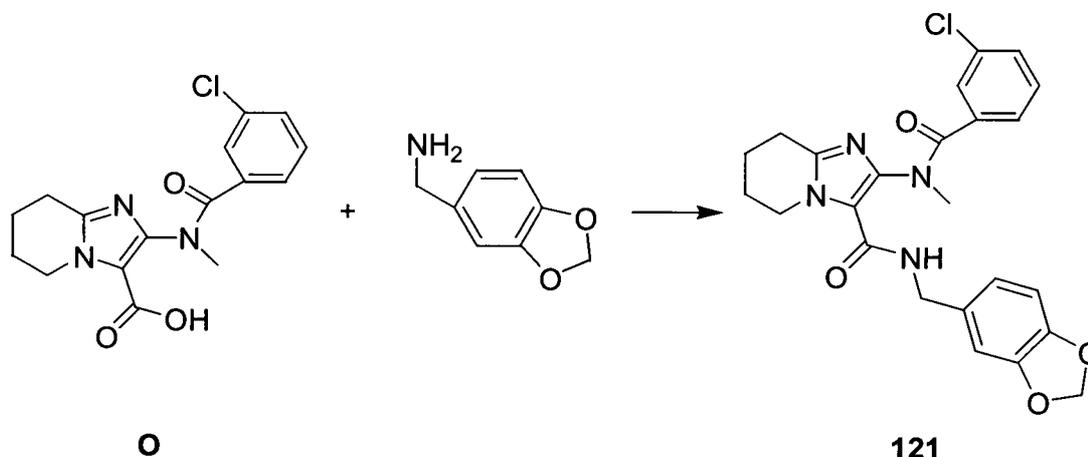
3) Synthese von 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure



[0121] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäureethylester und 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäuremethylester (zusammen 1.0 mmol) wurden in einer Lösung aus 16 mL MeOH/Dioxan/ 4 M NaOH in Wasser im Verhältnis 15/4/1 gelöst und die Lösung wurde über Nacht bei RT gerührt. Es wurde weiteres NaOH in Wasser (1.5 mL, 6 mmol) hinzu gegeben. Nach 45 Minuten wurde das Lösungsmittel im Vakuum entfernt, EtOAc (50 mL) wurde hinzu gefügt und die organische Phase wurde mit 0.5 M KHSO₄ in Wasser (50 mL) gewaschen. Die wäßrige Phase wurde mit EtOAc (60 mL) extrahiert und die vereinigten organischen Phasen wurden mit ges. aq. NaCl-Lösung gewaschen (80 mL), über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel wurde im Vakuum entfernt. Es wurden 234 mg (70 % über zwei Stufen) des gewünschten Produkts 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure erhalten.

4) Synthese von Beispielverbindung 121:

2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (benzo[1,3]dioxol-5-ylmethyl)-amid



[0122] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (232 mg, 0.70 mmol), EDCI (146.6 mg, 0.76 mmol, 1.1 Äq.) und HOAt (9.5 mg, 0.07 mmol, 0.1 Äq.) wurden in DCM (10 mL) gelöst. Anschließend wurde Piperonylamin (96 µL, 0.77 mmol, 1.1 Äq.) hinzu gegeben. Die Reaktionsmischung wurde über Nacht gerührt und anschließend das Lösungsmittel entfernt. EtOAc (70 mL) wurde hinzu gegeben und die Reaktionsmischung wurde nacheinander mit 0.5 M KHSO₄ in Wasser (70 mL) und ges. aq. NaHCO₃-Lösung (70 mL) gewaschen. Die wäßrigen Phasen wurden mit EtOAc (30 mL) extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit ges. aq. NaCl-Lösung (70 mL) gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel wurde im Vakuum entfernt. Das Rohprodukt wurde mittels Säulenchromatographie (SiO₂, DCM → DCM/ 2 % MeOH) gereinigt. Es wurden 116.8 mg (36 %) des gewünschten Produkts 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (benzo[1,3]dioxol-5-ylmethyl)-amid erhalten.

MS: [M + H⁺] 467.6

[0123] Die zuvor nicht detailliert beschriebene Herstellung der übrigen Verbindungen gemäß den nachstehend angegebenen Beispielen erfolgte ebenfalls analog den vorstehend angegebenen Herstellungsvorschriften.

ten, wobei dem Fachmann aufgrund dieser Vorschriften die jeweils eingesetzten Edukte bekannt sind.

Beispiel	Name
1	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-thiophen-2-yl-ethyl)-amid
2	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(2,5-dimethoxy-phenyl)-ethyl]-amid
3	N-{3-[4-(2-Ethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid
4	2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [3-(2-methyl-piperidin-1-yl)-propyl]-amid
5	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-phenyl-propyl)-amid
6	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-pyrrolidin-1-yl-ethyl)-amid
7	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure ethyl-pyridin-4-ylmethyl-amid
8	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-thiophen-2-yl-ethyl)-amid
9	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3-imidazol-1-yl-propyl)-amid
10	3-Chlor-N-{3-[4-(3-chlor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid
11	3-Chlor-N-methyl-N-[3-(4-phenyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid
12	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure indan-1-ylamid
13	N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(2-morpholin-4-yl-ethyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid
14	3-Chlor-N-methyl-N-{3-[4-(3-trifluormethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid
15	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3,5-bis-trifluormethyl-benzylamid
16	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-methyl-cyclohexyl)-amid
17	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-methoxy-benzylamid
18	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-p-tolyl-ethyl)-amid
19	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1,2-dimethyl-propyl)-amid
20	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-methyl-cyclohexyl)-amid
21	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-phenyl-propyl)-amid

22	4-[2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl]-piperazin-1-carbonsäure ethyl ester
23	3-Chlor-N-methyl-N-(3-{4-[(methyl-phenyl-carbamoyl)-methyl]-piperazin-1-carbonyl}-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-benzamid
24	3-Chlor-N-{3-[4-(furan-2-carbonyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid
25	N-Methyl-N-[3-(4-p-tolyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid
26	N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(3-phenyl-propyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid
27	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,6,6-trimethyl-bicyclo[3.1.1]hept-3-yl)-amid
28	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3-phenyl-propyl)-amid
29	Naphthalen-1-carbonsäure {3-[4-(4-methoxy-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-methyl-amid
30	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(4-trifluormethyl-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid
31	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-ethyl-phenyl)-amid
32	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3-methoxy-benzyl)-(tetrahydro-furan-2-ylmethyl)-amid
33	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,3-dichlor-benzylamid
34	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-benzofuran-2-ylmethyl-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid
35	3-Chlor-N-{3-[4-(4-chlor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid
36	2-({2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-3-(1H-indol-3-yl)-propionsäure methyl ester
37	N-Butyl-3-chlor-N-[3-(4-phenylacetyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid
38	2-({2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-3-methyl-pentansäure tert-butyl ester
39	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-naphthalen-1-yl-ethyl)-amid
40	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure allyl-methyl-amid
41	N-Butyl-N-[3-(3,6-dihydro-2H-pyridin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-3,4-difluor-benzamid
42	2-({2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-4-methyl-pentansäure benzyl ester
43	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-ethoxy-benzylamid
44	N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(5-methyl-pyrazin-2-carbonyl)-piperazin-1-

	carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid
45	N-[3-(4-Benzo[1,3]dioxol-5-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-3-chlor-N-methyl-benzamid
46	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,2-diphenyl-ethyl)-amid
47	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-difluor-benzylamid
48	N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(2-fluor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid
49	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-p-tolyl-ethyl)-amid
50	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (pyridin-2-ylmethyl)-amid
51	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-trifluormethyl-benzylamid
52	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure indan-1-ylamid
53	3-Chlor-N-methyl-N-[3-(4-quinolin-2-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid
54	N-Butyl-3,4-difluor-N-[3-(4-methyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid
55	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-difluor-benzylamid
56	N-[3-(4-Benzhydryl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-butyl-3,4-difluor-benzamid
57	4-Methyl-2-({2-[methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-pentansäure benzyl ester
58	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-pyrrolidin-1-yl-ethyl)-amid
59	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2-benzyloxy-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid
60	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (pyridin-3-ylmethyl)-amid
61	3-Chlor-N-{3-[4-(4-fluor-phenyl)-3,6-dihydro-2H-pyridin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid
62	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure cyclohexylamid
63	N-[3-(4-Cycloheptyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-methyl-benzamid
64	Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(4-thiophen-3-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid
65	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-dimethoxy-benzylamid
66	1-[2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl]-piperidin-4-carbonsäure ethyl ester
67	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-benzyloxy-cyclohexyl)-amid

68	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(4-phenoxy-phenyl)-ethyl]-amid
69	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(7-methyl-1H-indol-3-yl)-ethyl]-amid
70	Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(4-phenyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid
71	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(3-trifluormethyl-phenyl)-ethyl]-amid
72	N-Butyl-3-chlor-N-[3-(4-pyridin-2-yl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid
73	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-methoxy-benzylamid
74	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-difluor-benzylamid
75	3-Chlor-N-methyl-N-[3-(4-pyridin-2-yl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid
76	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-biphenyl-4-ylmethyl-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid
77	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,3-dihydro-benzo[1,4]dioxin-2-ylmethyl)-amid
78	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(1H-indol-3-yl)-ethyl]-methyl-amid
79	N-Butyl-3-chlor-N-[3-[4-(3-trifluormethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid
80	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(1H-indol-3-yl)-ethyl]-methyl-amid
81	3-Chlor-N-[3-[4-hydroxy-4-(3-trifluormethyl-phenyl)-piperidin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-methyl-benzamid
82	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-methoxymethyl-2-phenyl-ethyl)-amid
83	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2,6-dichlor-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid
84	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2-brom-4,5-dimethoxy-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid
85	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure benzo[1,3]dioxol-5-ylamid
86	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-methoxymethyl-2-phenyl-ethyl)-amid
87	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2,6-dichlor-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-amid
88	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-trifluormethoxy-benzylamid
89	N-Butyl-3,4-difluor-N-[3-[4-(isopropylcarbonyl-methyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid
90	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-

	a]pyridin-3-carbonsäure (1-methyl-3-phenyl-propyl)-amid
91	2-((2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl)-amino)-3-methyl-buttersäurebenzylester
92	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (thiophen-2-ylmethyl)-amid
93	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-methyl-cyclohexyl)-amid
94	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure benzyl-methyl-amid
95	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(2,6-dichlor-benzylsulfanyl)-ethyl]-amid
96	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,3-dihydro-benzo[1,4]dioxin-2-ylmethyl)-amid
97	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 4-trifluormethyl-benzylamid
98	N-[3-(4-Benzyl-piperidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-methyl-benzamid
99	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-trifluormethoxy-benzylamid
100	3-Chlor-N-{3-[4-(2,5-dimethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid
101	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2,6-dichlor-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid
102	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-chlor-6-methyl-benzylamid
103	N-Butyl-3-chlor-N-[3-(3,5-dimethyl-piperidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid
104	2-((2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl)-amino)-3,3-dimethyl-buttersäure tert-butylester
105	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-cyclohexyl-ethyl)-amid
106	3-Chlor-N-methyl-N-[3-(4-phenethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid
107	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-phenoxy-ethyl)-amid
108	Naphthalen-1-carbonsäure [3-(4-benzofuran-2-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-methyl-amid
109	N-[3-([1,4']Bipiperidiny-1'-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-butyl-3-chlor-benzamid
110	N-Butyl-3-chlor-N-[3-(8-fluor-1,3,4,5-tetrahydro-pyrido[4,3-b]indole-2-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid
111	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 4-dimethylamino-benzylamid
112	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-methyl-3-phenyl-propyl)-amid
113	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-methyl-benzylamid
114	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-

	a]pyridin-3-carbonsäure (2,3-dihydro-benzo[1,4]dioxin-6-yl)-amid
115	Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(4-quinolin-2-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid
116	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-cyano-ethyl)-methyl-amid
117	2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-p-tolyl-ethyl)-amid
118	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(4-fluor-phenyl)-ethyl]-amid
119	N-Butyl-N-{3-[4-(5-chlor-2-methyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-3,4-difluor-benzamid
120	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure cyclohexylamid
121	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (benzo[1,3]dioxol-5-ylmethyl)-amid
122	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-methoxy-benzylamid
123	3-tert-Butoxy-2-({2-[(3-chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl)-amino)-buttersäure methyl ester
124	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-benzyloxy-cyclohexyl)-amid
125	N-{3-[4-(4-Fluor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid
126	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (naphthalen-2-ylcarbamoylemethyl)-amid
127	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 4-trifluormethoxy-benzylamid
128	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3,3-diphenyl-propyl)-amid
129	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-benzyloxy-phenyl)-amid
130	N-{3-[4-(5-Brom-2-ethoxy-benzyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-2-phenyl-acetamid
131	N-[3-(3,4-Dihydro-1H-isochinolin-2-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-methyl-benzamid
132	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-phenyl-propyl)-amid
133	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,3-dimethyl-benzylamid
134	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(4-phenoxy-phenyl)-ethyl]-amid
135	N-{3-[4-(4-Ethoxy-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-2-phenyl-acetamid
136	Naphthalen-1-carbonsäure {3-[4-(2-ethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-methyl-amid
137	N-[3-(4-Benzo[1,3]dioxol-5-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-butyl-3,4-difluor-benzamid
138	N-Butyl-N-{3-[4-(2,5-dimethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-

	tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-3,4-difluor-benzamid
139	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [(4-chlor-phenyl)-phenyl-methyl]-amid
140	N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(4-chlor-benzyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid
141	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-naphthalen-2-yl-ethyl)-amid
142	2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-fluor-benzylamid
143	N-[3-(1,4-Dioxa-8-aza-spiro[4.5]decane-8-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-methyl-2-phenyl-acetamid
144	Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(1,3,4,9-tetrahydro-b-carbolin-2-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid
145	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-methyl-3-phenyl-propyl)-amid
146	3-Chlor-N-methyl-N-{3-[4-(2,4,6-trimethoxy-benzyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid
147	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure benzhydryl-amid
148	Naphthalen-1-carbonsäure {3-[4-(2-chlor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-methyl-amid
149	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (thiophen-2-ylmethyl)-amid
150	N-Butyl-N-{3-[4-(4-chlor-benzyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-3,4-difluor-benzamid
151	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3-phenyl-propyl)-amid
152	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-tert-butyl-phenyl)-amid
153	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-ethyl-phenyl)-amid
154	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure cyclohexylamid
155	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [3-(methyl-phenyl-amino)-propyl]-amid
156	2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(3-trifluormethyl-phenyl)-ethyl]-amid
157	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 4-chlor-benzylamid
158	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-fluor-benzylamid
159	2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure p-tolylamid
160	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-phenoxy-ethyl)-amid
161	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-

	a)pyridin-3-carbonsäure (2-benzyloxy-cyclohexyl)-amid
162	Naphthalen-1-carbonsäure {3-[4-(4-fluor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-methyl-amid
163	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(4-chlor-phenyl)-propyl]-amid
164	N-Butyl-3,4-difluor-N-[3-(thiomorpholine-4-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid
165	2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridine-3-carboxylsäure (1-adamantan-1-yl-ethyl)-amid
166	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [(4-chlor-phenyl)-phenyl-methyl]-amid
167	N-Methyl-N-{3-[4-(4-trifluormethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid
168	2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-biphenyl-4-ylmethyl-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid
169	N-[3-(4-Benzoyl-piperidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-3-chlor-N-methyl-benzamid
170	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-tert-butyl-phenyl)-amid
171	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3,3-dimethyl-butyl)-amid
172	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2-brom-4,5-dimethoxy-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid
173	Naphthalen-1-carbonsäure methyl-{3-[4-(3-phenyl-allyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-amid
174	Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(4-phenethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid
175	N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(3-trifluormethyl-phenyl)-piperidin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid
176	N-Methyl-2-phenyl-N-{3-[4-(3-phenyl-propyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-acetamid
177	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-fluor-benzylamid
178	N-Butyl-N-{3-[4-(2-chlor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-3,4-difluor-benzamid
179	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure benzo[1,3]dioxol-5-ylamid
180	2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3,3-diphenyl-propyl)-amid
181	2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,3-dihydro-benzo[1,4]dioxin-6-yl)-amid
182	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(3,4-dimethoxy-phenyl)-ethyl]-amid
183	Naphthalen-1-carbonsäure [3-(4-benzoyl-piperidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-methyl-amid
184	4-Methyl-2-({2-[methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-valeriansäure tert-

	butylester
185	2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-phenoxy-phenyl)-amid
186	N-Methyl-2-phenyl-N-[3-(4-phenyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-acetamid
187	N-Butyl-3,4-difluor-N-{3-[4-(5-trifluormethyl-pyridin-2-yl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid
188	2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-dichlor-6-methyl-benzylamid
189	[4-({2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-phenyl]-carbaminsäure tert-butyl ester
190	N-Methyl-2-phenyl-N-[3-(2-pyrrolidin-1-ylmethyl-pyrrolidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-acetamid
191	4-[2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl]-piperazin-1-carbonsäure tert-butyl ester

Pharmakologische Daten

[0124] Die Affinität der erfindungsgemäßen substituierten 5,6,7,8-Tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen für die Batrachotoxin-(BTX)-Bindungsstelle und den μ -Opioid-Rezeptor, sowie die agonistische bzw. antagonistische Wirkung der erfindungsgemäßen substituierten 5,6,7,8-Tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen am Vanilloid-Rezeptor 1 (VR1/TRPV1-Rezeptor), wurden wie vorstehend beschrieben bestimmt.

[0125] Die untersuchten erfindungsgemäßen 5,6,7,8-Tetrahydroimidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen zeigen eine ausgezeichnete Wirkung auf den Vanilloid-Rezeptor 1 (VR1/TRPV1-Rezeptor).

[0126] Darüber hinaus zeigen diese erfindungsgemäßen Verbindungen auch ausgezeichnete Affinitäten für die Batrachotoxin-(BTX)-Bindungsstelle des Natriumkanals und den μ -Opioid-Rezeptor.

Verbindung gemäß Beispiel	VR1 (Ratte) (% Stimulation im Vgl. zu 10 μ M CP)	VR1 (Ratte) (% Hemmung im Vgl. zu 10 μ M CP)	BTX Inhibierung (Ratte) (% Hemmung)	μ -Opioid Rezeptor (Mensch) (% Hemmung)
2			59	
3			34	
4				
5				
9			36	
11				
12	48	73		
14			41	
15			68	35
16	90	100	47	
17				
19	49	87		
20				
21				
22				

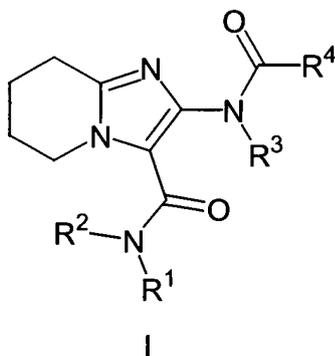
26			93	
27			35	
28		43	42	
30			85	
31			70	
33			49	
34			83	
38		40		
39	38	99	47	
40				
42	43	90		
43	59	104	40	
45			41	
46			67	
47	60	81	44	
48			89	
49			37	
51	47	96	35	
52	53	101	45	
53			64	
56		53	65	
57	40	103	31	
58			50	
59			95	
61			38	
65		30		
66				
67		52	51	
68			87	
69		43	48	
71			36	
72			39	
73		40		
74	32	94		
76			95	
77		63	56	
79		62	83	
81			33	
82		77		
83			80	
84			87	
85			30	
86	34	114	42	
87			93	
88	44	132	31	
91		121	48	

93	51	171		
95		52	68	53
96			33	
99			33	
100			74	
101			54	
102	66	97		
104		45		
105		32		
106			40	30
107			39	
108			41	
109	68	90		
112				51
113	39	89	31	
118		66		
119			83	
120	67	97	61	
122		62		
123	36	98		
124	37	93	48	
127			60	
128		39	85	
129			76	
130			67	
132	67	99		
133		64	34	
134			93	
136			54	
137			72	
138			80	
139		43	73	
140			81	
141			41	
144			31	
145	30	82	67	
146			70	
147		53	56	
148			35	
149	43	72		
150			69	
152			92	
154			92	
156		34	40	
157			43	
158	33	53	33	

159			37	
161	32	91	49	
163	83	53	40	
165		47	39	
166			72	
167			44	
168			92	
170			80	
171	46	104	47	
172			96	
173			74	
174			47	
175			65	
176			71	
178			79	
179				
180	56	102	62	47
181			82	58
184	35	41		
185		56	74	
186				48
187		37	41	
188				59
189			93	

Patentansprüche

1. Substituierte 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der allgemeinen Formel I,



worin

R¹ und R², unabhängig voneinander, jeweils für einen Wasserstoff-Rest;

-C(=O)-OR⁵;

-(CHR⁶)-(CH₂)_m-C(=O)-OR⁷ mit m = 0, 1, 2, 3, 4 oder 5;

-C(=O)-R⁸;

-(CH₂)_n-C(=O)-R⁹ mit n = 1, 2, 3, 4 oder 5;

-C(=O)-NH-R¹⁰;

-(CH₂)_o-C(=O)-NHR¹¹ mit o = 0, 1, 2, 3, 4 oder 5;

-C(=O)-NR¹²R¹³;

-(CH₂)_p-C(=O)-NR¹⁴R¹⁵ mit p = 1, 2, 3, 4 oder 5;

-(CHR¹⁶)-X_q-(CHR¹⁷)_r-Y_s-(CHR¹⁸)_t-Z_u-R¹⁹ mit q = 0 oder 1, r = 0 oder 1, s = 0 oder 1, t = 0 oder 1, u = 0 oder 1,

worin X, Y und Z, unabhängig voneinander, jeweils für O, S, NH, N(CH₃), N(C₂H₅) oder N[CH(CH₃)₂] stehen;

für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C₁₋₁₀ aliphatischen Rest;

für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest;

schen Rest, der mit einer linearen oder verzweigten, ggf. substituierten C₁₋₅-Alkyl-Gruppe überbrückt und/oder mit einem gesättigten, ungesättigten oder aromatischen, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann;

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann, stehen; oder R¹ und R² zusammen mit dem sie verbindenden Stickstoffatom als Ringglied einen gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen heterocycloaliphatischen Rest bilden, der mit einem gesättigten, ungesättigten oder aromatischen, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann und/oder über ein gemeinsames Ringatom zusammen mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten 5-, 6- oder 7-gliedrigen cycloaliphatischen Rest eine ggf. substituierte Spiro-Verbindung bilden kann,

wobei jeweils der heterocycloaliphatische Rest und ggf. der cycloaliphatische Rest der Spiro-Verbindung mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus R²⁰, -(CHR²¹)-(CH₂)_v-(CH₂)_w-R²² mit v = 0 oder 1 und w = 0 oder 1, -CH=CH-R²³, -(CH₂)_x-C(=O)-OR²⁴ mit x = 0, 1, 2, 3, 4 oder 5; -(CH₂)_y-C(=O)-R²⁵ mit y = 0, 1, 2, 3, 4 oder 5; -(CH₂)_z-C(=O)-NHR²⁶ mit z = 0, 1, 2, 3, 4 oder 5; -(CH₂)_{aa}-C(=O)-NR²⁷R²⁸ mit aa = 0, 1, 2, 3, 4 oder 5; F; Cl; Br; -CN; -CF₃; -NO₂; Oxo(=O); Thioxo (=S); -C₁₋₅-Alkyl; -OH; -O-C₁₋₅-Alkyl; -SH; -S-C₁₋₅-Alkyl; -NH₂; -NH-C₁₋₅-Alkyl und -N(C₁₋₅-Alkyl)₂ substituiert und/oder jeweils weitere 1, 2, 3, 4 oder 5 Heteroatom(e) unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel als Ringglieder) aufweisen kann;

R³ für einen Wasserstoff-Rest;

für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C₁₋₁₀ aliphatischen Rest, für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest, der über eine lineare oder verzweigte, ggf. substituierte C₁₋₅-Alkyl-, C₂₋₅-Alkenyl- oder C₂₋₅-Alkynyl-Gruppe gebunden sein kann,

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert und/oder über eine lineare oder verzweigte, ggf. substituierte C₁₋₅-Alkyl-, C₂₋₅-Alkenyl- oder C₂₋₅-Alkynyl-Gruppe gebunden sein kann, steht;

R⁴ für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C₁₋₁₀ aliphatischen Rest,

für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest, der über eine lineare oder verzweigte, ggf. substituierte C₁₋₅-Alkyl-, C₂₋₅-Alkenyl- oder C₂₋₅-Alkynyl-Gruppe gebunden sein kann,

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert und/oder über eine lineare oder verzweigte, ggf. substituierte C₁₋₅-Alkyl-, C₂₋₅-Alkenyl- oder C₂₋₅-Alkynyl-Gruppe gebunden sein kann, steht;

R⁵, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R²⁴, R²⁵, R²⁶, R²⁷ und R²⁸, unabhängig voneinander, jeweils für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C₁₋₁₀ aliphatischen Rest, für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest, der mit einem gesättigten, ungesättigten oder aromatischen, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert und/oder über eine lineare oder verzweigte, ggf. substituierte C₁₋₅-Alkyl-, C₂₋₅-Alkenyl- oder C₂₋₅-Alkynyl-Gruppe gebunden sein kann,

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert und/oder über eine lineare oder verzweigte, ggf. substituierte C₁₋₅-Alkyl-, C₂₋₅-Alkenyl- oder C₂₋₅-Alkynyl-Gruppe gebunden sein kann, stehen;

R⁶ für einen Wasserstoff-Rest;

für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C₁₋₁₀ aliphatischen Rest, der ggf. 1, 2, 3, 4 oder 5 Heteroatom(e) unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff als Kettenglieder) aufweisen kann;

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert und/oder über eine lineare oder verzweigte, ggf. substituierte C₁₋₅-Alkyl-, C₂₋₅-Alkenyl- oder C₂₋₅-Alkynyl-Gruppe gebunden sein kann, steht;

R¹⁶, R¹⁷ und R¹⁸, unabhängig voneinander, jeweils

für einen Wasserstoff-Rest;

für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C₁₋₁₀ aliphatischen Rest, der 1, 2, 3, 4 oder 5 Heteroatom(e) unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff als Kettenglied(er) aufweisen kann

oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann, stehen;
 R^{19} für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest, der mit 1, 2, 3, 4 oder 5 linearen oder verzweigten, ggf. substituierten C_{1-5} -Alkylen-Gruppen überbrückt und/oder mit einem gesättigten, ungesättigten oder aromatischen, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann;
oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann, steht;
 R^{20} für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C_{1-10} aliphatischen Rest;
für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest
oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann, steht;
 R^{21} für einen Wasserstoff-Rest;
für einen linearen oder verzweigten, gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten C_{1-10} aliphatischen Rest;
für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest
oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann, steht;
und
 R^{22} und R^{23} , unabhängig voneinander, jeweils
für einen ungesättigten oder gesättigten, ggf. substituierten 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- oder 9-gliedrigen cycloaliphatischen Rest
oder für einen ggf. substituierten 5- bis 14-gliedrigen Aryl- oder Heteroaryl-Rest, der mit einem gesättigten oder ungesättigten, ggf. substituierten mono- oder polyzyklischen Ringsystem kondensiert sein kann, stehen;
wobei
die vorstehend genannten C_{1-10} aliphatischen Reste jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH und -NH₂ substituiert sein können;
die vorstehend genannten cycloaliphatischen Reste jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Oxo (=O), Thioxo (=S), F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -O- C_{1-5} -Alkyl, -NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -S-CF₃, -SH, -S- C_{1-5} -Alkyl, - C_{1-5} -Alkyl, -C(=O)-OH, -C(=O)-O- C_{1-5} -Alkyl, -NH- C_{1-5} -Alkyl, -N(C_{1-5} -Alkyl)₂, -(CH₂)-Benzo[b]furanyl, -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl und Benzyl substituiert sein können, wobei jeweils der zyklische Teil der Reste -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl, -(CH₂)-Benzo[b]furanyl und Benzyl mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, -OH, -CF₃, -SF₅, -CN, -NO₂, - C_{1-5} -Alkyl, -O- C_{1-5} -Alkyl, -O-CF₃, -S-CF₃, Phenyl und -O-Benzyl substituiert sein kann
und die vorstehend genannten cycloaliphatischen Reste jeweils ggf. 1, 2, 3, 4 oder 5 Heteroatom(e) unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel als Ringglied(er) aufweisen können;
die vorstehend genannten C_{1-5} -Alkylen-, C_{2-5} -Alkenylen- oder C_{2-5} -Alkinylen-Gruppen jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, -OH, -SH, -NH₂, -CN, NO₂ und Phenyl substituiert sein können;
die Ringe der vorstehend genannten mono- oder polyzyklischen Ringsysteme ggf. jeweils mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Oxo (=O), Thioxo (=S), F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -O- C_{1-5} -Alkyl, -NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -S-CF₃, -SH, -S- C_{1-5} -Alkyl, - C_{1-5} -Alkyl, -C(=O)-OH, -C(=O)-O- C_{1-5} -Alkyl, -NH- C_{1-5} -Alkyl, -N(C_{1-5} -Alkyl)₂, -(CH₂)-Benzo[b]furanyl, -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl und Benzyl substituiert sein können, wobei jeweils der zyklische Teil der Reste -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl, -(CH₂)-Benzo[b]furanyl und Benzyl mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, -OH, -CF₃, -SF₅, -CN, -NO₂, - C_{1-5} -Alkyl, -O- C_{1-5} -Alkyl, -O-CF₃, -S-CF₃, Phenyl und -O-Benzyl substituiert sein kann
und die Ringe der vorstehend genannten mono- oder polyzyklischen Ringsysteme jeweils 5-, 6- oder 7-gliedrig sind und jeweils ggf. 1, 2, 3, 4 oder 5 Heteroatom(e) als Ringglied(er) aufweisen können, die unabhängig voneinander aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel ausgewählt sind;
und die vorstehend genannten Aryl- oder Heteroaryl-Reste jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -O- C_{1-5} -Alkyl, -NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -S-CF₃, -SH, -S- C_{1-5} -Alkyl, - C_{1-5} -Alkyl, -C(=O)-OH, -C(=O)-O- C_{1-5} -Alkyl, -NH- C_{1-5} -Alkyl, -N(C_{1-5} -Alkyl)₂, -NH-C(=O)-O- C_{1-5} -Alkyl, -C(=O)-H, -C(=O)- C_{1-5} -Alkyl, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH- C_{1-5} -Alkyl, C(=O)-N-(C_{1-5} -Alkyl)₂, -(CH₂)-Benzo[b]furanyl, -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl und Benzyl substituiert sein können

nen, wobei jeweils der zyklische Teil der Reste -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl, -(CH₂)_n-Benzo[b]furanyl und Benzyl mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, -OH, -CF₃, -SF₅, -CN, -NO₂, -C₁₋₅-Alkyl, -O-C₁₋₅-Alkyl, -O-CF₃, -S-CF₃, Phenyl und -O-Benzyl substituiert sein kann,

und

die vorstehend genannten Heteroaryl-Reste jeweils ggf. 1, 2, 3, 4 oder 5 Heteroatom(e) unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel als Ringglied(er) aufweisen können;

jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

2. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

R¹ für einen Wasserstoff-Rest; -C(=O)-OR⁵; -(CHR⁶)-(CH₂)_m-C(=O)-OR⁷ mit m = 0, 1, 2, 3, 4 oder 5; -C(=O)-NH-R¹⁰; -(CH₂)_n-C(=O)-NHR¹¹ mit o = 0, 1, 2, 3, 4 oder 5; -(CHR¹⁶)-X_q-(CHR¹⁷)_r-Y_s-(CHR¹⁸)_t-Z_u-R¹⁹ mit q = 0 oder 1, r = 0 oder 1, s = 0 oder 1, t = 0 oder 1, u = 0 oder 1, worin X, Y und Z, unabhängig voneinander, jeweils für O, S, NH und N(CH₃) stehen;

für einen ggf. substituierten Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, -(CH₂)_n-(CH₂)_m-(CN), n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -C(H)(CH₃)-C(H)(CH₃)₂ und -(CH₂)_n-(CH₂)_m-(C(CH₃)₃),

für einen Alkenyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Vinyl, 1-Propenyl und 2-Propenyl,

für einen (hetero)cycloaliphatischen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cycloheptenyl, Imidazolidinyl, Tetrahydrofuranlyl, Tetrahydrothiophenyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Morpholinyl, Piperazinyl, Thiomorpholinyl, Tetrahydropyranlyl, Azepanyl, Diazepanyl, Dithiolanyl, (6,6)-Dimethyl-[3.1.1]-bicycloheptyl, Indanyl, Indenyl, (1,4)-Benzodioxanyl, (1,2,3,4)-Tetrahydronaphthyl, (1,2,3,4)-Tetrahydrochinolyl und (1,2,3,4)-Tetrahydrochinazolyl, wobei der (hetero)cycloaliphatische Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -NH₂, -O-CF₃, -SH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -S-CH₃, -S-C₂H₅, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, Oxo (=O), -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃), -N(H)(C₂H₅), -NO₂, -SCF₃, -C(=O)-OH, -(CH₂)_n-Benzo[b]furanyl, -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl und Benzyl substituiert sein kann, wobei jeweils der zyklische Teil der -(CH₂)_n-Benzo[b]furanyl, -O-Phenyl, -O-Benzyl-, Benzyl- und Phenyl-Reste mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, -OH, -CF₃, -SF₅, -CN, -NO₂, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, n-Propyl, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-CF₃, Phenyl und -O-Benzyl substituiert sein kann,

oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, (1,4)-Benzodioxanyl, Thiophenyl, Furanyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl, Pyrazinyl, Pyranlyl, Triazolyl, Pyridinyl, Imidazolyl, Indolyl, Isoindolyl, Benzo[b]furanyl, Benzo[b]thiophenyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Pyrimidinyl, Indazolyl, Chinazolyl, Chinolyl und Isochinolyl, wobei der Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -CF₃, -O-CF₃, -S-CF₃, -SF₅, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-Phenyl, -O-Benzyl, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃), -N(H)(C₂H₅), -NH-C(=O)-O-CH₃, -NH-C(=O)-O-C₂H₅ und -NH-C(=O)-O-C(CH₃)₃ substituiert sein kann, steht.

3. Verbindungen gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass

R² für einen Wasserstoff-Rest,

für -(CHR¹⁶)-R¹⁹,

oder für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl steht.

4. Verbindungen gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, dass

R¹ und R² zusammen mit dem sie verbindenden Stickstoffatom als Ringglied einen heterocycloaliphatischen Rest bilden ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Pyrrolidinyl; Piperidinyl; (1,2,3,6)-Tetrahydropyridinyl; (1,2,3,4)-Tetrahydropyridinyl und (1,4)-Dioxa-8-aza-spiro[4.5]decan, wobei der heterocycloaliphatische Rest jeweils mit 1 oder 2 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus R²⁰, -(CHR²¹)-(CH₂)_v-R²² mit v = 0 oder 1; -C(=O)-OR²⁴; -C(=O)-R²⁵; F; Cl; Br; -CN; -CF₃ und -OH substituiert sein kann,

oder

R¹ und R² zusammen mit dem sie verbindenden Stickstoffatom als Ringglied einen heterocycloaliphatischen

Rest bilden ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus (1,3,4,5)-Tetrahydropyrido[4,3-b]indolyl; (3,4)-Dihydro-1H-isochinolyl und (1,3,4,9)-Tetrahydro-[b]-carbolinyl, wobei der heterocycloaliphatische Rest jeweils mit 1 oder 2 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, -CN, -CF₃ und -OH substituiert sein kann,

oder

R¹ und R² zusammen mit dem sie verbindenden Stickstoffatom als Ringglied einen heterocycloaliphatischen Rest bilden ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Imidazolidinyl, (1,3)-Thiazolidinyl, Piperazinyl, Morpholinyl und Thiomorpholinyl, wobei der heterocycloaliphatische Rest jeweils mit 1 oder 2 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus R²⁰, -(CHR²¹)-(CH₂)_v-(CH₂)_w-R²² mit v = 0 oder 1 und w = 0 oder 1, -CH=CH-R²³, -C(=O)-OR²⁴; -C(=O)-R²⁵; -(CH₂)_z-C(=O)-NHR²⁶ mit z = 1 und -(CH₂)_{aa}-C(=O)-NR²⁷R²⁸ mit aa = 1 substituiert sein kann.

5. Verbindungen gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass R³ für einen Wasserstoff-Rest oder für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl und n-Pentyl steht.

6. Verbindungen gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass R⁴ für einen Phenyl- oder Naphthyl-Rest steht, der jeweils mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, F, Cl, Br, -CN, -SF₅, -S-CF₃, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃), -N(H)(C₂H₅), SH, -NO₂, -CF₃, -OCF₃, -OH, -O-CH₃ und -O-C₂H₅ substituiert und/oder über eine -(CH₂)-, -(CH₂)₂- oder -(CH₂)₃-Gruppe gebunden sein kann.

7. Verbindungen gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, dass R⁵, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴ und R¹⁵, unabhängig voneinander, jeweils für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl, wobei der Alkyl-Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH und -NH₂ substituiert sein kann, oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, (1,4)-Benzodioxanyl, Thiophenyl, Furanyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl, Pyrazinyl, Pyranyl, Triazolyl, Pyridinyl, Imidazolyl, Indolyl, Isoindolyl, Benzo[b]furanyl, Benzo[b]thiophenyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Pyrimidinyl, Indazolyl, Chinazolinyl, Chinolinyl und Isochinolinyl, wobei der Rest jeweils über eine -(CH₂)-, -(CH₂)₂- oder -(CH₂)₃-Gruppe gebunden und/oder ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -CF₃, -O-CF₃, -S-CF₃, -SF₅, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-Phenyl, -O-Benzyl, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃), -N(H)(C₂H₅), -NH-C(=O)-O-CH₃, -NH-C(=O)-O-C₂H₅ und -NH-C(=O)-O-C(CH₃)₃ substituiert sein kann, stehen.

8. Verbindungen gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 7, dadurch gekennzeichnet, dass R⁶ für einen Wasserstoff-Rest, für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, n-Pentyl, sec-Pentyl, -C(H)(CH₃)-C(H)(CH₃)₂, -(CH₂)-(CH₂)-(C(CH₃)₃), -C(H)(CH₃)(O(C(CH₃)₃)) und n-Hexyl, wobei der Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH und -NH₂ substituiert sein kann, oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, (1,4)-Benzodioxanyl, Thiophenyl, Furanyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl, Pyrazinyl, Pyranyl, Triazolyl, Pyridinyl, Imidazolyl, Indolyl, Isoindolyl, Benzo[b]furanyl, Benzo[b]thiophenyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Pyrimidinyl, Indazolyl, Chinazolinyl, Chinolinyl und Isochinolinyl, wobei der Rest jeweils über eine -(CH₂)-, -(CH₂)₂- oder -(CH₂)₃-Gruppe gebunden und/oder ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -CF₃, -O-CF₃, -S-CF₃, -SF₅, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-Phenyl, -O-Benzyl, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃), -N(H)(C₂H₅), -NH-C(=O)-O-CH₃, -NH-C(=O)-O-C₂H₅ und -NH-C(=O)-O-C(CH₃)₃ substituiert sein kann, steht.

9. Verbindungen gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 8, dadurch gekennzeichnet, dass R¹⁶, R¹⁷ und R¹⁸, unabhängig voneinander, jeweils für einen Wasserstoff-Rest, für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, n-Pentyl, sec-Pentyl, -C(H)(CH₃)-C(H)(CH₃)₂, -(CH₂)-(CH₂)-(C(CH₃)₃), -(CH₂)-O-(CH₃)

und n-Hexyl, wobei der Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH und -NH₂ substituiert sein kann, oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl und Naphthyl, wobei der Rest jeweils mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -CF₃, -O-CF₃, -S-CF₃, -SF₅, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-Phenyl, -O-Benzyl, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃), -N(H)(C₂H₅), -NH-C(=O)-O-CH₃, -NH-C(=O)-O-C₂H₅ und -NH-C(=O)-O-C(CH₃)₃ substituiert sein kann, stehen.

10. Verbindungen gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 9, dadurch gekennzeichnet, dass R¹⁹ für einen (hetero)cycloaliphatischen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cycloheptenyl, Imidazolidinyl, Tetrahydrofuranlyl, Tetrahydrothiophenyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Morpholinyl, Piperazinyl, Thiomorpholinyl, Tetrahydropranyl, Azepanyl, Diazepanyl, Dithiolanyl, (6,6)-Dimethyl-[3.1.1]-bicycloheptyl, Adamantyl (Tricyclo-[3.3.1.1^{3,7}]-decanyl), Indanyl, Indenyl, (1,4)-Benzodioxanyl, (1,2,3,4)-Tetrahydronaphthyl, (1,2,3,4)-Tetrahydrochinolinyl und (1,2,3,4)-Tetrahydrochinazolinyl, wobei der (hetero)cycloaliphatische Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -NH₂, -O-CF₃, -SH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -S-CH₃, -S-C₂H₅, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, Oxo (=O), -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃), -N(H)(C₂H₅), -NO₂, -SCF₃, -C(=O)-OH, -(CH₂)-Benzo[b]furanlyl, -O-Phenyl, -O-Benzyl, Phenyl und Benzyl substituiert sein kann, oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, (1,4)-Benzodioxanyl, Thiophenyl, Furanyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl, Pyrazinyl, Pyranyl, Triazolyl, Pyridinyl, Imidazolyl, Indolyl, Isoindolyl, Benzo[b]furanlyl, Benzo[b]thiophenyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Pyrimidinyl, Indazolyl, Chinazolinyl, Chinolinyl und Isochinolinyl, wobei der Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -CF₃, -O-CF₃, -S-CF₃, -SF₅, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-Phenyl, -O-Benzyl, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃), -N(H)(C₂H₅), -NH-C(=O)-O-CH₃, -NH-C(=O)-O-C₂H₅ und -NH-C(=O)-O-C(CH₃)₃ substituiert sein kann, steht.

11. Verbindungen gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 10, dadurch gekennzeichnet, dass R²⁰ für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl und n-Pentyl, für einen (hetero)cycloaliphatischen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyclopentyl, Cyclohexyl, Piperidinyl und Cycloheptyl, wobei der (hetero)cycloaliphatische Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -NH₂, -O-CF₃, -SH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl substituiert sein kann, oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, Thiophenyl, Furanyl, Pyridinyl, Imidazolyl, Indolyl, Benzo[b]furanlyl, Benzo[b]thiophenyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Pyrimidinyl und Chinolinyl, wobei der Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, F, Cl, Br, -CN, -SF₅, -O-CF₃, -S-CF₃, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃), -N(H)(C₂H₅), -SH, -NO₂, -CF₃, -OCF₃, -OH, -O-CH₃ und -O-C₂H₅ substituiert sein kann, steht.

12. Verbindungen gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 11, dadurch gekennzeichnet, dass R²¹ für einen Wasserstoff-Rest oder für einen Phenyl- oder Naphthyl-Rest, der mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, F, Cl und Br substituiert sein kann, steht.

13. Verbindungen gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 12, dadurch gekennzeichnet, dass R²² und R²³, unabhängig voneinander, jeweils für einen (hetero)cycloaliphatischen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Pyrrolidinyl, Morpholinyl und Thiomorpholinyl, wobei der (hetero)cycloaliphatische Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -NH₂, -O-CF₃, -SH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl substituiert sein kann, oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, Thiophenyl, Furanyl, Pyridinyl, Imidazolyl, Indolyl, Benzo[b]furanlyl, Benzo[b]thiophenyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Pyrimidinyl und Chinolinyl, wobei der Rest jeweils ggf. mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Pro-

pyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, F, Cl, Br, -CN, -SF₅, -O-CF₃, -S-CF₃, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(H)(CH₃), -N(H)(C₂H₅), -SH, -NO₂, -CF₃, -OCF₃, -OH, -O-CH₃ und -O-C₂H₅ substituiert sein kann, stehen.

14. Verbindungen gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 13, dadurch gekennzeichnet, dass R²⁴ für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl und tert-Butyl steht,

R²⁵ für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, Furanyl, Pyrazinyl und Pyrimidinyl, der über eine -(CH₂)-, -(CH₂)₂- oder -(CH₂)₃-Gruppe gebunden und/oder mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl und iso-Propyl substituiert sein kann, steht,

R²⁶ für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl und iso-Propyl steht,

R²⁷ für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, iso-Propyl und n-Propyl oder für einen Phenyl-Rest steht,

und

R²⁸ für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, iso-Propyl und n-Propyl oder für einen Phenyl-Rest steht.

15. Verbindungen gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 14, dadurch gekennzeichnet, dass

R¹ für -C(=O)-OR⁵; -(CHR⁶)-C(=O)-OR⁷;

-C(=O)-NHR¹¹; -(CH₂)-C(=O)-NHR¹¹; -(CHR¹⁶)-R¹⁹; -(CHR¹⁶)-(CHR¹⁷)-R¹⁹;

-(CHR¹⁶)-(CHR¹⁷)-O-R¹⁹; -(CHR¹⁶)-(CHR¹⁷)-(CHR¹⁸)-R¹⁹; -(CHR¹⁶)-(CHR¹⁷)-S-(CHR¹⁸)-R¹⁹;

-(CHR¹⁶)-(CHR¹⁷)-(CHR¹⁸)-N(CH₃)-R¹⁹,

für einen ggf. substituierten Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, -CH₂-CH₂-CN, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -CH(CH₃)-CH(CH₃)₂ und -CH₂-CH₂-C(CH₃)₃, für einen Alkenyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus 1-Propenyl und 2-Propenyl,

für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, (6,6)-Dimethyl-[3.1.1]-bicycloheptyl, Indanyl und Indenyl, wobei der Rest jeweils mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, n-Propyl und -O-Benzyl substituiert sein kann,

für einen Pyrrolidinyl-Rest, der mit einem -(CH₂)-Benzo[b]furanyl- oder Benzyl-Rest substituiert sein kann, wobei der zyklische Teil des Benzyl-Rests jeweils mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, -OH, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, n-Propyl, -CF₃, -O-CH₃, -O-C₂H₅, Phenyl und -O-Benzyl substituiert sein kann,

oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl und (1,4)-Benzodioxanyl steht, wobei der Rest jeweils mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, -O-Phenyl, -O-Benzyl, -NH-C(=O)-O-CH₃, -NH-C(=O)-O-C₂H₅ und -NH-C(=O)-O-C(CH₃)₃ substituiert sein kann;

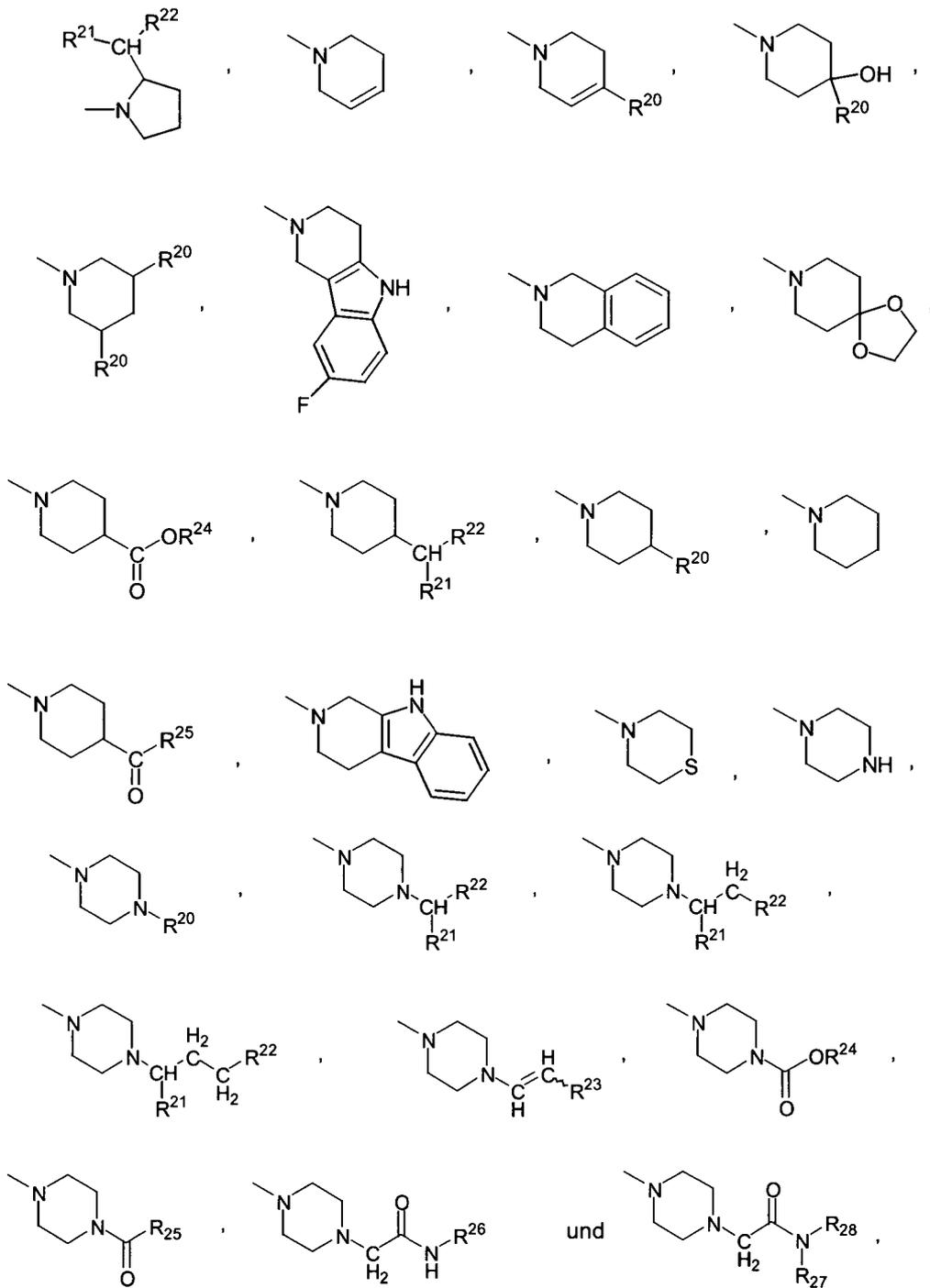
R² für einen Wasserstoff-Rest,

-(CHR¹⁶)-R¹⁹,

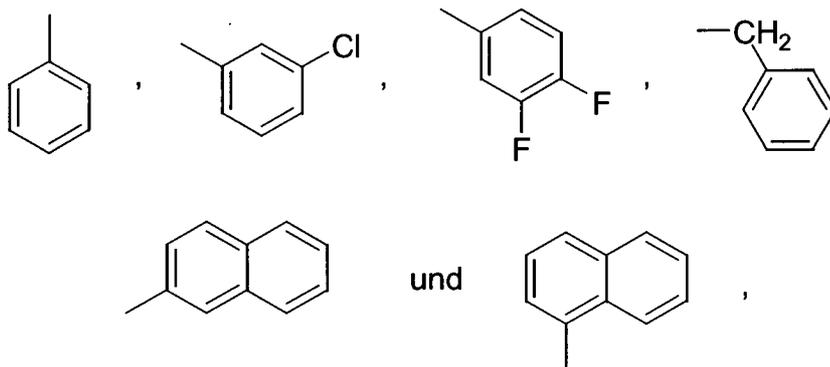
oder für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl steht;

oder

R¹ und R² zusammen mit dem sie verbindenden Stickstoffatom als Ringglied einen Rest bilden, der ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus



R³ für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl;
 R⁴ für einen Rest steht, der ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus



R⁵, R⁷ und R¹¹, unabhängig voneinander, jeweils

für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl und tert-Butyl;

oder für einen Benzyl- oder Naphthyl-Rest stehen;

R⁶ für einen Wasserstoff-Rest,

für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, n-Pentyl, sec-Pentyl, neo-Pentyl und $-C(H)(CH_3)(O(C(CH_3)_3))$,

oder für einen Indolyl-Rest, der über eine $-(CH_2)$ -Gruppe gebunden ist, steht;

R¹⁶ für einen Wasserstoff-Rest,

für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, iso-Propyl, n-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl und $-(CH_2)-O-(CH_3)$

oder für einen Phenyl-Rest steht;

R¹⁷ für einen Wasserstoff-Rest,

für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, iso-Propyl, n-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl und tert-Butyl oder für einen Phenyl-Rest steht;

R¹⁸ für einen Wasserstoff-Rest

oder für einen Phenyl-Rest steht;

R¹⁹ für einen (hetero)cycloaliphatischen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Tetrahydrofuranlyl, Tetrahydrothiophenyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Adamantyl (Tricyclo-[3.3.1.1^{3,7}]-decanyl) und (1,4)-Benzodioxanyl, wobei der (hetero)cycloaliphatische Rest jeweils mit 1 oder 2 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend Methyl, Ethyl, iso-Propyl und n-Propyl substituiert sein kann,

oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, (1,4)-Benzodioxanyl, Thiophenyl, Furanyl, Pyridinyl, Imidazolyl, Indolyl und Isoindolyl, wobei der Rest jeweils mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus F, Cl, Br, I, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, iso-Butyl, tert-Butyl, $-CF_3$, $-O-CH_3$, $-O-C_2H_5$, $-O-CF_3$, $-O-Phenyl$, $-O-Benzyl$, $-NH_2$, $-N(CH_3)_2$, $-N(C_2H_5)_2$, $-N(H)(CH_3)$ und $-N(H)(C_2H_5)$ substituiert sein kann, steht;

R²⁰ für einen Methyl- oder Ethyl-Rest,

für einen (hetero)cycloaliphatischen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyclopentyl, Cyclohexyl, Piperidinyl und Cycloheptyl,

oder für einen Phenyl- oder Pyridinyl-Rest, der mit der mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, F, Cl, Br, $-CF_3$, $-OH$, $-O-CH_3$ und $-O-C_2H_5$ substituiert sein kann, steht;

R²¹ für einen Wasserstoff-Rest

oder für einen Phenyl-Rest, der mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, F, Cl und Br substituiert sein kann, steht;

R²² für einen Pyrrolidinyl- oder Morpholinyl-Rest

oder für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, (1,3)-Benzodioxolyl, Thiophenyl, Benzo[b]furanyl, Benzo[b]thiophenyl und Chinolinyl, wobei der Rest jeweils mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, F, Cl, Br, $-OH$, $-O-CH_3$ und $-O-C_2H_5$ substituiert sein kann, steht;

R²³ für einen Phenyl-Rest steht;

R²⁴ für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl und tert-Butyl steht;

R²⁵ für einen Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Phenyl, Naphthyl, Furanyl, Pyrazinyl und Pyrimidinyl steht, der über eine $-(CH_2)$ -Gruppe gebunden und/oder mit 1, 2 oder 3 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl und iso-Propyl substituiert sein kann;

R²⁶ für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, n-Propyl und iso-Propyl steht;

R²⁷ für einen Alkyl-Rest ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Ethyl, iso-Propyl und n-Propyl steht und

R²⁸ für einen Phenyl-Rest steht;

jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

16. Verbindungen gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 15 ausgewählt aus der Gruppe be-

stehend aus

- [1] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-thiophen-2-yl-ethyl)-amid,
- [2] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(2,5-dimethoxy-phenyl)-ethyl]-amid,
- [3] N-{3-[4-(2-Ethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,
- [4] 2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [3-(2-methyl-piperidin-1-yl)-propyl]-amid,
- [5] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-phenyl-propyl)-amid,
- [6] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-pyrrolidin-1-yl-ethyl)-amid,
- [7] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure ethyl-pyridin-4-ylmethyl-amid,
- [8] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-thiophen-2-yl-ethyl)-amid,
- [9] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3-imidazol-1-yl-propyl)-amid,
- [10] 3-Chlor-N-{3-[4-(3-chlor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,
- [11] 3-Chlor-N-methyl-N-[3-(4-phenyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,
- [12] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure indan-1-ylamid,
- [13] N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(2-morpholin-4-yl-ethyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,
- [14] 3-Chlor-N-methyl-N-{3-[4-(3-trifluormethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,
- [15] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3,5-bis-trifluormethyl-benzylamid,
- [16] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-methyl-cyclohexyl)-amid,
- [17] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-methoxy-benzylamid,
- [18] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-p-tolyl-ethyl)-amid,
- [19] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1,2-dimethyl-propyl)-amid,
- [20] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-methyl-cyclohexyl)-amid,
- [21] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-phenyl-propyl)-amid,
- [22] 4-[2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl]-piperazin-1-carbonsäure ethyl ester,
- [23] 3-Chlor-N-methyl-N-(3-[4-[(methyl-phenyl-carbamoyl)-methyl]-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-benzamid,
- [24] 3-Chlor-N-{3-[4-(furan-2-carbonyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,
- [25] N-Methyl-N-[3-(4-p-tolyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,
- [26] N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(3-phenyl-propyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,
- [27] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,6,6-trimethyl-bicyclo[3.1.1]hept-3-yl)-amid,
- [28] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3-phenyl-propyl)-amid,
- [29] Naphthalen-1-carbonsäure {3-[4-(4-methoxy-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-methyl-amid,

- [30] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(4-trifluormethyl-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid,
- [31] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-ethyl-phenyl)-amid,
- [32] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3-methoxy-benzyl)-(tetrahydro-furan-2-ylmethyl)-amid,
- [33] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,3-dichlor-benzylamid,
- [34] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-benzofuran-2-ylmethyl-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid,
- [35] 3-Chlor-N-{3-(4-(4-chlor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,
- [36] 2-({2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-3-(1H-indol-3-yl)-propionsäure methyl ester,
- [37] N-Butyl-3-chlor-N-[3-(4-phenylacetyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,
- [38] 2-({2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-3-methyl-pentansäure-tert-butyl ester,
- [39] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-naphthalen-1-yl-ethyl)-amid,
- [40] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure allyl-methyl-amid,
- [41] N-Butyl-N-[3-(3,6-dihydro-2H-pyridin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-3,4-difluor-benzamid,
- [42] 2-({2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-4-methyl-pentansäure-benzyl ester,
- [43] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-ethoxy-benzylamid,
- [44] N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(5-methyl-pyrazin-2-carbonyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,
- [45] N-[3-(4-Benzo[1,3]dioxol-5-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-3-chlor-N-methyl-benzamid,
- [46] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,2-diphenyl-ethyl)-amid,
- [47] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-difluor-benzylamid,
- [48] N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(2-fluor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,
- [49] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-p-tolyl-ethyl)-amid,
- [50] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (pyridin-2-ylmethyl)-amid,
- [51] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-trifluormethyl-benzylamid,
- [52] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure indan-1-ylamid,
- [53] 3-Chlor-N-methyl-N-[3-(4-chinolin-2-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,
- [54] N-Butyl-3,4-difluor-N-[3-(4-methyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,
- [55] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-difluor-benzylamid,
- [56] N-[3-(4-Benzhydryl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-butyl-3,4-difluor-benzamid,
- [57] 4-Methyl-2-({2-[methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-pentansäure-benzyl ester,
- [58] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-pyrroli-

din-1-yl-ethyl)-amid,

[59] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2-benzyloxy-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid,

[60] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (pyridin-3-yl-methyl)-amid,

[61]

3-Chlor-N-{3-[4-(4-fluor-phenyl)-3,6-dihydro-2H-pyridin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,

[62] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure cyclohexylamid,

[63] N-[3-(4-Cycloheptyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-methyl-benzamid,

[64] Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(4-thiophen-3-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid,

[65] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-dimethoxy-benzylamid,

[66] 1-[2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl]-piperidin-4-carbonsäure ethyl ester,

[67] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-benzyloxy-cyclohexyl)-amid,

[68] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(4-phenoxy-phenyl)-ethyl]-amid,

[69] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(7-methyl-1H-indol-3-yl)-ethyl]-amid,

[70] Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(4-phenyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid,

[71] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(3-trifluormethyl-phenyl)-ethyl]-amid,

[72] N-Butyl-3-chlor-N-[3-(4-pyridin-2-yl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,

[73] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-methoxy-benzylamid,

[74] 2-[Butyl-(3,4-difluor-Benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-difluor-benzylamid,

[75] 3-Chlor-N-methyl-N-[3-(4-pyridin-2-yl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,

[76] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-bi-phenyl-4-ylmethyl-pyrrolidin-3-yl)-methylamid,

[77] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,3-dihydro-benzo[1,4]dioxin-2-ylmethyl)-amid,

[78] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(1 H-indol-3-yl)-ethyl]-methylamid,

[79]

N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(3-trifluormethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,

[80] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(1 N-indol-3-yl)-ethyl]-methylamid,

[81]

3-Chlor-N-{3-[4-(4-hydroxy-4-(3-trifluormethyl-phenyl)-piperidin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-methyl-benzamid,

[82] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-methoxymethyl-2-phenyl-ethyl)-amid,

[83] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2,6-dichlor-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid,

[84] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2-brom-4,5-dimethoxy-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid,

[85] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure benzo[1,3]dioxol-5-ylamid,

[86] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-methoxymethyl-2-phenyl-ethyl)-amid,

- [87] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2,6-dichlor-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-amid,
- [88] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-trifluormethoxy-benzylamid,
- [89] N-Butyl-3,4-difluor-N-{3-[4-(isopropylcarbamoyl-methyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,
- [90] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-methyl-3-phenyl-propyl)-amid,
- [91] 2-((2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl)-amino)-3-methyl-buttersäurebenzylester,
- [92] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (thiophen-2-ylmethyl)-amid,
- [93] 2-[Butyl-(3,4-difluor-Benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-methyl-cyclohexyl)-amid,
- [94] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure benzyl-methyl-amid,
- [95] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(2,6-dichlor-benzylsulfanyl)-ethyl]-amid,
- [96] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,3-dihydro-benzo[1,4]dioxin-2-ylmethyl)-amid,
- [97] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 4-trifluormethyl-benzylamid,
- [98] N-[3-(4-Benzyl-piperidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-methyl-benzamid,
- [99] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-trifluormethoxy-benzylamid,
- [100] 3-Chlor-N-{3-[4-(2,5-dimethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,
- [101] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2,6-dichlor-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid,
- [102] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-chlor-6-methyl-benzylamid,
- [103] N-Butyl-3-chlor-N-[3-(3,5-dimethyl-piperidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,
- [104] 2-((2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl)-amino)-3,3-dimethyl-buttersäure tert-butylester,
- [105] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-cyclohexyl-ethyl)-amid,
- [106] 3-Chlor-N-methyl-N-[3-(4-phenethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,
- [107] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-phenoxy-ethyl)-amid,
- [108] Naphthalen-1-carbonsäure [3-(4-benzofuran-2-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-methyl-amid,
- [109] N-[3-([1,4']Bipiperidiny-1'-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-butyl-3-chlor-benzamid,
- [110] N-Butyl-3-chlor-N-[3-(8-fluor-1,3,4,5-tetrahydro-pyrido[4,3-b]indol-2-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,
- [111] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 4-dimethylamino-benzylamid,
- [112] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo(1,2-a)pyridin-3-carbonsäure (1-methyl-3-phenyl-propyl)-amid,
- [113] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-methyl-benzylamid,
- [114] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,3-dihydro-benzo[1,4]dioxin-6-yl)-amid,
- [115] Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(4-chinolin-2-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid,
- [116] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-cya-

no-ethyl)-methyl-amid,

[117] 2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-p-tolyl-ethyl)-amid,

[118] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(4-fluor-phenyl)-ethyl]-amid,

[119]

N-Butyl-N-{3-[4-(5-chlor-2-methyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-3,4-difluor-benzamid,

[120] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure cyclohexylamid,

[121] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (benzo[1,3]dioxol-5-ylmethyl)-amid,

[122] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-methoxy-benzylamid,

[123] 3-tert-Butoxy-2-({2-[(3-chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-buttersäure methyl ester,

[124] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-benzyloxy-cyclohexyl)-amid,

[125] N-{3-[4-(4-Fluor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-benzamid,

[126] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (naphthalen-2-ylcarbamoylmethyl)-amid,

[127] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 4-trifluormethoxy-benzylamid,

[128] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3,3-diphenyl-propyl)-amid,

[129] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-benzyloxy-phenyl)-amid,

[130]

N-{3-[4-(5-Brom-2-ethoxy-benzyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-2-phenyl-acetamid,

[131] N-[3-(3,4-Dihydro-1 H-isochinolin-2-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-methyl-benzamid,

[132] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-phenyl-propyl)-amid,

[133] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,3-dimethyl-benzylamid,

[134] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(4-phenoxy-phenyl)-ethyl]-amid,

[135] N-{3-[4-(4-Ethoxy-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-N-methyl-2-phenyl-acetamid,

[136] Naphthalen-1-carbonsäure {3-[4-(2-ethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-methyl-amid,

[137]

N-[3-(4-Benzo[1,3]dioxol-5-ylmethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-butyl-3,4-difluor-benzamid,

[138]

N-Butyl-N-{3-[4-(2,5-dimethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-3,4-difluor-benzamid,

[139] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [(4-chlor-phenyl)-phenyl-methyl]-amid,

[140] N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-(4-chlor-benzyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,

[141] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-naphthalen-2-yl-ethyl)-amid,

[142] 2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2-fluor-benzylamid,

[143] N-[3-(1,4-Dioxa-8-aza-spiro[4.5]decane-8-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-N-methyl-2-phenyl-acetamid,

[144] Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(1,3,4,9-tetrahydro-b-carbolin-2-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imi-

dazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid,

[145] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-methyl-3-phenyl-propyl)-amid,

[146]

3-Chlor-N-methyl-N-{3-[4-(2,4,6-trimethoxy-benzyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,

[147] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure benzhydryl-amid,

[148] Naphthalen-1-carbonsäure {3-[4-(2-chlor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-methyl-amid,

[149] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (thiophen-2-yl-methyl)-amid,

[150] N-Butyl-N-{3-[4-(4-chlor-benzyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-3,4-difluor-benzamid,

[151] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3-phenyl-propyl)-amid,

[152] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-tert-butyl-phenyl)-amid,

[153] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-ethyl-phenyl)-amid,

[154] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure cyclohexylamid,

[155] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [3-(methyl-phenyl-amino)-propyl]-amid,

[156] 2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(3-trifluormethyl-phenyl)-ethyl]-amid,

[157] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 4-chlor-benzylamid,

[158] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-fluor-benzylamid,

[159] 2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure p-tolylamid,

[160] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-phenoxy-ethyl)-amid,

[161] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2-benzyloxy-cyclohexyl)-amid,

[162] Naphthalen-1-carbonsäure {3-[4-(4-fluor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-methyl-amid,

[163] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(4-chlor-phenyl)-propyl]-amid,

[164] N-Butyl-3,4-difluor-N-[3-(thiomorpholin-4-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-benzamid,

[165] 2-[(3-Chlor-benzoyl)-methyl-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carboxylsäure (1-adamantan-1-yl-ethyl)-amid,

[166] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [(4-chlor-phenyl)-phenyl-methyl]-amid,

[167] N-Methyl-N-{3-[4-(4-trifluormethyl-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,

[168] 2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (1-biphenyl-4-yl-methyl-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid,

[169] N-[3-(4-Benzoyl-piperidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-3-chlor-N-methyl-benzamid,

[170] 2-(Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (4-tert-butyl-phenyl)-amid,

[171] 2-[Butyl-(3,4-difluor-Benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3,3-dimethyl-butyl)-amid,

[172] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [1-(2-brom-4,5-dimethoxy-benzyl)-pyrrolidin-3-yl]-amid,

[173] Naphthalen-1-carbonsäure methyl-{3-[4-(3-phenyl-allyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-amid,

[174] Naphthalen-1-carbonsäure methyl-[3-(4-phenethyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-amid,

[175]

N-Butyl-3-chlor-N-{3-[4-hydroxy-4-(3-trifluormethyl-phenyl)-piperidin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,

[176] N-Methyl-2-phenyl-N-{3-[4-(3-phenyl-propyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-acetamid,

[177] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 3-fluor-benzylamid,

[178] N-Butyl-N-{3-[4-(2-chlor-phenyl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-3,4-difluor-benzamid,

[179] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure benzo[1,3]dioxol-5-ylamid,

[180] 2-[Butyl-(3,4-difluor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (3,3-diphenyl-propyl)-amid,

[181] 2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure (2,3-dihydro-benzo[1,4]dioxin-6-yl)-amid,

[182] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure [2-(3,4-dimethoxy-phenyl)-ethyl]-amid,

[183] Naphthalen-1-carbonsäure [3-(4-benzoyl-piperidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-methyl-amid,

[184] 4-Methyl-2-({2-[methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo(1,2-a)pyridin-3-carbonyl}-amino)-valeriansäure tert-butylester,

[185] 2-[Methyl-(naphthalen-1-carbonyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo(1,2-a)pyridin-3-carbonsäure (4-phenoxy-phenyl)-amid,

[186] N-Methyl-2-phenyl-N-[3-(4-phenyl-piperazin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo(1,2-a)pyridin-2-yl]-acetamid,

[187]

N-Butyl-3,4-difluor-N-{3-[4-(5-trifluormethyl-pyridin-2-yl)-piperazin-1-carbonyl]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-benzamid,

[188] 2-(Benzoyl-methyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonsäure 2,4-dichlor-6-methyl-benzylamid,

[189] [4-({2-[Butyl-(3-chlor-benzoyl)-amino]-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl}-amino)-phenyl]-carbaminsäure tert-butyl ester,

[190] N-Methyl-2-phenyl-N-[3-(2-pyrrolidin-1-ylmethyl-pyrrolidin-1-carbonyl)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-acetamid

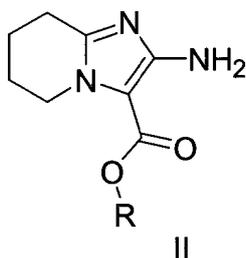
und

[191] 4-[2-(Methyl-phenylacetyl-amino)-5,6,7,8-tetrahydro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-carbonyl]-piperazin-1-carbonsäure tert-butyl ester,

jeweils ggf. in Form eines ihrer reinen Stereoisomeren, insbesondere Enantiomeren oder Diastereomeren, ihrer Racemate oder in Form einer Mischung von Stereoisomeren, insbesondere der Enantiomeren und/oder Diastereomeren, in einem beliebigen Mischungsverhältnis, oder jeweils in Form entsprechender Salze, oder jeweils in Form entsprechender Solvate.

17. Verbindungen gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 16, dadurch gekennzeichnet, dass die Verbindungen im FLIPR-Assay in einer Konzentration von 10 μM eine Hemmung des Ca^{2+} -Ionen-Einstroms in Dorsalwurzelganglien von Ratten von wenigstens 30 %, bevorzugt von wenigstens 50 %, besonders bevorzugt von wenigstens 70 %, ganz besonders bevorzugt von wenigstens 80 %, noch weiter bevorzugt von wenigstens 90 %, im Vergleich zur maximal erreichbaren Hemmung des Ca^{2+} -Ionen-Einstroms mit Capsaicin in einer Konzentration von 10 μM aufweisen.

18. Verfahren zur Herstellung substituierter 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazol[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der allgemeinen Formel I gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 17, dadurch gekennzeichnet, dass wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel II,



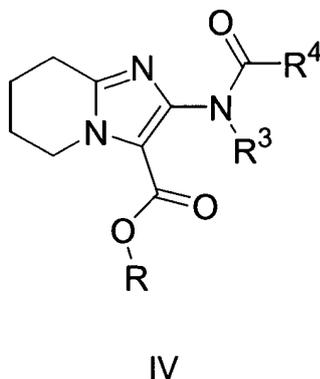
worin R für einen linearen oder verzweigten C_{1-6} -Alkyl-Rest steht, in einem Reaktionsmedium in Gegenwart we-

nigstens eines Reduktionsmittels, ggf. in Gegenwart einer organischen Säure, vorzugsweise in Gegenwart von Essigsäure, mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel $R^3-C(=O)-H$, worin R^3 die Bedeutung gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 16 hat, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel III,



worin R und R^3 die vorstehend genannte Bedeutung haben, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird

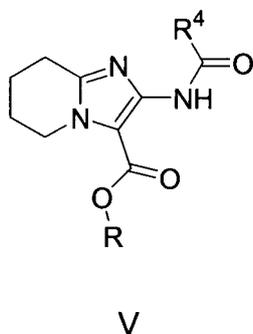
und wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel III in einem Reaktionsmedium ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel $R^4-C(=O)-X$, worin R^4 die Bedeutung gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 16 hat und X für eine Abgangsgruppe, vorzugsweise für einen Halogen-Rest steht, oder in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens eines Kupplungsreagenzes ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit einer Verbindung der allgemeinen Formel $R^4-C(=O)-OH$, worin R^4 die Bedeutung gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 16 hat, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel IV,



worin R, R^3 und R^4 die vorstehend genannte Bedeutung haben und R^3 nicht gleich Wasserstoff ist, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird

oder

wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel II, worin R die vorstehend genannte Bedeutung hat, in einem Reaktionsmedium ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel $R^4-C(=O)-X$, worin R^4 die vorstehend genannte Bedeutung hat und X für eine Abgangsgruppe, vorzugsweise für einen Halogen-Rest steht, oder in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens eines Kupplungsreagenzes ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit einer Verbindung der allgemeinen Formel $R^4-C(=O)-OH$, worin R^4 vorstehend genannte Bedeutung hat, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel V,



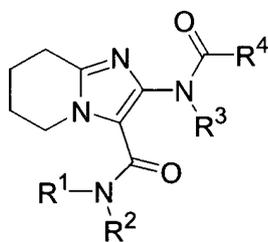
worin R und R^4 die vorstehend genannte Bedeutung haben, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird und wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel V in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens einer Base, vorzugsweise eines Metallhydridsalzes, mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel R^3-X , worin R^3 die vorstehend genannte Bedeutung hat und nicht gleich Wasserstoff ist und X für eine Abgangsgruppe, vorzugsweise für einen Halogen-Rest steht, zu einer Verbindung der allgemeinen

Formel IV, worin R, R³ und R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung haben und R³ nicht gleich Wasserstoff ist, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird und wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel IV in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens einer Base, vorzugsweise in Gegenwart wenigstens eines Metallhydroxidsalzes, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel VI,



VI

worin R³ und R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung haben und R³ nicht gleich Wasserstoff ist, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird und wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel VI in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens eines Kupplungsreagenzes ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel HNR¹R², worin R¹ die vorstehend genannte Bedeutung hat und R² für Wasserstoff steht, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel I,



I

worin R¹, R³ und R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung haben, R³ nicht gleich Wasserstoff ist und R² für Wasserstoff steht, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird und ggf. wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel I, worin R¹, R³ und R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung haben, R³ nicht gleich Wasserstoff ist und R² für Wasserstoff steht, in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens einer Base, vorzugsweise eines Metallhydridsalzes, mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel R²-X, worin R² die vorstehend genannte Bedeutung hat und nicht gleich Wasserstoff ist und X für eine Abgangsgruppe, vorzugsweise einen Halogen-Rest steht, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel I,

worin R¹, R², R³ und R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung haben und R² und R³ nicht gleich Wasserstoff sind, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird

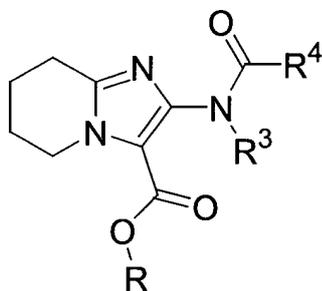
oder wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel VI in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens eines Kupplungsreagenzes ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel HNR¹R², worin R¹ und R² die vorstehend genannte Bedeutung haben und nicht gleich Wasserstoff sind, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel I, worin R¹, R², R³ und R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung haben und R¹, R² und R³ nicht gleich Wasserstoff sind, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird.

19. Verfahren zur Herstellung substituierter 5,6,7,8-Tetrahydro-imidazol[1,2-a]pyridin-2-ylamin-Verbindungen der allgemeinen Formel I gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 17, dadurch gekennzeichnet, dass wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel II,



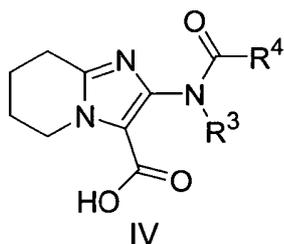
II

worin R für einen linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl-Rest steht, in einem Reaktionsmedium ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel R⁴-C(=O)-X, worin R⁴ die Bedeutung gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 16 hat und X für eine Abgangsgruppe, vorzugsweise für einen Halogen-Rest steht, oder in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens eines Kupplungsreagenzes ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit einer Verbindung der allgemeinen Formel R⁴-C(=O)-OH, worin R⁴ die Bedeutung gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 16 hat, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel IV,



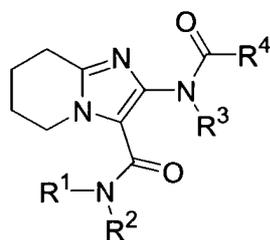
IV

worin R und R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung haben und R³ gleich Wasserstoff ist, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird, und wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel IV in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens einer Base, vorzugsweise in Gegenwart wenigstens eines Metallhydroxidsalzes, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel VI,



IV

worin R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung hat und R³ gleich Wasserstoff ist, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/isoliert wird wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel VI in einem Reaktionsmedium in Gegenwart wenigstens eines Kupplungsreagenzes ggf. in Gegenwart wenigstens einer Base mit wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel HNR¹R², worin R¹ und R² die Bedeutung gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 16 haben, zu einer Verbindung der allgemeinen Formel I,



I

worin R¹, R² und R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung haben und R³ gleich Wasserstoff ist, umgesetzt wird und diese ggf. gereinigt und/oder isoliert wird.

20. Arzneimittel enthaltend wenigstens eine Verbindung gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 17 und ggf. einen oder mehrere physiologisch verträgliche Hilfsstoffe.

21. Arzneimittel gemäß Anspruch 20 zur Prophylaxe und/oder Behandlung von Schmerz, vorzugsweise

von Schmerz ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus akutem Schmerz, chronischem Schmerz und neuropathischem Schmerz.

22. Arzneimittel gemäß Anspruch 20 zur Prophylaxe und/oder Behandlung von einer oder mehreren Erkrankungen ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Migräne; Depressionen; Harninkontinenz; Husten; neurodegenerativen Erkrankungen, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Morbus Parkinson, Morbus Huntington, Morbus Alzheimer und multipler Sklerose; Störungen der Nahrungsmittelaufnahme, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Bulimie, Anorexie, Fettsucht und Kachexie; Angstzuständen; kognitiven Dysfunktionen, vorzugsweise Gedächtnisstörungen; kognitive Mangelzustände (attention deficit syndrom, ADS); Epilepsie; Diarrhoe und Pruritus; oder zur Prophylaxe und/oder Behandlung von Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenmißbrauch und Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenabhängigkeit, vorzugsweise zur Prophylaxe und/oder Verminderung von Entzugserscheinungen bei Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenabhängigkeit; zur Prophylaxe und/oder Verminderung einer Toleranzentwicklung gegenüber Medikamenten, insbesondere Medikamenten auf Basis von Opioiden; zur Regulation der Nahrungsaufnahme; zur Modulation der Bewegungsaktivität; zur Regulation des kardiovaskulären Systems; zur Lokalanästhesie; zur Vigilanzsteigerung; zur Libidosteigerung; zur Diurese und/oder zur Antinatriurese.

23. Verwendung wenigstens einer Verbindung gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 17 zur Herstellung eines Arzneimittels zur Prophylaxe und/oder Behandlung von Schmerz, vorzugsweise von Schmerz ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus akutem Schmerz, chronischem Schmerz und neuropathischem Schmerz.

24. Verwendung wenigstens einer Verbindung gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 17 zur Herstellung eines Arzneimittels zur Prophylaxe und/oder Behandlung von einer oder mehreren Erkrankungen ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Migräne; Depressionen; Harninkontinenz; Husten; neurodegenerativen Erkrankungen, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Morbus Parkinson, Morbus Huntington, Morbus Alzheimer und multipler Sklerose; Störungen der Nahrungsmittelaufnahme, vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Bulimie, Anorexie, Fettsucht und Kachexie; Angstzuständen; kognitiven Dysfunktionen, vorzugsweise Gedächtnisstörungen; kognitive Mangelzustände (attention deficit syndrom, ADS); Epilepsie; Diarrhoe und Pruritus; zur Prophylaxe und/oder Behandlung von Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenmißbrauch und Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenabhängigkeit, vorzugsweise zur Prophylaxe und/oder Verminderung von Entzugserscheinungen bei Alkohol- und/oder Drogen- und/oder Medikamentenabhängigkeit; zur Prophylaxe und/oder Verminderung einer Toleranzentwicklung gegenüber Medikamenten, insbesondere Medikamenten auf Basis von Opioiden; zur Regulation der Nahrungsaufnahme; zur Modulation der Bewegungsaktivität; zur Regulation des kardiovaskulären Systems; zur Lokalanästhesie; zur Vigilanzsteigerung; zur Libidosteigerung; zur Diurese und/oder zur Antinatriurese.

Es folgt kein Blatt Zeichnungen