



(19)



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) Número de publicación: **2 362 961**

(51) Int. Cl.:

C07D 409/12 (2006.01)

C07D 333/54 (2006.01)

C07D 407/12 (2006.01)

C07D 413/12 (2006.01)

C07D 417/12 (2006.01)

A61K 31/559 (2006.01)

A61P 25/00 (2006.01)

(12)

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

(96) Número de solicitud europea: **06797580 .5**

(96) Fecha de presentación : **31.08.2006**

(97) Número de publicación de la solicitud: **1919907**

(97) Fecha de publicación de la solicitud: **14.05.2008**

(54) Título: **Compuesto heterocíclico.**

(30) Prioridad: **31.08.2005 JP 2005-251055**

(45) Fecha de publicación de la mención BOPI:
15.07.2011

(45) Fecha de la publicación del folleto de la patente:
15.07.2011

(73) Titular/es: **OTSUKA PHARMACEUTICAL Co., Ltd.**
9, Kanda-Tsukasacho 2-chome
Chiyoda-ku, Tokyo 101-8535, JP

(72) Inventor/es: **Yamashita, Hiroshi;**
Matsubara, Jun;
Kuroda, Hideaki;
Ito, Nobuaki;
Miyamura, Shin;
Tanaka, Tatsuyoshi;
Taira, Shinichi;
Fukushima, Tae;
Takahashi, Haruka y
Kuroda, Takeshi

(74) Agente: **Ungría López, Javier**

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Compuesto Heterocíclico

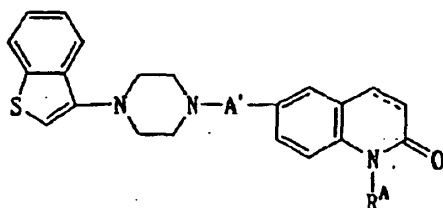
5 CAMPO TÉCNICO

La presente invención se refiere a un compuesto heterocíclico novedoso.

10 TÉCNICA ANTERIOR

Puesto que el factor causal de la esquizofrenia así como del trastorno bipolar, los trastornos del estado de ánimo y los trastornos emocionales es heterogéneo, es deseable que un fármaco tenga efectos farmacológicos múltiples de manera que desarrolle un amplio espectro de tratamiento.

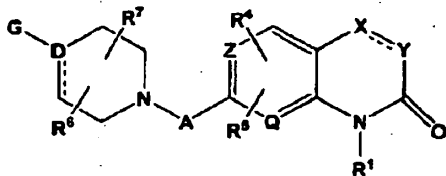
15 El documento WO2004/026B69A1 describe que un derivado de carboestirilo representado por la fórmula general:



(donde A' representa $-(CH_2)_mCH_2-$, $-(CH_2)_mO-$, etc.; m representa un número entero de de 1 a 4; y R^A representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_1-C_4 que puede estar sustituido con 1 a 3 átomos de flúor, etc.) tiene actividad antagonista del receptor D_2 y actividad antagonista del receptor 2A (5-HT_{2A}) de serotonina y es eficaz para el tratamiento de la esquizofrenia y otros trastornos del sistema nervioso central).

Sin embargo, no existe descripción en el documento WO2004/026864A1 de que los derivados de carboestirilo descritos en el documento tengan juntas actividad agonista parcial del receptor D_2 , actividad antagonista del receptor 5'-HT_{2A}, actividad antagonista del receptor α_1 y actividad inhibidora de la absorción de serotonina y tengan un amplio espectro de tratamiento.

El documento WO 2005/019215 A1 describe los compuestos representados mediante la siguiente fórmula:



(donde A es $-(CH_2)_mCH_2-$, $-(CH_2)_mO-$ o similares; m es un número entero de 2 a 5; D es N, C o similares; Z y Q son independientemente N, C o CH, siempre que al menos uno de Z y Q sea N; X e Y son independientemente C, N o similares; y el enlace entre X e Y es un enlace sencillo o doble; R^1 es hidrógeno, un grupo alquilo C_1-C_3 o similares; R^4 , R^5 , R^6 y R^7 representan cada uno hidrógeno, un grupo alquilo o similares; y G representa un grupo de un compuesto monocíclico o bicíclico), que se unen a los receptores D_2 de dopamina. El documento WO 2005/019215 A1 ilustra que algunos compuestos descritos allí tienen una actividad como agonistas parciales de los receptores D_2 o una actividad como antagonistas de los receptores D_2 , y pueden ser eficaces para el tratamiento de la esquizofrenia y otras enfermedades del sistema nervioso central.

Sin embargo, el documento WO 2005/019215 A1 no describe específicamente los compuestos de la presente invención.

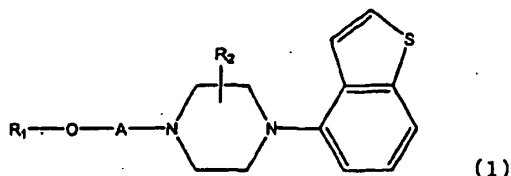
DESCRIPCIÓN DE LA INVENCION

Un objeto de la presente invención es proporcionar un fármaco antipsicótico que tenga un espectro de tratamiento más amplio, menos efectos secundarios y tolerabilidad y seguridad excelentes en comparación con los fármacos antipsicóticos típicos y atípicos bien conocidos.

Los autores de la presente invención han llevado a cabo estudios exhaustivos sobre el problema anteriormente descrito y consiguientemente han tenido éxito al sintetizar un compuesto novedoso que tiene actividad agonista parcial del receptor D_2 de dopamina (actividad agonista parcial del receptor D_2 de dopamina), actividad antagonista

del receptor 5-HT_{2A} de serotonina (actividad antagónica del receptor 5-HT_{2A}) y actividad antagónica del receptor α_1 de adrenalina (actividad antagónica del receptor α_1) y adicionalmente tiene un efecto inhibidor de la absorción de serotonina (o efecto inhibidor de la reabsorción de serotonina) juntos además de estos efectos. La presente invención se ha completado basándose en este descubrimiento.

Se proporciona un compuesto heterocíclico o una de sus sales representado por la fórmula (1):



donde R² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior;
A representa un grupo alquileo inferior o un grupo alquenileo inferior; y
R¹ representa

un grupo aromático seleccionado entre un grupo fenilo, un grupo naftilo, un grupo dihidroindenilo y un grupo tetrahidronaftilo;

donde al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en los grupos (1) a (66) de más abajo puede estar presente como sustituyente en el grupo aromático representado por R¹:

- (1) un grupo alquilo inferior,
- (2) un grupo alquenilo inferior,
- (3) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- (4) un grupo alcoxi inferior,
- (5) un grupo ariloxi,
- (6) un grupo alquil(inferior)tio,
- (7) un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno,
- (8) un grupo hidroxilo,
- (9) un grupo hidroxilo protegido,
- (10) un grupo hidroxialquilo inferior,
- (11) un grupo hidroxialquilo inferior protegido,
- (12) un átomo de halógeno,
- (13) un grupo ciano,
- (14) un grupo arilo,
- (15) un grupo nitro,
- (16) un grupo amino,
- (17) un grupo amino que tiene uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alquil(inferior)sulfonilo, un grupo carbamoilo, un grupo alquil(inferior)carbamoilo, un grupo aminoalcanilo inferior, un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior y un grupo alcoxi(inferior)carbonilaminoalcanilo inferior como sustituyente,
- (18) un grupo alcanilo inferior,
- (19) un grupo arilsulfonilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior en el grupo arilo,
- (20) un grupo carboxi,
- (21) un grupo alcoxi(inferior)carbonilo,
- (22) un grupo carboxialquilo inferior,
- (23) un grupo alcoxi(inferior)carbonilalquilo inferior,
- (24) un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior,
- (25) un grupo carboxialquenilo inferior,
- (26) un grupo alcovicarbonilalquenilo inferior,
- (27) un grupo carbamoilalquenilo inferior que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como sustituyente,
- (28) un grupo carbamoilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en los grupos (i) a (lxxviii) de más abajo como sustituyente:
 - (i) un grupo alquilo inferior,
 - (ii) un grupo alcoxi inferior,
 - (iii) un grupo hidroxialquilo inferior,
 - (iv) un grupo alcoxi(inferior)alquilo inferior,
 - (v) un grupo ariloxialquilo inferior,
 - (vi) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
 - (vii) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo

	que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo aroilo y un grupo carbamoilo,
5	(viii) un grupo cicloalquilo C ₃ -C ₈ que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo fenilalcoxi inferior como sustituyente,
	(ix) un grupo alquilo inferior sustituido con cicloalquilo C ₃ -C ₈ ,
	(x) un grupo alqueno inferior,
10	(xi) un grupo carbamoilalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo que puede tener uno o varios grupos alcoxi inferior como sustituyente,
	(xii) un grupo alcoxi(inferior)carbonilalquilo inferior,
	(xiii) un grupo furilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyente) en el grupo furilo,
15	(xiv) un grupo tetrahidrofurilalquilo inferior,
	(xv) un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior,
	(xvi) un grupo tetrahidropiranilalquilo inferior,
	(xvii) un grupo pirrolilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo pirrolilo),
20	(xviii) un grupo alquilo inferior sustituido con un grupo dihidropirazolilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
	(xix) un grupo pirazolilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo pirazolilo),
	(xx) un grupo imidazolilalquilo inferior,
25	(xxi) un grupo piridilalquilo inferior,
	(xxii) un grupo pirazinilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo pirazino),
	(xxiii) un grupo pirrolidinilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en uno o varios grupos oxo y un grupo alquilo inferior como sustituyente en el grupo pirrolidino),
30	(xxiv) un grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanilo inferior como sustituyente en el grupo piperidilo),
	(xxv) un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo piperazino),
35	(xxvi) un grupo morfolinilalquilo inferior,
	(xxvii) un grupo tienilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo tienilo),
	(xxviii) un grupo tiazolilalquilo inferior,
40	(xxix) un grupo dihidrobenzofurilalquilo inferior,
	(xxx) un grupo benzopiranilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos oxo como sustituyentes en el grupo benzopirano),
	(xxxi) un grupo benzimidazolilalquilo inferior,
45	(xxxii) un grupo indolilalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos alcoxi(inferior)carbonilo en el grupo alquilo inferior,
	(xxxiii) un grupo imidazolilalquilo inferior que tiene uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo en el grupo alquilo inferior,
50	(xxxiv) un grupo piridilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquil(inferior)tioalquilo inferior como sustituyente,
	(xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior y un grupo aroilo como sustituyente,
55	(xxxvi) un grupo piperidilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior y un grupo aroilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un átomo de halógeno como sustituyente,
	(xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
60	(xxxviii) un grupo hexahidrazepinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
	(xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo aroilo y un grupo furilo como sustituyente,
	(xl) un grupo tiazolilo,
	(xli) un grupo tiadiazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,

5	(xlii)	un grupo isoxazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
	(xliii)	un grupo indazolilo,
	(xliv)	un grupo indolilo,
	(xlv)	un grupo tetrahydrobenzotiazolilo,
	(xlvi)	un grupo tetrahydroquinolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno y un grupo oxo como sustituyente,
10	(xlvi)	un grupo quinolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
	(xlviii)	un grupo benzodioxolilalquilo inferior,
	(xlix)	un grupo arilo que puede tener uno o varios grupos como sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo inferior; un grupo alcoxi inferior; un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno; un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno; un grupo alqueno inferior; un grupo amino que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoilo inferior, un grupo alquil(inferior)sulfonilo, un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo sulfamoilo; un grupo alquil(inferior)tio; un grupo alcanoilo inferior; un grupo alcoxi(inferior)carbonilo; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo inferior; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo ariloxi; un grupo arilalcoxi inferior; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxialquilo inferior; un grupo carbamoilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior; un grupo dihidrofurilo que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo tiazolidinilalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo imidazolilalcanoilo inferior y un grupo piperidinilcarbonilo,
25	(l)	un grupo cianoalquilo inferior,
	(li)	un grupo dihydroquinolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo oxo,
30	(lii)	un grupo alquil(inferior)amino sustituido con halógeno,
	(liii)	un grupo alquil(inferior)tioalquilo inferior,
	(liv)	un grupo amidino que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
	(lv)	un grupo amidinoalquilo inferior,
	(lvi)	un grupo alquilen(inferior)oxialquilo inferior,
35	(lvii)	un grupo arilamino que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno y un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno, en el grupo arilo,
	(lviii)	un grupo arilalqueno inferior,
	(lix)	un grupo piridilamino que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
	(lx)	un grupo arilalquilo inferior (que puede tener en el grupo arilo y/o el grupo alquilo inferior uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi inferior, un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como sustituyentes),
40	(lxi)	un grupo alquinilo inferior,
	(lxii)	un grupo ariloxialquilo inferior (que puede tener como sustituyente en el grupo arilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior; un grupo carbamoilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior; y un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo),
50	(lxiii)	un grupo isoxazolilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
	(lxiv)	un grupo dihydroindenilo,
	(lxv)	un grupo arilalcoxi(inferior)alquilo inferior,
	(lxvi)	un grupo tetrahidropiranilo,
	(lxvii)	un grupo azetidino que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoilo inferior y un grupo aroilo,
55	(lxviii)	un grupo azetidinalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoilo inferior y un grupo aroilo,
	(lxix)	y un grupo tetrazolilo,
	(lxx)	y un grupo indolinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
	(lxxi)	un grupo triazolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquil(inferior)tio,
	(lxxii)	un grupo imidazolilo que puede tener uno o varios grupos carbamoilo,
60	(lxxiii)	un grupo oxazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
	(lxxiv)	un grupo isotiazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
	(lxxv)	un grupo benzimidazolilo,

- (lxxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
- (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener un grupo alcoxi(inferior)carbonilo(s), y
- (lxxviii) un grupo oxazolilalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior

- 5 (29) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanoilo inferior, un grupo arilo, un grupo arilalquilo inferior, un grupo aroilo y un grupo alquilo sustituido con amino (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo amino) en el grupo amino,
- 10 (30) un grupo alquilo inferior sustituido con un grupo carbamoilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- (31) un grupo tiocarbamoilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
- (32) un grupo sulfamoilo,
- 15 (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
- (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior,
- (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
- (36) un grupo imidazolilo,
- 20 (37) un grupo triazolilo,
- (38) un grupo isoxazolilo,
- (39) un grupo piperidilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo arilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo alcanoil(inferior)aminoalcanoilo inferior,
- 25 (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo carboxialquilo inferior, un grupo alquil(inferior)carbamoilalquilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi inferior, un grupo carboxilo, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo amino (en el que pueden estar presentes 1 o 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo aroilo), un grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo aroilo), un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes), un grupo 1,4-dioxo-8-azaspiro[4,5]decilo, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes), un grupo piridilo, un grupo piridiloxi, un grupo piridilalcoxi inferior, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo arilalcoxi inferior (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno en el grupo arilo), un grupo arilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxi inferior, un grupo hidroxilo), un grupo ariloxi (que puede tener en el grupo arilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), un grupo arilalquilo inferior (que puede tener en el grupo arilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), y un grupo aroilo (que puede tener en el grupo arilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxi inferior),
- 40 (41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener un grupo como sustituyente, seleccionado del grupo que consiste en un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo hidroxilo, un grupo amino (que puede tener en el grupo amino uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior y un grupo aroilo), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo piperidilalquilo inferior, un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo piperazinilo), un grupo aminoalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo amino), un grupo ariloxi (que puede tener un grupo alcoxi inferior sustituido con uno o varios halógenos en el grupo arilo), un grupo ariloxialquilo inferior (que puede tener un grupo alcoxi inferior sustituido con uno o varios halógenos en el grupo arilo) y un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos oxo),
- 50 (42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos como sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo alcanoilo inferior, un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo aminoalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el
- 60

- grupo amino), un grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo piperidilo), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior, un grupo tetrahidrofurilalquilo inferior, un grupo piridilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos fenilo como sustituyentes en el grupo alquilo inferior), un grupo imidazolilalquilo inferior, un grupo furilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilcarbonilalquilo inferior, un grupo piperidilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyente, un grupo piridilo (que puede tener en el grupo piridilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciano y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como sustituyente), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo arilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo aroilo, un grupo furilcarbonilo, un grupo arilalcoxi(inferior)carbonilo y un grupo oxo,
- (43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,
- (44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo piridilo,
- (45) un grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
- (46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo,
- (47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo piperidilalquilo inferior y un grupo arilo,
- (48) un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos arilo que pueden tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo ciano,
- (49) un grupo azabiciclo[3,2,2]nonilcarbonilo,
- (50) un grupo 8-azabiciclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos ariloxi sustituidos con halógeno o insustituídos,
- (51) un grupo indolinilcarbonilo,
- (52) un grupo tetrahidroquinolilcarbonilo,
- (53) un grupo tetrahidropirido[3,4-b]indolilcarbonilo,
- (54) un grupo morfolinilalquilo inferior,
- (55) un grupo piperazinilalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior en el grupo piperazinilo,
- (56) un grupo morfolinilcarbonilalquilo inferior,
- (57) un grupo piperazinilcarbonilalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior en el grupo piperazinilo,
- (58) un grupo oxo,
- (59) un grupo aminoalcoxi inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior en el grupo amino),
- (60) un grupo alcoxi(inferior)alcoxi inferior,
- (61) un grupo piperazinilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo,
- (62) un grupo morfolinilo,
- (63) un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanil-carbonilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo arilo,
- (64) un grupo tetrahidropiranilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos piridilo,
- (65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos tioxo, y
- (66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decanilo.
- La presente invención también proporciona una composición farmacéutica que comprende un compuesto heterocíclico de fórmula general (1) o una de sus sales de acuerdo con la presente invención, como ingrediente activo y un portador farmacéuticamente aceptable.
- El compuesto heterocíclico de fórmula general (1) y la composición farmacéutica de acuerdo con la presente invención se pueden utilizar en forma de una composición farmacéutica para el tratamiento o la prevención de trastornos del sistema nervioso central seleccionados del grupo que consiste en esquizofrenia; esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; trastornos emocionales; trastornos psicóticos; trastornos del estado de ánimo; trastorno bipolar de tipo I; trastorno bipolar de tipo II; depresión; depresión endógena; depresión mayor; melancolía y depresión refractaria; trastorno distímico; trastorno ciclotímico; ataque de pánico; trastorno por pánico; agorafobia; fobia social; trastorno obsesivo-compulsivo; trastorno por estrés post-traumático; trastorno de ansiedad generalizado; trastorno de estrés agudo; histeria; trastorno de somatización; trastorno de conversión; trastorno por dolor; hipocondriasis; trastorno facticio; trastorno disociativo; disfunción sexual; trastorno del deseo sexual; trastorno de la excitación sexual; disfunción eréctil; anorexia nerviosa; bulimia nerviosa; trastorno del sueño; trastorno de adaptación; abuso de alcohol; intoxicación alcohólica; adicción a fármacos; intoxicación con estimulantes; narcotismo; anhedonia; anhedonia iatrogénica; anhedonia de causa psíquica o mental; anhedonia asociada a depresión; anhedonia asociada a esquizofrenia; delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo asociado a la enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y otras enfermedades neurodegenerativas; deterioro cognitivo causado por enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de la esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia refractaria, intratable o crónica;

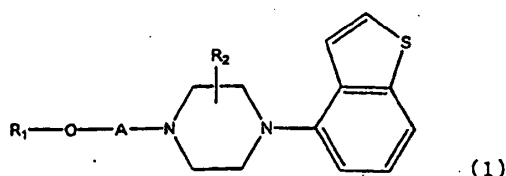
vómito; mareo por movimiento; obesidad; migraña; dolor; retraso mental; trastorno de autismo (autismo); síndrome de Tourette; trastornos de tics; trastorno por déficit de atención con hiperactividad; trastorno de la conducta; y síndrome de Down.

5 La presente invención proporciona un procedimiento para producir una composición farmacéutica que comprende mezclar un compuesto heterocíclico representado por la fórmula (1) o una de sus sales con un portador farmacéuticamente aceptable.

10 La presente invención proporciona el uso de un compuesto heterocíclico representado por la fórmula (1) o una de sus sales como fármaco.

15 Se proporciona específicamente un compuesto heterocíclico representado por la fórmula (1) o una de sus sales, como agonista parcial de receptor D₂ de dopamina y/o antagonista del receptor 5-HT_{2A} de serotonina y/o antagonista del receptor α₁ de adrenalina y/o inhibidor de la absorción de serotonina (o inhibidor de la reabsorción de serotonina).

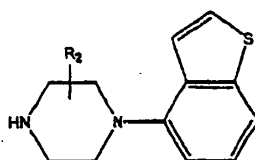
La presente invención proporciona un procedimiento para producir un compuesto heterocíclico representado por la fórmula (1):



20 [donde R₁, R₂ y A son los mismos que se han definido en la reivindicación 1] o una de sus sales, caracterizado por comprender una reacción de un compuesto representado por la fórmula:



25 [donde R₁ y A son los mismos que se han definido antes, y X₁ representa un átomo de halógeno o un grupo que ocasiona una reacción de sustitución igual que en un átomo de halógeno] o una de sus sales con un compuesto representado por la fórmula:



30 [donde R₂ es el mismo que se ha definido antes] o una de sus sales.

MEJOR MODO DE LLEVAR A CABO LA INVENCION

35 Los ejemplos específicos de cada uno de los grupos mostrados en la fórmula general (1) son los siguientes.

Los ejemplos específicos de cada uno de los grupos mostrados en la fórmula general son los siguientes.

40 El grupo alquilo inferior es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un grupo terc-butilo, un grupo sec-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo 1-etilpropilo, un grupo isopentilo, un grupo neo-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo 1,2,2-trimetilpropilo, un grupo 3,3-dimetilbutilo, un grupo 2-etilbutilo, un grupo isohexilo, y un grupo 3-metilpentilo.

45 El grupo alquilen inferior es un grupo alquilen lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metileno, un grupo etileno, un grupo trimetileno, un grupo 2-metiltrimetileno, un grupo 2,2-dimetiletileno, un grupo 2,2-dimetiltrimetileno, un grupo 1-metiltrimetileno, un grupo metilmetileno, un grupo etilmetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno, y un grupo hexametileno.

50 El grupo alquenileno inferior es un grupo alquenileno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6

átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo vinileno, un grupo 1-propenileno, un grupo 1-metil-1-propenileno, un grupo 2-metil-1-propenileno, un grupo 2-propenileno, un grupo 2-butenileno, un grupo 1-butenileno, un grupo 3-butenileno, un grupo 2-pentenileno, un grupo 1-pentenileno, un grupo 3-pentenileno, un grupo 4-pentenileno, un grupo 1,3-butadienileno, un grupo 1,3-pentadienileno, un grupo 2-penten-4-inileno, un grupo 2-hexenileno, un grupo 1-hexenileno, un grupo 5-hexenileno, un grupo 3-hexenileno, un grupo 4-hexenileno, un grupo 3,3-dimetil-1-propenileno, un grupo 2-etil-1-propenileno, un grupo 1,3,5-hexatrienileno, un grupo 1,3-hexadienileno, y un grupo 1,4-hexadienileno.

El grupo alqueno inferior es un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6 átomos de carbono, incluyendo configuraciones tanto trans como cis. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-metil-1-propenilo, un grupo 2-metil-1-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1,3-butadienilo, un grupo 1,3-pentadienilo, un grupo 2-penten-4-ilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 5-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo, un grupo 3,3-dimetil-1-propenilo, un grupo 2-etil-1-propenilo, un grupo 1,3,5-hexatrienilo, un grupo 1,3-hexadienilo, y un grupo 1,4-hexadienilo.

Los ejemplos del átomo de halógeno incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido con halógeno incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes sustituido con 1 a 7, más preferiblemente, de 1 a 3 átomos de halógeno. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo fluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo clorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo bromometilo, un grupo dibromometilo, un grupo diclorofluorometilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 2-fluoroetilo, un grupo 2-cloroetilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo heptafluoropropilo, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, un grupo heptafluoroisopropilo, un grupo 3-cloropropilo, un grupo 2-cloropropilo, un grupo 3-bromopropilo, un grupo 4,4,4-trifluorobutilo, un grupo 4,4,4,3,3-pentafluorobutilo, un grupo 4-clorobutilo, un grupo 4-bromobutilo, un grupo 2-clorobutilo, un grupo 5,5,5-trifluoropentilo, un grupo 5-cloropentilo, un grupo 6,6,6-trifluorohexilo, un grupo 6-clorohexilo, y un grupo perfluorohexilo.

El grupo alcoxi inferior es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo isopropoxi, un grupo n-butoxi, un grupo isobutoxi, un grupo terc-butoxi, un grupo sec-butoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo isopentiloxi, un grupo neopentiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo isohexiloxi, y un grupo 3-metilpentiloxi.

Los ejemplos del grupo arilo incluyen un grupo fenilo, un grupo fenilo sustituido, un grupo bifenilo, un grupo bifenilo sustituido, un grupo naftilo, y un grupo naftilo sustituido. Los ejemplos del sustituyente para un grupo arilo incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo inferior lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes, y un grupo amino. En el grupo arilo, pueden estar presentes de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente, de 1 a 2 sustituyentes de al menos un tipo de estos. Los ejemplos específicos del grupo arilo pueden incluir un grupo fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bifenilo, un grupo (1- o 2-)naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-hexilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)isobutilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butilfenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-propil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-propil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-butil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-butil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-butil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-4-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-

, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)clorofenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)fluorofenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bromofenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)aminofenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-2-naftilo, un grupo 2,3-dimetilfenilo, un grupo 3,4-dimetilfenilo, un grupo 2,4-dimetilfenilo, un grupo 2,5-dimetilfenilo, un grupo 2,6-dimetilfenilo, un grupo 2,4,6-trimetilfenilo, un grupo 3,4,5-trimetilfenilo, un grupo 2,3,4,5-tetraetilfenilo, un grupo pentametilfenilo, un grupo 2,4-dimetil-1-naftilo, un grupo 2,3-dimetil-1-naftilo, un grupo 3,9-dimetil-1-naftilo, un grupo 3,5,7-trietilnaftilo, un grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftilo, un grupo 2,3,4,5,7-pentametil-1-naftilo, un grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftilo, un grupo heptametil-1-naftilo, un grupo 2,3-diaminofenilo, un grupo 2,4,6-triaminofenilo, y un grupo 2-metil-5-cloro-1-naftilo.

Los ejemplos del grupo ariloxi incluyen un grupo feniloxi, un grupo feniloxi sustituido, un grupo bifeniloxi, un grupo bifeniloxi sustituido, un grupo naftiloxi, y un grupo naftiloxi sustituido. Los ejemplos del sustituyente para un grupo ariloxi incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes, y un grupo amino. En el grupo arilo, pueden estar presentes de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente, de 1 a 2 sustituyentes de al menos un tipo de estos. Los ejemplos específicos de los grupos ariloxi incluyen un grupo feniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)bifeniloxi, un grupo (1- o 2-)naftiloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)metilfeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)etilfeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propilfeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butilfeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentilfeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-hexilfeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)isobutilfeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butilfeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-propil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-propil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-propil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-butil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-butil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-4-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 9-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)clorofeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)fluorofeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)bromofeniloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)aminofeniloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-2-naftiloxi, un grupo 2,3-dimetilfeniloxi, un grupo 3,4-dimetilfeniloxi, un grupo 2,4-dimetilfeniloxi, un grupo 2,5-dimetilfeniloxi, un grupo 2,6-dimetilfeniloxi, un grupo 2,9,6-trimetilfeniloxi, un grupo 3,4,5-trimetilfeniloxi, un grupo 2,3,4,5-tetraetilfeniloxi, un grupo pentametilfeniloxi, un grupo 2,4-dimetil-1-naftiloxi, un grupo 2,3-dimetil-1-naftiloxi, un grupo 3,4-dimetil-1-naftiloxi, un grupo 3,5,7-trietil-1-naftiloxi, un grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftiloxi, un grupo 2,3,4,5,7-pentametil-1-naftiloxi, un grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftiloxi, un grupo heptametil-1-naftiloxi, un grupo 2,3-diaminofeniloxi, un grupo 2,4,6-triaminofeniloxi, y un grupo 2-metil-5-cloro-1-naftiloxi.

El grupo alquil(inferior)tio es un grupo alquiltio lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo isopropiltio, un grupo n-butiltio, un grupo terc-butiltio, un grupo n-pentiltio, y un grupo n-hexiltio.

Los ejemplos del grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno incluyen un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes sustituido con 1 a 7, preferiblemente, de 1 a 3 átomos de halógeno. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo fluorometoxi, un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo clorometoxi, un grupo diclorometoxi, un grupo triclorometoxi, un grupo bromometoxi, un grupo dibromometoxi, un grupo diclorofluorometoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, un grupo pentafluoroetoxi, un grupo 2-cloroetoxi, un grupo 3,3,3-trifluoropropoxi, un grupo heptafluoropropoxi, un grupo heptafluoroisopropoxi, un grupo 3-cloropropoxi, un grupo 2-cloropropoxi, un grupo 3-bromopropoxi, un grupo 4,4,4-trifluorobutoxi, un grupo 4,4,4,3,3-pentafluorobutoxi, un grupo 4-clorobutoxi, un grupo

4-bromobutoxi, un grupo 2-clorobutoxi, un grupo 5,5,5-trifluoropentoxi, un grupo 5-cloropentoxi, un grupo 6,6,6-trifluorohexiloxi, y un grupo 6-clorohexiloxi.

5 Los ejemplos del grupo protector de un grupo hidroxil incluyen un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo alcanilo inferior (un grupo alcanilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), y un grupo fenilalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono.

10 Los ejemplos del grupo hidroxil protegido incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo isopropoxi, un grupo n-butoxi, un grupo isobutoxi, un grupo terc-butoxi, un grupo sec-butoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo isopentiloxi, un grupo neopentiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo isohexiloxi, un grupo 3-metilpentiloxi, un grupo alcanilo(inferior)oxi y un grupo fenilalcoxi inferior. Los ejemplos específicos incluyen un grupo formiloxi, un grupo acetiloxi, un grupo propioniloxi, un grupo butiriloxi, un grupo isobutiriloxi, un grupo pentanoiloxi, un grupo terc-butilcarboniloxi, un grupo hexanoiloxi, un grupo benciloxi, un grupo 2-feniletoxi, un grupo 1-feniletoxi, un grupo 3-fenilpropoxi, un grupo 4-fenilbutoxi, un grupo 5-fenilpentiloxi, un grupo 6-fenilhexiloxi, un grupo 1,1-dimetil-2-feniletoxi, y un grupo 2-metil-3-fenilpropoxi.

20 Los ejemplos del grupo hidroxialquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes que tiene de 1 a 5, preferiblemente de 1 a 3 grupos hidroxil (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo hidroximetilo, un grupo 2-hidroxietilo, un grupo 1-hidroxietilo, un grupo 3-hidroxipropilo, un grupo 2,3-dihidroxipropilo, un grupo 4-hidroxibutilo, un grupo 3,4-dihidroxibutilo, un grupo 1,1-dimetil-2-hidroxietilo, un grupo 5-hidroxipentilo, un grupo 6-hidroxihexilo, un grupo 3,3-dimetil-3-hidroxipropilo, un grupo 2-metil-3-hidroxipropilo, un grupo 2,3,4-trihidroxibutilo, y un grupo perhidroxihexilo.

25 Los ejemplos del grupo protector de un grupo hidroxialquilo inferior incluyen un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo alcanilo inferior (un grupo alcanilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), y un grupo fenilalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono.

30 Los ejemplos del grupo hidroxialquilo inferior protegido incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 5, preferiblemente de 1 a 3 grupos hidroxil protegidos como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo alcoxi inferior, un grupo alcanilo(inferior)oxi o un grupo fenilalcoxi inferior). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metoximetilo, un grupo 2-metoxietilo, un grupo 2-etoxietilo, un grupo 2-n-propoxietilo, un grupo 2-isopropoxietilo, un grupo 2-n-butoxietilo, un grupo 2-isobutoxietilo, un grupo 2-terc-butoxietilo, un grupo 2-sec-butoxietilo, un grupo 2-n-pentiloxietilo, un grupo 2-isopentiloxietilo, un grupo 2-neopentiloxietilo, un grupo 2-n-hexiloxietilo, un grupo 2-isohexiloxietilo, un grupo 2-(3-metilpentiloxi)etilo, un grupo 2-formiloxietilo, un grupo 2-acetiloxietilo, un grupo 2-propioniloxietilo, un grupo 2-butililoxietilo, un grupo 2-isobutililoxietilo, un grupo 2-pentanoiloxietilo, un grupo 2-terc-butilcarboniloxietilo, un grupo 2-hexanoiloxietilo, un grupo 2-benciloxietilo, un grupo 2-(2-feniletoxi)etilo, un grupo 2-(1-feniletoxi)etilo, un grupo 2-(3-fenilpropoxi)etilo, un grupo 2-(4-fenilbutoxi)etilo, un grupo 2-(5-fenilpentiloxi)etilo, un grupo 2-(6-fenilhexiloxi)etilo, un grupo 2-(1,1-dimetil-2-feniletoxi)etilo, un grupo 2-(2-metil-3-fenilpropoxi)etilo, un grupo 3-etoxipropilo, un grupo 2,3-dietoxipropilo, un grupo 4-etoxibutilo, un grupo 3,4-dietoxibutilo, un grupo 1,1-dimetil-2-etoxietilo, un grupo 5-etoxipentilo, un grupo 6-etoxihexilo, un grupo 3,3-dimetil-3-etoxipropilo, un grupo 2-metil-3-etoxipropilo, y un grupo 2,3,4-trietoxibutilo.

45 El grupo alcanilo inferior es un grupo alcanilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo formilo, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo butirilo, un grupo isobutirilo, un grupo pentanoilo, un grupo terc-butilcarbonilo, y un grupo hexanoilo.

50 El grupo alcoxi(inferior)carbonilo es un grupo alcoxycarbonilo lineal o ramificado cuyo radical alcoxi inferior es como el ilustrado anteriormente, y tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metoxycarbonilo, un grupo etoxycarbonilo, un grupo n-propoxycarbonilo, un grupo isopropoxycarbonilo, un grupo n-butoxycarbonilo, un grupo isobutoxycarbonilo, un grupo terc-butoxycarbonilo, un grupo sec-butoxycarbonilo, un grupo n-pentiloxycarbonilo, un grupo neopentiloxi, un grupo n-hexiloxycarbonilo, un grupo isohexiloxycarbonilo, y un grupo 3-metilpentil-oxycarbonilo.

55 El grupo alquil(inferior)sulfonilo es un grupo alquilsulfonilo lineal o ramificado cuyo radical alquilo inferior es como el ilustrado anteriormente, y tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo n-propilsulfonilo, un grupo isopropilsulfonilo, un grupo n-butilsulfonilo, un grupo isobutilsulfonilo, un grupo terc-butilsulfonilo, un grupo sec-butilsulfonilo, un grupo n-pentilsulfonilo, un grupo isopentilsulfonilo, un grupo neopentilsulfonilo, un grupo n-hexilsulfonilo, un grupo isohexilsulfonilo, y un grupo 3-metilpentilsulfonilo.

60 El grupo alquil(inferior)carbamoilo es un grupo carbamoilo que tiene de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) como sustituyente o

sustituyentes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo N-metilcarbamoilo, un grupo N,N-dimetilcarbamoilo, un grupo N-etilcarbamoilo, un grupo N,N-dietilcarbamoilo, un grupo N-n-propilcarbamoilo, un grupo N-n-butilcarbamoilo, un grupo N-n-pentilcarbamoilo, un grupo N-n-hexilcarbamoilo, un grupo N-isobutilcarbamoilo, un grupo N-terc-butilcarbamoilo, un grupo y N,N-di-n-propilcarbamoilo.

Los ejemplos del grupo aminoalcanoilo incluyen un grupo alcanoilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos amino. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo aminoacetilo, un grupo 3-aminopropionilo, un grupo 4-aminobutirilo, un grupo 3,4-diaminobutirilo, un grupo 3,3-dimetil-3-aminopropionilo, un grupo 4-aminobutirilo y un grupo 5-aminovalerilo.

Los ejemplos del grupo alcanoil(inferior)-aminoalcanoilo inferior incluyen un grupo alcanoilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) cuyo radical alcanoilo tiene de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alcanoil(inferior)amino como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo N-formilaminoacetilo, un grupo N-acetilaminoacetilo, un grupo N-propionilaminoacetilo, un grupo 3-(N-acetilamino)propionilo, un grupo 4-(N-acetilamino)butirilo, un grupo 3,4-di(N-acetilamino)butirilo, un grupo 3,3-dimetil-3-(N-propinilamino)propionilo, un grupo 4-(N-formilamino)butirilo, y un grupo 5-(N-acetilamino)valerilo.

Los ejemplos del grupo alcoxi(inferior)carbonil-aminoalcanoilo inferior incluyen un grupo alcanoilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) cuyo radical alcoxi(inferior)carbonilo tiene de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alcoxi(inferior)carbonilamino como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo N-metoxicarbonilaminoacetilo, un grupo N-etoxicarbonilaminoacetilo, un grupo N-terc-butoxicarbonilaminoacetilo, un grupo 3-(N-metoxicarbonilamino)propionilo, un grupo 4-(N-acetilamino)butirilo, un grupo 3,4-di(N-acetilamino)butirilo, un grupo 3,3-dimetil-3-(N-propinilamino)propionilo, un grupo 4-(N-formilamino)butirilo y un grupo 5-(N-acetilamino)valerilo. Los ejemplos del grupo amino que tiene, como sustituyente, un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alquil(inferior)sulfonilo, un grupo carbamoilo, un grupo alquil(inferior)carbamoilo, un grupo aminoalcanoilo inferior, un grupo alcanoil(inferior)aminoalcanoilo inferior, y un grupo alcoxi(inferior)carbonilaminoalcanoilo inferior incluyen un grupo amino que tiene, como sustituyente, de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alcanoilo inferior como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes;

un grupo alquil(inferior)sulfonilo como se ha ilustrado antes (un grupo alquilsulfonilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo carbamoilo;

a grupo alquil(inferior)carbamoilo como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo carbamoilo que tiene, como sustituyente, de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono)); un grupo aminoalcanoilo inferior como se ha ilustrado antes; un grupo alcanoil(inferior)aminoalcanoilo inferior como se ha ilustrado antes; y un grupo alcoxi(inferior)carbonilaminoalcanoilo inferior como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo amino, N-metilamino, un grupo N,N-dimetilamino, un grupo N-etilamino, un grupo N-n-propilamino, un grupo N-isopropilamino, un grupo N-formilamino, un grupo N-acetilamino, un grupo N-terc-butoxicarbonilamino, un grupo N-metoxicarbonilamino, un grupo N-metilsulfonilamino, un grupo N-etilsulfonilamino, un grupo N-metil-N-acetilamino, un grupo N-metil-N-metoxicarbonilamino, un grupo N-[N,N-dimetilcarbamoil]amino, un grupo N-carbamoilamino, un grupo N-[N-metilcarbamoil]amino, un grupo N-[N,N-dietilcarbamoil]amino, un grupo N-(aminoacetil)amino, un grupo N-[[N-formilamino]acetil]amino, un grupo N-[[N-acetilamino]acetil]amino, un grupo N-([N-metoxicarbonilamino]acetil)amino, y un grupo N-([N-terc-butoxicarbonilamino]acetil)amino.

Los ejemplos del grupo arilsulfonilo que puede tener un grupo alquilo inferior en un grupo arilo incluyen un grupo arilsulfonilo cuyo radical arilo es fenilo, bifenilo, naftilo o similares y en el que están presentes de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente, de 1 a 2 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos específicos del grupo arilsulfonilo que puede tener un grupo alquilo inferior en un grupo arilo incluyen un grupo fenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bifenilsulfonilo, un grupo (1- o 2-)naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-hexilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)isobutilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butilfenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 9', 5', o 6')metil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-propil-2-bifenilsulfonilo, un

grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-n-propil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-n-propil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-n-butil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-n-butil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-n-butil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-n-pentil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-n-pentil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-n-pentil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-n-hexil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-n-hexil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-n-hexil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-isobutil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-isobutil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-isobutil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-terc-butil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-terc-butil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')-terc-butil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-1-naftilsulfonilo, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 9-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-2-naftilsulfonilo, un grupo 2,3-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 3,4-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,4-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,5-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,6-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,4,6-trimetilfenilsulfonilo, un grupo 3,4,5-trimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,3,4,5-tetraetilfenilsulfonilo, un grupo pentametilfenilsulfonilo, un grupo 2,4-dimetil-1-naftilsulfonilo, un grupo 2,3-dimetil-1-naftilsulfonilo, un grupo 3,4-dimetil-1-naftilsulfonilo, un grupo 3,5,7-trietil-1-naftilsulfonilo, un grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftilsulfonilo, un grupo 2,3,4,5,7-pentametil-1-naftilsulfonilo, un grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftilsulfonilo, y un grupo heptametil-1-naftilsulfonilo.

Los ejemplos del grupo carboxilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos carboxilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo carboximetilo, un grupo 2-carboxietilo, un grupo 1-carboxietilo, un grupo 1-carboxi-1-metiletilo, un grupo 3-carboxipropilo, un grupo 2,3-dicarboxipropilo, un grupo 4-carboxibutilo, un grupo 3,4-dicarboxibutilo, un grupo 1,1-dimetil-2-carboxietilo, un grupo 5-carboxipentilo, un grupo 6-carboxihexilo, un grupo 3,3-dimetil-3-carboxipropilo, un grupo 2-metil-3-carboxipropilo, y un grupo 2,3,4-tricarboxibutilo.

Los ejemplos del grupo alcoxi(inferior)carbonilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metoxycarbonilmetilo, un grupo etoxycarbonilmetilo, un grupo 1-metoxycarboniletilo, un grupo 2-metoxycarboniletilo, un grupo 2-etoxycarboniletilo, un grupo 1-etoxycarboniletilo, un grupo 3-metoxycarbonilpropilo, un grupo 3-etoxycarbonilpropilo, un grupo 4-etoxycarbonilbutilo, un grupo 5-isopropoxycarbonilpentilo, un grupo 6-n-propoxycarbonilhexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-n-butoxycarboniletilo, un grupo 1-metil-1-metoxycarboniletilo, un grupo 2-metil-1-metoxycarbonilpropilo, un grupo 2-metil-3-terc-butoxycarbonilpropilo, un grupo 3-metil-1-metoxycarbonilbutilo, un grupo dietoxycarbonilmetilo, un grupo 1,2-dietoxycarboniletilo, un grupo 2-n-pentiloxycarboniletilo, y un grupo n-hexiloxycarbonilmetilo.

Los ejemplos del grupo carbamoilalquilo inferior que puede tener un grupo, como sustituyente, seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo que puede tener un grupo alquilo inferior y un grupo fenilo que puede tener un grupo alcoxi inferior incluyen, un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos carbamoilo. El radical carbamoilo puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo fenilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) y un grupo fenilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (grupos alcoxi lineales o ramificados que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del grupo carbamoilalquilo inferior incluyen un grupo carbamoilmetilo, un grupo dicarbamoilmetilo, un grupo 2-carbamoiletilo, un grupo 1-carbamoiletilo, un grupo 1-carbamoil-2-metilpropilo, un grupo 3-carbamoilpropilo, un grupo 4-carbamoilbutilo, un grupo 5-carbamoilpentilo, un grupo 6-carbamoilhhexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-carbamoiletilo, un grupo 2-metil-3-carbamoilpropilo, un grupo N-metilcarbamoilmetilo, un grupo N,N-dimetilcarbamoilmetilo, un grupo N-metil-N-etilcarbamoilmetilo, un grupo N-metilcarbamoilmetilo, un grupo 2-(N-metilcarbamoil)etilo, un grupo 2-(N-etilcarbamoil)etilo, un grupo N-fenilcarbamoilmetilo, un grupo N-(2-metoxifenil)carbamoilmetilo, y un grupo N-(4-metilfenil)carbamoilmetilo.

Los ejemplos del grupo carboxialqueno inferior incluyen un grupo alqueno inferior como se ha ilustrado antes que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1, grupos carboxilo, incluyendo configuraciones tanto trans como cis (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-carboxietenilo, un grupo 3-carboxi-2-propenilo, un grupo 4-carboxi-2-butenilo, un

grupo 4-carboxi-3-butenilo, un grupo 4-carboxi-1,3-butadienilo, un grupo 5-carboxi-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-carboxi-2,4-hexadienilo, un grupo 5-carboxi-3-pentenilo, y un grupo 3-carboxi-1-propenilo.

Los ejemplos del grupo alcoxi(inferior)carbonilalquenilo inferior incluyen un grupo alquenilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquenilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 grupos alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes, incluyendo configuraciones tanto trans como cis. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi(inferior)carbonilalquenilo inferior incluyen un grupo 2-metoxicarboniletenilo, un grupo 2-etoxicarboniletenilo, un grupo 1-etoxicarboniletenilo, un grupo 3-metoxicarbonil-2-propenilo, un grupo 3-etoxicarbonil-2-propenilo, un grupo 4-etoxicarbonil-2-butenilo, un grupo 4-etoxicarbonil-1,3-butadienilo, un grupo 5-isopropoxycarbonil-3-pentenilo, un grupo 6-n-propoxycarbonil-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 1,1-dimetil-2-n-butoxicarboniletenilo, un grupo 2-metil-3-terc-butoxicarbonil-2-propenilo, y un grupo 2-n-pentiloxicarboniletenilo.

Los ejemplos del grupo carbamoilalquenilo inferior incluyen un grupo alquenilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquenilo lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 3 enlaces dobles) que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1, grupos carbamoilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-carbamoiletenilo, un grupo 3-carbamoil-2-propenilo, un grupo 4-carbamoil-2-butenilo, un grupo 4-carbamoil-3-butenilo, un grupo 4-carbamoil-1,3-butadienilo, un grupo 5-carbamoil-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-carbamoil-2,4-hexadienilo, un grupo 5-carbamoil-3-pentenilo, y un grupo 3-carbamoil-1-propenilo.

Los ejemplos del grupo carbamoilalquenilo inferior que puede tener, como sustituyente, un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno incluyen un grupo alquenilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquenilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1 grupo carbamoilo que puede tener, en el grupo carbamoilo, de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono preferiblemente que tiene de 1 a 7, más preferiblemente de 1 a 3 sustituyentes de átomo de halógeno). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-carbamoiletenilo, un grupo 2-(N-metilcarbamoil)etenilo, un grupo 2-(N-etilcarbamoil)etenilo, un grupo 2-(N,N-dimetilcarbamoil)etenilo, y un grupo 2-[N-(2,2,2-trifluoroetil)carbamoil]etenilo.

Los ejemplos del grupo alcoxi(inferior)alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1, grupos alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metoximetilo, un grupo 2-metoxietilo, un grupo 1-etoxietilo, un grupo 2-etoxietilo, un grupo 2-isobutoxietilo, un grupo 2,2-dimetoxietilo, un grupo 2-metoxi-1-metiletilo, un grupo 2-metoxi-1-etiletilo, un grupo 3-metoxipropilo, un grupo 3-etoxipropilo, un grupo 2-isopropoxietilo, un grupo 3-isopropoxipropilo, un grupo 3-n-butoxipropilo, un grupo 4-n-propoxibutilo, un grupo 1-metil-3-isobutoxi propilo, un grupo 1,1-dimetil-2-n-pentiloxietilo, un grupo 5-n-hexiloxipentilo, un grupo 6-metoxihexilo, un grupo 1-etoxiisopropilo, y un grupo 2-metil-3-metoxipropilo.

Los ejemplos del grupo ariloxialquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1 grupo ariloxi cuyo radical arilo es fenilo, bifenilo, naftilo o similares. Los ejemplos de un sustituyente para un grupo arilo incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes, y un grupo amino. Pueden estar presentes de uno a siete sustituyentes de al menos un tipo de estos en un anillo de arilo. Los ejemplos específicos del ariloxialquilo inferior incluyen un grupo fenoximetilo, un grupo 2-fenoxietilo, un grupo 2-[(1- o 2-naftiloxi)etilo], un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)metilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)etilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)n-propilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)n-butilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)n-pentilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)n-hexilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)isobutilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)terc-butilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)clorofenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)fluorofenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)bromofenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-

)bromo-2-naftiloxi] etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)aminofenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-(2,3-dimetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(3,4-dimetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(2,4-dimetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(2,5-dimetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(2,6-dimetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(2,4,6-trimetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(3,4,5-trimetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(2,3,4,5-tetraetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(pentametilfenoxi)etilo, un grupo 2-(2,4-dimetil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(2,3-dimetil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(3,4-dimetil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(3,5,7-trietil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(3,4,5,7-tetrametil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(2,3,9,5,7-pentametil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(heptametil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(2,3-diaminofenoxi)etilo, un grupo 2-(2,4,6-triaminofenoxi)etilo, un grupo 2-(2-metil-5-cloro-1-naftil)etilo, un grupo 3-fenoxipropilo, un grupo 2,3-difenoxipropilo, un grupo 4-fenoxibutilo, un grupo 3,4-difenoxibutilo, un grupo 1,1-dimetil-2-fenoxietilo, un grupo 5-fenoxipentilo, un grupo 6-fenoxihexilo, un grupo 3,3-dimetil-3-fenoxipropilo, un grupo 2-metil-3-fenoxipropilo, un grupo y 2,3,4-trifenoxibutilo, un grupo 3-[(1- o 2-)naftiloxi]propilo, un grupo 2,3-di[(1- o 2-)naftiloxi]propilo, un grupo 4-[(1- o 2-)naftiloxi]butilo, un grupo 3,4-di[(1- o 2-)naftiloxi]butilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(1- o 2-)naftiloxi]etilo, un grupo 5-[(1- o 2-)naftiloxi]pentilo, un grupo 6-[(1- o 2-)naftiloxi]hexilo, un grupo 3,3-dimetil-3-[(1- o 2-)naftiloxi]propilo, un grupo 2-metil-3-[(1- o 2-)naftiloxi]propilo, y un grupo 2,3,4-tri[(1- o 2-)naftiloxi]butilo.

Los ejemplos del grupo aminoalquilo inferior que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo aroilo y un grupo carbamilo incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 5 (preferiblemente 1) grupos amino que pueden tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcanilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un grupo aroilo como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo benzoilo) como se ha ilustrado antes y un grupo carbamilo. Los ejemplos específicos del grupo aminoalquilo inferior incluyen un grupo aminometilo, un grupo 2-aminoetilo, un grupo 1-aminoetilo, un grupo 3-aminopropilo, un grupo 4-aminobutilo, un grupo 5-aminopentilo, un grupo 6-aminohexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-aminoetilo, un grupo 2-metil-3-aminopropilo, un grupo N,N-dimetilaminometilo, un grupo N-metil-N-etilaminometilo, un grupo N-metilaminometilo, un grupo 2-(N-metilamino)etilo, un grupo 1-metil-2-(N,N-dimetilamino)etilo, un grupo 1-metil-2-(N,N-dietilamino)etilo, un grupo 2-(N,N-dimetilamino)etilo, un grupo 2-(N,N-dietilamino)etilo, un grupo 2-(N,N-diisopropilamino)etilo, un grupo 3-(N,N-dimetilamino)propilo, un grupo 3-(N,N-dietilamino)propilo, un grupo 2-(N-acetilamino)etilo, un grupo 2-(N-metil-N-acetilamino)etilo, un grupo 2-(N-metil-N-n-butirilamino)etilo, un grupo 2-(N-metil-N-benzoilamino)etilo, y un grupo 2-(N-carbamilamino)etilo.

Los ejemplos del grupo cicloalquilo C_3-C_8 incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo, y un grupo ciclooctilo.

Los ejemplos del grupo cicloalquilo C_3-C_8 que puede tener un grupo, como sustituyente, seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo fenilalcoxi inferior incluyen un grupo cicloalquilo C_3-C_8 que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos, como sustituyente o sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo hidroxilo; a un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes; y un grupo alcoxi inferior (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos fenilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo, un grupo ciclooctilo, un grupo 1-metilciclopropilo, un grupo 1-metilciclopentilo, un grupo 1-metilciclohexilo, un grupo 2-metilciclohexilo, un grupo 4-hidroxiciclohexilo, un grupo 4-metoxicarbonilciclohexilo, un grupo 2-benciloxipentilo, y un grupo 2-benciloxihexilo.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido con cicloalquilo C_3-C_8 incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1 grupo cicloalquilo C_3-C_8 como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo ciclopropilmetilo, un grupo ciclohexilmetilo, un grupo 2-ciclopropiletilo, un grupo 1-ciclobutiletilo, un grupo ciclopentilmetilo, un grupo 3-ciclopentilpropilo, un grupo 4-ciclohexilbutilo, un grupo 5-cicloheptilpentilo, un grupo 6-ciclooctilhexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-ciclohexiletilo, y un grupo 2-metil-3-ciclopropilpropilo.

Los ejemplos del grupo furilalquilo inferior (que puede tener un sustituyente de un grupo alquilo inferior en el grupo furilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos furilo en los cuales pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo [(2- o 3-)furil]metilo, un grupo 2-[(2- o 3-)furil]etilo, un grupo 1-[(2- o 3-)furil]etilo, un grupo 3-[(2- o 3-)furil]propilo, un grupo

4-[(2- o 3-)furi]butilo, un grupo 5-[(2- o 3-)furi]pentilo, un grupo 6-[(2- o 3-)furi]hexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(2- o 3-)furi]etilo, un grupo 2-metil-3-[(2- o 3-)furi]propilo, un grupo [5-etil-(2-, 3-, o 4-)furi]metilo, un grupo [5-metil-(2-, 3-, o 4-)furi]metilo, un grupo [2-n-propil-(3-, 4-, o 5-)furi]metilo, un grupo [3-terc-butil-(2-, 4-, o 5-)furi]metilo, un grupo [4-n-pentil-(2-, 3-, o 5-)furi]metilo, un grupo [2-n-hexil-(3-, 4-, o 5-)furi]metilo, un grupo [2,5-dimetil-(3- o 4-)furi]metilo, un grupo [2,5-dietil-(3- o 4-)furi]metilo, y un grupo [2,4,5-trietil-3-furi]metilo.

Los ejemplos del grupo tetrahidrofuralquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos tetrahidrofurilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2- o 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuri]metilo, un grupo 2-[(2- o 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuri]etilo, un grupo 1-[(2- o 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuri]etilo, un grupo 3-[(2- o 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuri]propilo, un grupo 2,3-di[(2- o 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuri]propilo, un grupo 4-[(2- o 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuri]butilo, un grupo 3,4-di[(2- o 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuri]butilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(2- o 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuri]etilo, un grupo 5-[(2- o 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuri]pentilo, un grupo 6-[(2- o 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuri]hexilo, un grupo 3,3-dimetil-3-[(2- o 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuri]propilo, un grupo 2-metil-3-[(2- o 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuri]propilo, y un grupo 2,3,4-tri[(2- o 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuri]butilo.

Los ejemplos del grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos 1,3-dioxolanilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo [(2- o 4-)1,3-dioxolanil]metilo, un grupo 2-[(2- o 4-)1,3-dioxolanil]etilo, un grupo 1-[(2- o 4-)1,3-dioxolanil]etilo, un grupo 3-[(2- o 4-)1,3-dioxolanil]propilo, un grupo 4-[(2- o 4-)1,3-dioxolanil]butilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(2- o 4-)1,3-dioxolanil]etilo, un grupo 5-[(2- o 4-)1,3-dioxolanil]pentilo, un grupo 6-[(2- o 4-)1,3-dioxolanil]hexilo, un grupo 1-[(2- o 4-)1,3-dioxolanil]isopropilo, y un grupo 2-metil-3-[(1-, 2-, o 4-)imidazolil]propilo.

Los ejemplos del grupo tetrahidropiranilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos tetrahidropiranilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo [(2-, 3-, o 4-)tetrahidropiranil]metilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)tetrahidropiranil]etilo, un grupo 1-[(2-, 3-, o 4-)tetrahidropiranil]etilo, un grupo 3-[(2-, 3-, o 4-)tetrahidropiranil]propilo, un grupo 4-[(2-, 3-, o 4-)tetrahidropiranil]butilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(2-, 3-, o 4-)tetrahidropiranil]etilo, un grupo 5-[(2-, 3-, o 4-)tetrahidropiranil]pentilo, un grupo 6-[(2-, 3-, o 4-)tetrahidropiranil]hexilo, un grupo 1-[(2-, 3-, o 4-)tetrahidropiranil]isopropilo, y un grupo 2-metil-3-[(2-, 3-, o 4-)tetrahidropiranil]propilo.

Los ejemplos del grupo pirrolilalquilo inferior (que puede tener un sustituyente de un grupo alquilo inferior en el grupo pirrolilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos pirrolilo en los que pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo [(1-, 2-, o 3-)pirrolil]metilo, un grupo 2-[(1-, 2-, o 3-)pirrolil]etilo, un grupo 1-[(1-, 2-, o 3-)pirrolil]etilo, un grupo 3-[(1-, 2-, o 3-)pirrolil]propilo, un grupo 4-[(1-, 2-, o 3-)pirrolil]butilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(1-, 2-, o 3-)pirrolil]etilo, un grupo 5-[(1-, 2-, o 3-)pirrolil]pentilo, un grupo 6-[(1-, 2-, o 3-)pirrolil]hexilo, un grupo 1-[(1-, 2-, o 3-)pirrolil]isopropilo, un grupo 2-metil-3-[(1-, 2-, o 3-)pirrolil]propilo, un grupo [1-metil-(2- o 3-)pirrolil]metilo, un grupo [1-etil-(2- o 3-)pirrolil]metilo, un grupo [1-n-propil-(2- o 3-)pirrolil]metilo, un grupo [1-n-butil-(2- o 3-)pirrolil]metilo, un grupo [1-n-pentil-(2- o 3-)pirrolil]metilo, un grupo [1-n-hexil-(2- o 3-)pirrolil]metilo, un grupo 2-[5-metil-(1-, 2-, 3-, o 4-)pirrolil]etilo, un grupo 1-[1-etil-(2- o 3-)pirrolil]etilo, un grupo 3-[1-etil-(2- o 3-)pirrolil]propilo, un grupo 4-[1-n-propil-(2- o 3-)pirrolil]butilo, un grupo 5-[1-n-butil-(2- o 3-)pirrolil]pentilo, un grupo 6-[1-n-pentil-(2- o 3-)pirrolil]hexilo, un grupo [1,5-dimetil-(2-, 3-, o 4-)pirrolil]metilo, un grupo [1,3,5-trimetil-2-pirrolil]metilo, y un grupo [1,2,4-trimetil-3-pirrolil]metilo.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido con un grupo dihidropirazolilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene un grupo 2,3-dihidropirazolilo o un grupo 4,5-dihidropirazolilo como grupo dihidropirazolilo, en el que puede estar presente un grupo oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 3-(2,3- o 4,5-)dihidropirazolil]metilo, un grupo 2-[4-(2,3- o 4,5-)dihidropirazolil]etilo, un grupo 1-[5-(2,3- o 4,5-)dihidropirazolil]etilo, un grupo 3-[3-(2,3- o 4,5-)dihidropirazolil]propilo, un grupo 4-[4-(2,3- o 4,5-)dihidropirazolil]butilo, un grupo 5-[1-(2,3- o 4,5-)dihidropirazolil]pentilo, un grupo 6-[5-(2,3- o 4,5-)dihidropirazolil]hexilo, un grupo 2-metil-3-[1-(2,3- o 4,5-)dihidropirazolil]propilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[3-(2,3- o 4,5-)dihidropirazolil]etilo, un grupo 5-oxo-4-(4,5-dihidropirazolil]metilo, un grupo 2-[5-oxo-4-(4,5-dihidropirazolil]etilo, y un grupo 3-[5-oxo-4-(4,5-dihidropirazolil]propilo.

Los ejemplos del grupo pirazolilalquilo inferior (que puede tener un sustituyente de un grupo alquilo inferior en el grupo pirazolilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos pirazolilo, en los cuales pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos

específicos incluyen un grupo 3-pirazolilmetilo, un grupo 2-(4-pirazolil)etilo, un grupo 2-(1-pirazolil)etilo, un grupo 1-(5-pirazolil)etilo, un grupo 3-(3-pirazolil)propilo, un grupo 4-(4-pirazolil)butilo, un grupo 5-(1-pirazolil)pentilo, un grupo 6-(5-pirazolil)hexilo, un grupo 2-metil-3-(1-pirazolil)propilo, un grupo 1,1-dimetil-2-(3-pirazolil)etilo, un grupo 1-metil-3-pirazolilmetilo, un grupo 1-etil-3-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-propil-3-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-butil-3-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-pentil-3-pirazolilmetilo, un grupo 1-metil-4-pirazolilmetilo, un grupo 5-metil-3-pirazolilmetilo, un grupo 1-etil-4-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-propil-4-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-butil-4-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-hexil-4-pirazolilmetilo, un grupo 3-metil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3-etil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3-n-propil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3-n-butil-1-pirazolilmetilo, un grupo 1,5-dimetil-3-pirazolilmetilo, un grupo 3,5-dimetil-4-pirazolilmetilo, un grupo 3,4-dimetil-1-pirazolilmetilo, un grupo 1,3-dimetil-5-pirazolilmetilo, un grupo 3,4-dietil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3,4-di-n-propil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3,4-di-n-butil-1-pirazolilmetilo, un grupo 1,3,5-trimetil-4-pirazolilmetilo, un grupo 3,4,5-trimetil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3,4,5-trietil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3,4,5-tri-n-propil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3,4,5-tri-n-butil-1-pirazolilmetilo, un grupo 1-metil-5-pirazolilmetilo, un grupo 1-etil-5-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-propil-5-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-butil-5-pirazolilmetilo, un grupo 2-(3-pirazolil)etilo, un grupo 3-(3-pirazolil)propilo, un grupo 4-(3-pirazolil)butilo, un grupo 5-(3-pirazolil)pentilo, un grupo 6-(3-pirazolil)hexilo, un grupo 2-(1-(4-clorofenil)-3-pirazolil)etilo, un grupo 3-(1-metil-3-pirazolil)propilo, un grupo 3-(3-metil-4-pirazolil)propilo, un grupo 3-(5-metil-4-pirazolil)propilo, un grupo 3-(1,5-dimetil-3-pirazolil)propilo, un grupo 3-(1-etil-3-pirazolil)propilo, un grupo 3-(1-n-propil-3-pirazolil)propilo, un grupo 3-(1-n-butil-3-pirazolil)propilo, un grupo 4-(1-metil-3-pirazolil)butilo, un grupo 4-(1-etil-3-pirazolil)butilo, un grupo 4-(1-n-propil-3-pirazolil)butilo, un grupo 4-(1-n-butil-3-pirazolil)butilo, un grupo 5-(1-metil-3-pirazolil)pentilo, un grupo 5-(1-etil-3-pirazolil)pentilo, un grupo 5-(1-n-propil-3-pirazolil)pentilo, un grupo 5-(1-n-butil-3-pirazolil)pentilo, un grupo 6-(1-metil-3-pirazolil)hexilo, un grupo 6-(1-etil-3-pirazolil)hexilo, un grupo 6-(1-n-propil-3-pirazolil)hexilo, y un grupo 6-[1-(3-butil)-3-pirazolil]hexilo.

Los ejemplos del grupo imidazolilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos imidazolilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo [(1-, 2-, 4- o 5-)imidazolil]metilo, un grupo 2-[(1-, 2-, 4- o 5-)imidazolil]etilo, un grupo 1-[(1-, 2-, 4- o 5-)imidazolil]etilo, un grupo 3-[(1-, 2-, 4- o 5-)imidazolil]propilo, un grupo 4-[(1-, 2-, 4- o 5-)imidazolil]butilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(1-, 2-, 4- o 5-)imidazolil]etilo, un grupo 5-[(1-, 2-, 4- o 5-)imidazolil]pentilo, un grupo 6-[(1-, 2-, 4- o 5-)imidazolil]hexilo, un grupo 1-[(1-, 2-, 4- o 5-)imidazolil]isopropilo, y un grupo 2-metil-3-[(1-, 2-, 4- o 5-)imidazolil]propilo.

Los ejemplos del grupo piridilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos piridilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 3- o 4-)piridilmetilo, un grupo 2-[(2-, 3- o 4-)piridil]metilo, un grupo 1-[(2-, 3- o 4-)piridil]etilo, un grupo 3-[(2-, 3- o 4-)piridil]propilo, un grupo 4-[(2-, 3- o 4-)piridil]butilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(2-, 3- o 4-)piridil]etilo, un grupo 5-[(2-, 3- o 4-)piridil]pentilo, un grupo 6-[(2-, 3- o 4-)piridil]hexilo, un grupo 1-[(2-, 3- o 4-)piridil]isopropilo, un grupo 2-metil-3-[(2-, 3- o 4-)piridil]propilo.

Los ejemplos del grupo pirazinilalquilo inferior (un grupo alquilo inferior puede estar presente como sustituyente en el grupo pirazinilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos pirazinilo en los cuales pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-pirazinilmetilo, un grupo 2-(2-pirazinil)etilo, un grupo 1-(2-pirazinil)etilo, un grupo 3-(2-pirazinil)propilo, un grupo 4-(2-pirazinil)butilo, un grupo 5-(2-pirazinil)pentilo, un grupo 6-(2-pirazinil)hexilo, un grupo 3-metil-3-(2-pirazinil)propilo, un grupo 1,1-dimetil-2-(2-pirazinil)etilo, un grupo 3-metil-2-pirazinilmetilo, un grupo 3-etil-2-pirazinilmetilo, un grupo 3-n-propil-2-pirazinilmetilo, un grupo 3-n-butil-2-pirazinilmetilo, un grupo 3-n-pentil-2-pirazinilmetilo, un grupo 5-metil-2-pirazinilmetilo, un grupo 5-etil-2-pirazinilmetilo, un grupo 5-n-propil-2-pirazinilmetilo, un grupo 5-n-butil-2-pirazinilmetilo, un grupo 6-metil-2-pirazinilmetilo, un grupo 6-etil-2-pirazinilmetilo, un grupo 6-n-propil-2-pirazinilmetilo, un grupo 6-n-butil-2-pirazinilmetilo, un grupo 3,5-dimetil-2-pirazinilmetilo, un grupo 3,5-dietil-2-pirazinilmetilo, un grupo 3,5-di-n-propil-2-pirazinilmetilo, un grupo 3,5-di-n-butil-2-pirazinilmetilo, un grupo 2-(5-metil-2-pirazinil)etilo, un grupo 2-(5-etil-2-pirazinil)etilo, un grupo 2-(5-n-propil-2-pirazinil)etilo, un grupo 2-(5-n-butil-2-pirazinil)etilo, un grupo 3-(5-metil-2-pirazinil)propilo, un grupo 3-(5-etil-2-pirazinil)propilo, un grupo 3-(5-n-propil-2-pirazinil)propilo, un grupo 3-(5-n-butil-2-pirazinil)propilo, un grupo 4-(5-metil-2-pirazinil)butilo, un grupo 4-(5-etil-2-pirazinil)butilo, un grupo 4-(5-n-propil-2-pirazinil)butilo, un grupo 4-(5-n-butil-2-pirazinil)butilo, un grupo 5-(5-metil-2-pirazinil)pentilo, un grupo 5-(5-etil-2-pirazinil)pentilo, un grupo 5-(5-n-propil-2-pirazinil)pentilo, un grupo 5-(5-n-butil-2-pirazinil)pentilo, un grupo 6-(5-metil-2-pirazinil)hexilo, un grupo 6-(5-etil-2-pirazinil)hexilo, un grupo 6-(5-n-propil-2-pirazinil)hexilo, y un grupo 6-(5-n-butil-2-pirazinil)hexilo.

Los ejemplos del grupo pirrolidinilalquilo inferior (un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior puede estar presente como sustituyente en el grupo pirrolidinilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos pirrolidinilo, en los cuales pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de

carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo [(1-, 2-, o 3-)pirrolidinil]metilo, un grupo 2-[(1-, 2-, o 3-)pirrolidinil]etilo, un grupo 1-[(1-, 2-, o 3-)pirrolidinil]etilo, un grupo 3-[(1-, 2-, o 3-)pirrolidinil]propilo, un grupo 4-[(1-, 2-, o 3-)pirrolidinil]butilo, un grupo 5-[(1-, 2-, o 3-)pirrolidinil]pentilo, un grupo 6-[(1-, 2-, o 3-)pirrolidinil]hexilo, un grupo 1-metil-2-[(1-, 2-, o 3-)pirrolidinil]etilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(1-, 2-, o 3-)pirrolidinil]etilo, un grupo 2-metil-3-[(1-, 2-, o 3-)pirrolidinil]propilo, un grupo 1-metil-(2- o 3-)pirrolidinilmetilo, un grupo 1-etil-(2- o 3-)pirrolidinilmetilo, un grupo 1-n-propil-(2- o 3-)pirrolidinilmetilo, un grupo 1-n-butil-(2- o 3-)pirrolidinilmetilo, un grupo 1-n-pentil-(2- o 3-)pirrolidinilmetilo, un grupo 1-n-hexil-(2- o 3-)pirrolidinilmetilo, un grupo 2-metil-1-pirrolidinilmetilo, un grupo 2-etil-1-pirrolidinilmetilo, un grupo 2-n-propil-1-pirrolidinilmetilo, un grupo 2-n-butil-1-pirrolidinilmetilo, un grupo 2-n-pentil-1-pirrolidinilmetilo, un grupo 2-n-hexil-1-pirrolidinilmetilo, un grupo 3-metil-2-pirrolidinilmetilo, un grupo 3-etil-2-pirrolidinilmetilo, un grupo 3-n-propil-2-pirrolidinilmetilo, un grupo 3-n-butil-2-pirrolidinilmetilo, un grupo 1,5-dimetil-(2- o 3-)pirrolidinilmetilo, un grupo 1,5-di-etil-(2- o 3-)pirrolidinilmetilo, un grupo 1,5-di-n-propil-(2- o 3-)pirrolidinilmetilo, un grupo 1,5-di-n-butil-(2- o 3-)pirrolidinilmetilo, un grupo 1,4,5-trietil-(2- o 3-)pirrolidinilmetilo, un grupo 1,4,5-tri-n-propil-(2- o 3-)pirrolidinilmetilo, un grupo 1,4,5-tri-n-butil-(2- o 3-)pirrolidinilmetilo, un grupo 3-[2-oxo-(1-pirrolidinil)propilo], un grupo 3-(5-oxo-(2-, 3-, o 4-)pirrolidinil]propilo, y un grupo 3-[1-metil-5-oxo-(2-, 3-, o 4-)pirrolidinil]propilo.

Los ejemplos del grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener como sustituyente en el grupo piperidilo, un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanilo inferior) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos piperidilo que tienen de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos, como sustituyente o sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo o los grupos piperidilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)piperidilmetilo, un grupo 2-[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidil]etilo, un grupo 2-[1-benzoil-(2-, 3-, o 4-)piperidil]etilo, un grupo 2-[1-acetil-(2-, 3-, o 4-)piperidil]etilo, un grupo 2-[1-butiril-(2-, 3-, o 4-)piperidil]etilo, un grupo 1-[(1-, 2-, 3-, o 9-)piperidil]etilo, un grupo 3-[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidil]propilo, un grupo 4-[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidil]butilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidil]etilo, un grupo 5-[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidil]pentilo, un grupo 6-[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidil]hexilo, un grupo 1-[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidil]isopropilo, y un grupo 2-metil-3-[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidil]propilo.

Los ejemplos del grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente en el grupo piperazinilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) piperazinilo grupos, en los cuales pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1-piperazinilmetilo, un grupo 2-piperazinilmetilo, un grupo 2-(1-piperazinil)etilo, un grupo 2-(2-piperazinil)etilo, un grupo 1-(1-piperazinil)etilo, un grupo 1-(2-piperazinil)etilo, un grupo 3-(1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(2-piperazinil)propilo, un grupo 4-(1-piperazinil)butilo, un grupo 4-(2-piperazinil)butilo, un grupo 2-(4-etil-2-piperazinil)etilo, un grupo 1-(4-n-propil-2-piperazinil)etilo, un grupo 2-(4-n-butil-2-piperazinil)etilo, un grupo 2-(4-n-pentil-2-piperazinil)etilo, un grupo 1-(4-n-hexil-2-piperazinil)etilo, un grupo 2-(5-metil-2-piperazinil)etilo, un grupo 1-(5-etil-2-piperazinil)etilo, un grupo 2-(5-n-propil-2-piperazinil)etilo, un grupo 1-(5-n-butil-2-piperazinil)etilo, un grupo 2-(5-n-pentil-2-piperazinil)etilo, un grupo 1-(5-n-hexil-2-piperazinil)etilo, un grupo 2-(6-metil-2-piperazinil)etilo, un grupo 1-(6-etil-2-piperazinil)etilo, un grupo 2-(6-n-propil-2-piperazinil)etilo, un grupo 1-(6-n-butil-2-piperazinil)etilo, un grupo 2-(6-n-pentil-2-piperazinil)etilo, un grupo 2-(6-n-hexil-2-piperazinil)etilo, un grupo 3-(2-metil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(2-etil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(2-n-propil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(2-n-butil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(2-n-pentil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(2-n-hexil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(3-metil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(3-etil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(3-n-propil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(3-n-butil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(3-n-pentil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(3-n-hexil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(4-metil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(4-etil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(4-n-propil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(4-n-butil-1-piperazinil)propilo, un grupo 3-(4-n-pentil-1-piperazinil)propilo, un grupo 6-(5-n-butil-2-piperazinil)hexilo, un grupo 6-(5-n-pentil-2-piperazinil)hexilo, un grupo 6-(5-n-hexil-2-piperazinil)hexilo, un grupo 6-(6-metil-2-piperazinil)hexilo, un grupo 6-(6-etil-2-piperazinil)hexilo, un grupo 6-(6-n-propil-2-piperazinil)hexilo, un grupo 6-(6-n-butil-2-piperazinil)hexilo, un grupo 6-(6-n-pentil-2-piperazinil)hexilo, un grupo 6-(6-n-hexil-2-piperazinil)hexilo, un grupo 2,3-dimetil-1-piperazinilmetilo, un grupo 3,3-dimetil-1-piperazinilmetilo, y un grupo 2-(1,3,4-trimetil-2-piperazinil)etilo.

Los ejemplos del grupo morfolinilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos morfolinilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-morfolinilmetilo, un grupo 3-morfolinilmetilo, un grupo 4-morfolinilmetilo, un grupo 2-(2-morfolinil)etilo, un grupo 2-(3-morfolinil)etilo, un grupo 2-(4-morfolinil)etilo, un grupo 1-(2-morfolinil)etilo, un grupo 1-(3-morfolinil)etilo, un grupo 1-(4-morfolinil)etilo, un grupo 3-(2-morfolinil)propilo, un grupo 3-(3-morfolinil)propilo, un grupo 3-(4-morfolinil)propilo, un grupo 4-(2-morfolinil)butilo, un grupo 4-(3-morfolinil)butilo, un grupo 4-(4-morfolinil)butilo, un grupo 5-(2-morfolinil)pentilo, un grupo 5-(3-morfolinil)pentilo, un grupo 5-(4-morfolinil)pentilo, un grupo 6-(2-morfolinil)hexilo, un grupo 6-(3-morfolinil)hexilo, un grupo 6-(4-

morfolinil)hexilo, un grupo 3-metil-3-(2-morfolinil)propilo, un grupo 3-metil-3-(3-morfolinil)propilo, un grupo 3-metil-3-(4-morfolinil)propilo, un grupo 1,1-dimetil-2-(2-morfolinil)etilo, un grupo 1,1-dimetil-2-(3-morfolinil)etilo, y un grupo 1,1-dimetil-2-(4-morfolinil)etilo.

- 5 Los ejemplos del grupo tienilalquilo inferior (que puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente en el grupo tienilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos tienilo, en los cuales pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un
- 10 grupo (2- o 3-)tienilmetilo, un grupo 2-[(2- o 3-)tienil]etilo, un grupo 1-[(2- o 3-)tienil]etilo, un grupo 3-[(2- o 3-)tienil]propilo, un grupo 4-[(2- o 3-)tienil]butilo, un grupo 5-[(2- o 3-)tienil]pentilo, un grupo 6-[(2- o 3-)tienil]hexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(2- o 3-)tienil]etilo, un grupo 2-metil-3-[(2- o 3-)tienil]propilo, un grupo 3-metil-(2-, 4-, o 5-)tienilmetilo, un grupo [5-metil-(2, 3- o 4-)tienil]metilo, un grupo [4-etil-(2- o 3-)tienil]metilo, un grupo [5-n-propil-(2, 3- o 4-)tienil]metilo, un grupo [3-n-butil-(2-, 4-, o 5-)tienil]]metilo, un grupo [4,5-dimetil-(2- o 3-)tienil]metilo, un grupo (3,4,5-trimetil-2-tienil)metilo, un grupo 2-[3-metil-(2-, 4-, o 5-)tienil]etilo, un grupo 1-[4-n-pentil-(2- o 3-)tienil]etilo, un grupo 3-[3-hexil-2-tienil]propilo, un grupo 4-[4,5-dimetil-(2- o 3-)tienil]butilo, un grupo 5-(2,4,5-trimetil-3-tienil)pentilo, y un grupo 6-[5-etil-(2-, 3-, o 4-)tienil]hexilo.

- 20 Los ejemplos del grupo tiazolilo incluyen un grupo (2-, 4- o 5-)tiazolilo.

Los ejemplos del grupo tiazolilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos tiazolilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 4-, o 5-)tiazolilmetilo, un grupo 2-[(2-, 4-, o 5-)tiazolil]etilo,

25 un grupo 1-[(2-, 4-, o 5-)tiazolil]etilo, un grupo 3-[(2-, 4-, o 5-)tiazolil]propilo, un grupo 4-[(2-, 4-, o 5-)tiazolil]butilo, un grupo 5-[(2-, 4-, o 5-)tiazolil]pentilo, un grupo 6-[(2-, 4-, o 5-)tiazolil]hexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(2-, 4-, o 5-)tiazolil]etilo, y un grupo [2-metil-3-[(2-, 4-, o 5-)tiazolil]propilo.

- 30 Los ejemplos del grupo dihidrobenzofurilo incluyen un grupo 2,3-dihidro-(2-, 3-, 4-, 5-, 6- o 7-)benzofurilo.

Los ejemplos del grupo dihidrobenzofurilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos dihidrobenzofurilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2,3-dihidro-4-benzofurilmetilo, un grupo 2-(2,3-dihidro-4-benzofuril)etilo, un grupo 3-(2,3-dihidro-4-benzofuril)propilo, un grupo 4-(2,3-dihidro-4-benzofuril)butilo,

35 un grupo 5-(2,3-dihidro-4-benzofuril)pentilo, un grupo 6-(2,3-dihidro-4-benzofuril)hexilo, un grupo 2,3-dihidro-5-benzofurilmetilo, un grupo 2-(2,3-dihidro-5-benzofuril)etilo, un grupo 3-(2,3-dihidro-5-benzofuril)propilo, un grupo 4-(2,3-dihidro-5-benzofuril)butilo, un grupo 2,3-dihidro-6-benzofurilmetilo, un grupo 2-(2,3-dihidro-6-benzofuril)etilo, un grupo 3-(2,3-dihidro-6-benzofuril)propilo, un grupo 4-(2,3-dihidro-6-benzofuril)butilo, un grupo 5-(2,3-dihidro-6-benzofuril)pentilo, un grupo 2,3-dihidro-7-benzofurilmetilo, un grupo 2,3-dihidro-7-benzofurilmetilo, un grupo 3-(2,3-dihidro-7-benzofuril)propilo, un grupo 4-(2,3-dihidro-7-benzofuril)butilo, y un grupo 6-(2,3-dihidro-7-benzofuril)hexilo.

Los ejemplos del grupo benzopiranilalquilo inferior (que puede tener un grupo oxo como sustituyente en el grupo benzopiranilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos benzopiranilo en el que puede estar presente como sustituyente un grupo oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (4H-1-benzopiran-2-il)metilo, un grupo 2-(4H-1-benzopiran-2-il)etilo, un grupo 3-(4H-1-benzopiran-2-il)propilo, un grupo 4-(4H-1-benzopiran-2-il)butilo, un grupo 5-(4H-1-benzopiran-2-il)pentilo, un grupo 6-(4H-1-benzopiran-2-il)hexilo, un grupo (4H-1-benzopiran-3-il)metilo, un grupo 2-(4H-1-benzopiran-3-il)etilo, un grupo 3-(4H-1-benzopiran-3-il)propilo, un grupo 4-(4H-1-benzopiran-3-il)butilo, un grupo 5-(4H-1-benzopiran-3-il)pentilo, un grupo 6-(4H-1-benzopiran-3-il)hexilo, un grupo (4H-1-benzopiran-4-il)metilo, un grupo 2-(4H-1-benzopiran-4-il)etilo, un grupo 3-(4H-1-benzopiran-4-il)propilo, un grupo 4-(4H-1-benzopiran-4-il)butilo, un grupo 5-(4H-1-benzopiran-4-il)pentilo, un grupo 6-(4H-1-benzopiran-4-il)hexilo, un grupo (2H-1-benzopiran-2-il)metilo, un grupo 2-(2H-1-benzopiran-2-il)etilo, un grupo 3-(2H-1-benzopiran-2-il)propilo, un grupo 4-(2H-1-benzopiran-2-il)butilo, un grupo 5-(2H-1-benzopiran-2-il)pentilo, un grupo 6-(2H-1-benzopiran-2-il)hexilo, un grupo (2H-1-benzopiran-3-il)metilo, un grupo 2-(2H-1-benzopiran-3-il)etilo, un grupo 3-(2H-1-benzopiran-3-il)propilo, un grupo 4-(2H-1-benzopiran-3-il)butilo, un grupo 5-(2H-1-benzopiran-3-il)pentilo, un grupo 6-(2H-1-benzopiran-3-il)hexilo, un grupo (2H-1-benzopiran-4-il)metilo, un grupo 2-(2H-1-benzopiran-4-il)etilo, un grupo 3-(2H-1-benzopiran-4-il)propilo, un grupo 4-(2H-1-benzopiran-4-il)butilo, un grupo 5-(2H-1-benzopiran-4-il)pentilo, un grupo 6-(2H-1-benzopiran-4-il)hexilo, un grupo (1H-2-benzopiran-1-il)metilo, un grupo 2-(1H-2-benzopiran-1-il)etilo, un grupo 3-(1H-2-benzopiran-1-il)propilo, un grupo 4-(1H-2-benzopiran-1-il)butilo, un grupo 5-(1H-2-benzopiran-1-il)pentilo, un grupo 6-(1H-2-benzopiran-1-il)hexilo, un grupo (1H-2-benzopiran-3-il)metilo, un grupo 2-(1H-2-benzopiran-3-il)etilo, un grupo 3-(1H-2-benzopiran-3-il)propilo, un grupo 4-(1H-2-benzopiran-3-il)butilo, un grupo 5-(1H-2-benzopiran-3-il)pentilo, un grupo 6-(1H-2-benzopiran-3-il)hexilo, un grupo (1H-2-benzopiran-3-il)metilo, un grupo 2-(1H-2-benzopiran-4-il)etilo, un grupo 3-(1H-2-benzopiran-4-il)propilo, un grupo 4-(1H-2-benzopiran-4-il)butilo, un grupo 5-(1H-2-benzopiran-4-il)pentilo, un grupo 6-(1H-2-benzopiran-4-il)hexilo, un grupo (4-

oxo-4H-1-benzopiran-2-il)metilo, un grupo 2-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)etilo, un grupo 3-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)propilo, un grupo 4-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)butilo, un grupo 5-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)pentilo, un grupo 6-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)hexilo, un grupo (9-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)metilo, un grupo 2-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)etilo, un grupo 3-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)propilo, un grupo 4-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)butilo, un grupo 5-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)pentilo, un grupo 6-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)hexilo, un grupo (4-oxo-4H-1-benzopiran-4-il)metilo, un grupo (2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)metilo, un grupo 2-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)etilo, un grupo 3-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)propilo, un grupo 4-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)butilo, un grupo 5-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)pentilo, un grupo 6-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)hexilo, un grupo (2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)metilo, un grupo 2-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)etilo, un grupo 3-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)propilo, un grupo 4-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)butilo, un grupo 5-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)pentilo, un grupo 6-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)hexilo, un grupo (1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)metilo, un grupo 2-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)etilo, un grupo 3-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)propilo, un grupo 4-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)butilo, un grupo 5-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)pentilo, un grupo 6-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)hexilo, un grupo (1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)metilo, un grupo 2-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)etilo, un grupo 3-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)propilo, un grupo 4-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)butilo, un grupo 5-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)pentilo, y un grupo 6-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)hexilo.

Los ejemplos del grupo benzimidazolilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos benzimidazolilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1-benzimidazolilmetilo; 2-(1-benzimidazolil)etilo, un grupo 3-(1-benzimidazolil)propilo, un grupo 4-(1-benzimidazolil)butilo, un grupo 5-(1-benzimidazolil)pentilo, un grupo 6-(1-benzimidazolil)hexilo, un grupo 2-benzimidazolilmetilo, un grupo 2-(2-benzimidazolil)etilo, un grupo 3-(2-benzimidazolil)propilo, un grupo 4-(2-benzimidazolil)butilo, un grupo 5-(2-benzimidazolil)pentilo, y un grupo 6-(2-benzimidazolil)hexilo.

Los ejemplos del grupo indolilalquilo inferior que puede tener un grupo alcoxi(inferior)carbonilo en el grupo alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) como se ha ilustrado antes que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes que pueden tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos indolilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, o -7-)ilmetilo, un grupo 2-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, o -7-)iletilo, un grupo 3-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, o -7-)ilpropilo, un grupo 4-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, o -7-)ilbutilo, un grupo 5-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, o -7-)ilpentilo, un grupo 6-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, o -7-)ilhexilo, un grupo 3-metil-3-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, o -7-)ilpropilo, un grupo 1,1-dimetil-2-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, o -7-)iletilo, y un grupo 1-metoxycarbonil-2-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, o -7-)iletilo.

Los ejemplos del grupo imidazolilalquilo inferior que tiene un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo en el grupo alquilo inferior incluyen un grupo imidazolilalquilo inferior que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1, sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes en el grupo alquilo cuyo radical alquilo inferior es el mismo que se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo carbamoil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo metoxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo etoxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo n-butoxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo isobutoxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo terc-butoxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo sec-butoxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo n-pentiloxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo neopentiloxi-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo n-hexiloxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo isohexiloxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo 3-metilpentiloxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo 1-carbamoil-2-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]etilo, un grupo 1-metoxycarbonil-2-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]etilo, un grupo 1,1-dimetoxycarbonil-2-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]etilo, un grupo 1,1-dicarbamoil-2-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]etilo, un grupo 2-carbamoil-1-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]propilo, un grupo 2-metoxycarbonil-3-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]propilo, un grupo 2-carbamoil-4-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]butilo, un grupo 1-metil-1-carbamoilmetil-2-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]etilo, un grupo 2-metoxycarbonil-5-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]pentilo, un grupo 3-carbamoil-6-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]hexilo, un grupo 2-metoxycarbonil-1-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]isopropilo, y un grupo 2-carbamoilmetil-3-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]propilo.

Los ejemplos del grupo piridilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, y un grupo alquil(inferior)tioalquilo inferior, como sustituyente incluyen un grupo piridilo que puede tener de 1 a 4 (preferiblemente 1) grupos, como sustituyente o sustituyentes, que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), y un grupo alquil(inferior)tioalquilo inferior en el que cada uno de los dos radicales alquilo inferior están compuestos de un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 4-metil-2-piridilo, un grupo 5-metil-2-piridilo, un grupo 5-etil-3-

piridilo, un grupo 2-n-propil-3-piridilo, un grupo 4-n-butil-2-piridilo, un grupo 4-terc-butil-2-piridilo, un grupo 5-n-pentil-3-piridilo, un grupo 4-n-hexil-2-piridilo, un grupo 4-metoxi-2-piridilo, un grupo 5-metoxi-2-piridilo, un grupo 2-metiltiometil-3-piridilo, un grupo 5-etiltiometil-2-piridilo, un grupo 4-n-propiltiometil-2-piridilo, un grupo 3-n-butiltiometil-2-piridilo, un grupo 5-n-pentiltiometil-3-piridilo, un grupo 4-n-hexiltiometil-3-piridilo, un grupo 2-(2-metiltioetil)-3-piridilo, un grupo 2-(3-metiltiopropil)-4-piridilo, un grupo 3-(4-metiltiobutil)-4-piridilo, un grupo 3-(5-metiltiopentil)-2-piridilo, un grupo 4-(6-metiltiohexil)-2-piridilo, un grupo 3,4-dimetil-2-piridilo, un grupo 2,4,6-trietil-3-piridilo, un grupo 2,3,5,6-tetrametil-4-piridilo, y un grupo 2-metil-3-metiltiometil-4-piridilo.

Los ejemplos del grupo pirrolidinilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior, y un grupo aroilo como sustituyente incluyen un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 3, preferiblemente 1 grupo, como sustituyente o sustituyentes, que se selecciona del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes un grupo alcanilo inferior como se ha descrito antes (un grupo alcanilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), y un grupo aroilo (preferiblemente un grupo benzoilo). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo pirrolidin-1-ilo, un grupo pirrolidin-2-ilo, un grupo pirrolidin-3-ilo, un grupo 1-metilpirrolidin-3-ilo, un grupo 2-etilpirrolidin-3-ilo, un grupo 3-n-propilpirrolidin-3-ilo, un grupo 4-n-butilpirrolidin-3-ilo, un grupo 1-terc-butilpirrolidin-3-ilo, un grupo 5-n-pentilpirrolidin-3-ilo, un grupo 1-n-hexilpirrolidin-2-ilo, un grupo 2-metoxycarbonil-2-ilo, un grupo 3-etoxycarbonilpirrolidin-2-ilo, un grupo 1-terc-butoxycarbonilpirrolidin-3-ilo, un grupo 4-propoxycarbonilpirrolidin-2-ilo, un grupo 5-butoxycarbonilpirrolidin-2-ilo, un grupo 1-pentoxycarbonil-2-ilo, un grupo 2-hexiloxycarbonilpirrolidin-2-ilo, un grupo 1,3-dimetoxycarbonilpirrolidin-2-ilo, un grupo 3,4,5-trietilpirrolidin-2-ilo, un grupo 2,3,4,5-tetrametilpirrolidin-1-ilo, un grupo 2,4-dimetoxycarbonilpirrolidin-1-ilo, un grupo 3,4,5-trietoxycarbonilpirrolidin-1-ilo, un grupo 2-metil-4-metoxycarbonilpirrolidin-1-ilo, un grupo 1-benzoilpirrolidin-3-ilo, un grupo 1-acetilpirrolidin-3-ilo, y un grupo 1-butilpirrolidin-3-ilo.

Los ejemplos del grupo piperidilo que puede tener un grupo como sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior, y un grupo aroilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un átomo de halógeno incluyen un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 5 (preferiblemente de 1 a 4) grupos, como sustituyente o sustituyentes, que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcanilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); y un grupo aroilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes y un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo benzoilo). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1-piperidilo, un grupo 2-piperidilo, un grupo 3-piperidilo, un grupo 4-piperidilo, un grupo 1-metil-4-piperidilo, un grupo 2-etil-4-piperidilo, un grupo 3-n-propil-4-piperidilo, un grupo 4-n-butil-4-piperidilo, un grupo 1-n-pentil-4-piperidilo, un grupo 2-n-hexil-4-piperidilo, un grupo 1-metoxycarbonil-4-piperidilo, un grupo 1-etoxycarbonil-4-piperidilo, un grupo 4-n-propoxycarbonil-4-piperidilo, un grupo 5-n-butoxycarbonil-4-piperidilo, un grupo 1-terc-butoxycarbonil-4-piperidilo, un grupo 1-formil-4-piperidilo, un grupo 1-acetil-4-piperidilo, un grupo 1-butil-4-piperidilo, un grupo 1-butil-3-piperidilo, un grupo 2-propionil-4-piperidilo, un grupo 3-butil-4-piperidilo, un grupo 4-isobutil-4-piperidilo, un grupo 1-n-pentanoil-4-piperidilo, un grupo 2-terc-butilcarbonil-4-piperidilo, un grupo 3-n-hexanoil-4-piperidilo, un grupo 1-benzoil-4-piperidilo, un grupo 1-benzoil-3-piperidilo, un grupo 1-(2-, 3-, o 4-clorobenzoil)-4-piperidilo, un grupo 1-(2-, 3-, o 4-fluorobenzoil)-4-piperidilo, un grupo 1-(2-, 3-, o 4-metilbenzoil)-4-piperidilo, un grupo 2,6-dimetil-4-piperidilo, un grupo 2,4,6-trimetil-3-piperidilo, un grupo 2,2,6,6-tetrametil-4-piperidilo, y un grupo 2,2,4,4,6-pentametil-3-piperidilo.

Los ejemplos del grupo tetrahydrofurilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo 2-tetrahydrofurilo, un grupo 3-tetrahydrofurilo, un grupo 3-oxo-2-tetrahydrofurilo, un grupo 4-oxo-2-tetrahydrofurilo, un grupo 5-oxo-2-tetrahydrofurilo, un grupo 2-oxo-3-tetrahydrofurilo, un grupo 4-oxo-3-tetrahydrofurilo, y un grupo 5-oxo-4-tetrahydrofurilo.

Los ejemplos del grupo hexahidroazepinilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo 2-hexahidroazepinilo, un grupo 3-hexahidroazepinilo, un grupo 4-hexahidroazepinilo, un grupo 2-oxo-3-hexahidroazepinilo, un grupo 3-oxo-2-hexahidroazepinilo, un grupo 4-oxo-2-hexahidroazepinilo, un grupo 5-oxo-2-hexahidroazepinilo, y un grupo 6-oxo-2-hexahidroazepinilo.

Los ejemplos del grupo pirazolilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo aroilo, y un grupo furilo como sustituyente incluyen un grupo pirazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos, como sustituyente o sustituyentes, que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos

de carbono);

un grupo arilo como se ha ilustrado antes y un grupo furilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1-pirazolilo, un grupo 3-pirazolilo, un grupo 4-pirazolilo, un grupo 1-metil-5-pirazolilo, un grupo 1-etil-5-pirazolilo, un grupo 3-n-propil-5-pirazolilo, un grupo 4-n-butil-5-pirazolilo, un grupo 1-terc-butil-4-pirazolilo, un grupo 1-n-pentil-4-pirazolilo, un grupo 3-n-hexil-4-pirazolilo, un grupo 3-fenil-5-pirazolilo, un grupo 1-(2-naftil)-3-pirazolilo, un grupo 4-(2-metilfenil)-3-pirazolilo, un grupo 5-(3-etilfenil)-3-pirazolilo, un grupo 1-(4-n-propilfenil)-4-pirazolilo, un grupo 3-(2-n-butilfenil)-4-pirazolilo, un grupo 5-(3-n-pentilfenil)-4-pirazolilo, un grupo 1-(4-n-hexilfenil)-5-pirazolilo, un grupo 3-(2-isobutilfenil)-5-pirazolilo, un grupo 4-(3-terc-butilfenil)-5-pirazolilo, un grupo 3-(2-clorofenil)-1-pirazolilo, un grupo 4-(3-fluorofenil)-1-pirazolilo, un grupo 5-(4-bromofenil)-1-pirazolilo, un grupo 1-(2-aminofenil)-3-pirazolilo, un grupo 4-(2,3-dimetilfenil)-3-pirazolilo, un grupo 5-(3,4,5-trimetilfenil)-3-pirazolilo, un grupo 1-(2,3-diaminofenil)-4-pirazolilo, un grupo 3-(2-furil)-5-pirazolilo, un grupo 1,3-dimetil-5-pirazolilo, un grupo 1,3,4-trietil-5-pirazolilo, un grupo 1,3,5-trimetil-4-pirazolilo, y un grupo 1-metil-3-fenil-5-pirazolilo.

Los ejemplos del grupo tiadiazolilo incluyen un grupo 1,2,3-tiadiazolilo, un grupo 1,2,4-tiadiazolilo, un grupo 1,2,5-tiadiazolilo o un grupo 1,3,4-tiadiazolilo.

Los ejemplos del grupo tiadiazolilo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo tiadiazolilo como se ha ilustrado antes que puede tener de 1 a 3, preferiblemente 1, grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 4- o 5-(1, 2, 3-tiadiazolil), un grupo 3- o 5-(1, 2, 4-tiadiazolil), un grupo 3-(1, 2, 5-tiadiazolil), un grupo 2-(1, 3, 4-tiadiazolil), un grupo 5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo, un grupo 4-etil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo, un grupo 5-n-propil-1,2,4-tiadiazol-3-ilo, un grupo 5-n-butil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo, un grupo 4-terc-butil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo, un grupo 5-n-pentil-1,2,4-tiadiazol-3-ilo, y un grupo 5-n-hexil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo.

Los ejemplos del grupo isoxazolilo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo isoxazolilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 3-isoxazolilo, un grupo 4-isoxazolilo, un grupo 5-isoxazolilo, un grupo 3-metil-5-isoxazolilo, un grupo 4-etil-5-isoxazolilo, un grupo 4-n-propil-3-isoxazolilo, un grupo 5-metil-3-isoxazolilo, un grupo 5-n-butil-3-isoxazolilo, un grupo 3-terc-butil-4-isoxazolilo, un grupo 5-n-pentil-4-isoxazolilo, un grupo 3-n-hexil-5-isoxazolilo, y un grupo 3,4-dimetil-5-isoxazolilo.

Los ejemplos del grupo indazolilo incluyen un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6- o 7-)indazolilo.

Los ejemplos del grupo tetrahidrobenzotiazolilo incluyen un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, o 7-) (4,5,6,7-tetrahidrobenzotiazolilo).

Los ejemplos del grupo tetrahidroquinolilo incluyen un grupo (1-, 2-, 4-, 5-, 6- o -8) (1, 2, 3, 4-tetrahidroquinolilo).

Los ejemplos del grupo tetrahidroquinolilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno y un grupo oxo como sustituyente incluyen un grupo tetrahidroquinolilo como se ha ilustrado antes que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos, como sustituyente o sustituyentes, que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un átomo de halógeno; y

un grupo oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 2-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 3-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 4-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 5-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 6-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 7-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 8-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 2-metil-3-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 3-etil-2-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 4-n-propil-2-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 5-n-butil-3-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 6-terc-butil-3-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 7-n-pentil-2-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 8-n-hexil-2-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 2-metoxi-4-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 3-etoxi-4-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 4-propoxi-5-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 5-butoxi-6-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 6-pentoxi-7-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 7-hexiloxi-8-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 4-oxo-3-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 2-oxo-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 2-oxo-8-metil-(3-, 4-, 5-, 6-, o 7-)-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 2-oxo-8-metoxi-3-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 2-oxo-5-metoxi-(1-, 3-, 4-, 6-, 7-, u 8-)-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 2-oxo-8-fluoro-(3-, 4-, 5-, 6-, o 7-)-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), y un grupo 2-oxo-6,8-dimetil-3-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo).

Los ejemplos del grupo quinolilo incluyen un grupo 2-quinolilo, un grupo 3-quinolilo, un grupo 4-quinolilo, un grupo 5-quinolilo, un grupo 6-quinolilo, un grupo 7-quinolilo, y un grupo 8-quinolilo. Los ejemplos del quinolilo grupo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo quinolilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior

como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-quinolilo, un grupo 2-metil-6-quinolilo, un grupo 4-etil-5-quinolilo, un grupo 4-n-propil-3-quinolilo, un grupo 5-metil-3-quinolilo, un grupo 5-n-butil-3-quinolilo, un grupo 3-terc-butil-4-quinolilo, un grupo 5-n-pentil-4-quinolilo, un grupo 3-n-hexil-5-quinolilo y un grupo 3,4-dimetil-5-quinolilo.

Los ejemplos del grupo benzodioxolilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos benzodioxolilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-, 4- o 5-(1,3-benzodioxolil)metilo, un grupo 2-(2-, 4- o 5)-(1,3-benzodioxolil)etilo y un grupo 3-(2-, 4- o 5)-(1,3-benzodioxolil)propilo.

Los ejemplos del grupo arilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo inferior; un grupo alcoxi inferior; un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno; un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno; un grupo alqueno inferior; un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquil(inferior)sulfonilo, un grupo alquilo inferior, y un grupo arilo; un grupo sulfamoilo; un grupo alquil(inferior)tio; un grupo alcanilo inferior; un grupo alcoxi(inferior)carbonilo; un grupo pirrolilo; un grupo alquino inferior; un grupo ciano, un grupo nitro; un grupo arilo; un grupo arilalcoxi inferior; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxialquilo inferior; un grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener un grupo oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener un grupo alquilo inferior; un grupo dihidrofurilo que puede tener un grupo oxo; un grupo tiazolidinilalquilo inferior que puede tener un grupo oxo; un grupo imidazolilalcanoilo inferior; y un grupo piperidinilcarbonilo incluyen un grupo arilo como se ha ilustrado antes que puede tener de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente, de 1 a 2 grupos, como sustituyente o sustituyentes, que se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes;

un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con 1 a 7 átomos de halógeno);

un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con 1 a 7 átomos de halógeno);

un grupo alqueno inferior como se ha ilustrado antes (

un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6 átomos de carbono (incluyendo ambas configuraciones trans y cis));

un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos alcanilo inferior como se ha ilustrado antes, grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes, y grupos arilo como se ha ilustrado antes;

un grupo sulfamoilo;

un grupo alquil(inferior)tio cuyo radical alquilo inferior es un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcanilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes; un grupo pirrolilo; un grupo alquino como se ilustra más abajo; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo arilo cuyo radical arilo es como se ha ilustrado antes; un grupo arilo alcoxi inferior cuyo radical arilo y radical alcoxi inferior son como se ha ilustrado antes; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxialquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es como se ha ilustrado antes; un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes y un grupo arilo como se ha ilustrado antes; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes; un grupo dihidrofurilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo; un grupo tiazolidinilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo y que tiene un radical alquilo inferior como se ha ilustrado antes; un grupo imidazolilalcanoilo inferior cuyo radical alcanilo es como se ha ilustrado antes y un grupo piperidinilcarbonilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo fenilo, un grupo 1-naftilo, un grupo 2- un grupo naftilo, (2-, 3-, o 4-)bifenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)clorofenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)fluorofenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bromofenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metilfenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentilfenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)isobutilfenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metoxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etoxi-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propoxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isopropoxi-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butoxifenilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutoxi-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butoxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)sec-butoxi-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentiloxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isopentiloxi-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)neopentiloxifenilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexiloxi-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)isohexiloxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)(3-metilpentiloxi)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)clorometilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)trifluorometilfenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoroetil-1-

naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-bromopropil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(4-clorobutil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(5-fluoropentil)fenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)(6-bromohexil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1,1-dimetil-2-cloroetil)fenilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)(2-metil-3-fluoropropil)-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)clorometoxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)(2-fluoroetoxi)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-bromopropoxi)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(4-clorobutoxi)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(5-fluoropentiloxi)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)trifluorometoxifenilo, un grupo 4-(6-bromohexiloxi)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(1,1-dimetil-2-cloroetoxi)fenilo, un grupo 7-(2-metil-3-fluoropropoxi)-2-naftilo, un grupo 2-vinilfenilo, un grupo 2-(1-metilvinil)fenilo, un grupo 2-(1-propenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1-metil-1-propenil)fenilo, un grupo 3-(2-metil-1-propenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(1-propenil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-propenil)fenilo, un grupo 4-(2-butenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1-butenil)fenilo, un grupo 5-(3-butenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-pentenil) fenilo, un grupo 6-(1-pentenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-pentenil)fenilo, un grupo 7-(9-pentenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1,3-butadienil)fenilo, un grupo 8-(1,3-pentadienil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-penten-4-inil)fenilo, un grupo 1-(2-hexenil)-2-naftilo, un grupo 4-(1-hexenil)fenilo, un grupo a 3-(5-hexenil)-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(3-hexenil), un grupo 4-(4-hexenil)-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3,3-dimetil-1-propenil)fenilo, un grupo 5-(2-etil-1-propenil)-2-naftilo, un grupo 9-(1,3,5-hexatrienil)fenilo, un grupo 6-(1,3-hexadienil)-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1,4-hexadienil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-formilamino)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-acetilamino)fenilo, un grupo 7-(N-acetilamino)-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-propionilamino) fenilo, un grupo 8-(N-butililamino)-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-isobutililamino)fenilo, un grupo 2-(N-pentanoilamino)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-terc-butilcarbonilamino)fenilo, un grupo 3-(N-hexanoilamino)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(N,N-diformilamino)fenilo, un grupo 4-(N,N-diacetilamino)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N,N-dimetilamino)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-fenilamino)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)sulfamoilfenilo, un grupo 5-sulfamoil-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metiltiofenilo, un grupo 6-etiltio-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propiltiofenilo, un grupo 7-isopropiltio-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butiltiofenilo, un grupo 8-terc-butiltio-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentiltiofenilo, un grupo 1-n-hexiltio-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-metil(sulfonilamino)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)formilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)acetilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)butirilfenilo, un grupo 3-acetil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)propionilfenilo, un grupo 4-butilil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)isobutililfenilo, un grupo 5-pentanoil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)cianofenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metoxicarbonilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butilcarbonilfenilo, un grupo 6-hexanoil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etoxicarbonilfenilo, un grupo 7-etoxicarbonil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propoxicarbonilfenilo, un grupo 8-isopropoxicarbonil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butoxicarbonilfenilo, un grupo 2-isobutoxicarbonil-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butoxicarbonilfenilo, un grupo 3-sec-butoxicarbonil-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentiloxicarbonilfenilo, un grupo 4-neopentiloxi-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-hexiloxicarbonilfenilo, un grupo 5-isohexiloxicarbonil-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-metilpentiloxicarbonil)fenilo, un grupo 6-(1-pirrolil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1-pirrolil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etnilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-metilcarbamoil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(N-fenilcarbamoil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(2-hidroxietyl)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)fenoxifenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)nitrofenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)benciloxifenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)hidroxifenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-oxo-,2,5-dihidrofuran-9-il)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1-imidazolilacetil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(2,9-dioxotiazolidin-5-ilmetil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)[(1-,2-, 3-, o 4-)piperidilcarbonil]fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(1-,3-, 4-, o 5-)pirazolil]fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-oxo-(1- o 3-)pirrolidinil]fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 4-, o 5-)oxazolil]fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-etil-4-metilimidazol-1-il)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bifenilo, un grupo 2,3-dimetoxifenilo, un grupo 2,4-dimetoxifenilo, un grupo 2,5-dimetoxifenilo, un grupo 2,6-dimetoxifenilo, un grupo 3,4-dimetoxifenilo, un grupo 3,5-dimetoxifenilo, un grupo 2,3-diclorofenilo, un grupo 2,4-diclorofenilo, un grupo 3,4-diclorofenilo, un grupo 2-metoxi-5-clorofenilo, un grupo 2-metoxi-5-metilfenilo, un grupo 2-metoxi-5-acetilaminofenilo, un grupo 2-vinil-4-metilfenilo, un grupo 2-vinil-5-etilfenilo, un grupo 2,6-disulfamoilfenilo, un grupo 2,4,6-trimetoxifenilo, un grupo 3,9,5-trietoxifenilo, un grupo 2-vinil-3,4,5-trietilfenilo, un grupo pentametoxifenilo, un grupo 2-vinilnaftilo, un grupo 2,3-dimetoxi-1-naftilo, un grupo 3,4-dietoxifenilo, un grupo 2-metoxi-5-metoxicarbonilfenilo, un grupo 3,5-dimetoxicarbonilfenilo, un grupo 3-cloro-4-hidroxifenilo, un grupo 2-cloro-5-(N-acetilamino)fenilo, un grupo 2-cloro-5-cianofenilo, un grupo 2-cloro-5-carbamoilfenilo, un grupo 2-metoxi-5-(N-acetilamino)fenilo, un grupo 2-cloro-5-etoxicarbonilfenilo, un grupo 3,5,7-trietoxi-1-naftilo, un grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftilo, un grupo 2,3,4,5-tetrametil-7-(N-pentaacetilamino)-1-naftilo, un grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetoxi-1-naftilo, y un grupo heptametoxi-1-naftilo.

Los ejemplos del grupo cianoalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene un solo grupo ciano. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo cianometilo, un grupo 2-cianoetilo, un grupo 1-cianoetilo, un grupo 3-cianopropilo, un grupo 4-cianobutilo, un grupo 1,1-dimetil-2-cianoetilo, un grupo 5-cianopentilo, un grupo 6-cianohexilo, un grupo 1-cianoisopropilo, y un grupo 2-metil-3-cianopropilo.

Los ejemplos del grupo alcanoil(inferior)aminoalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1, grupos amino que tiene de 1 a 2 grupos alcanoil inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcanoil lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-(N-formilamino)etilo, un grupo 2-(N-acetilamino)etilo, un grupo 2-(N-propionilamino)etilo, un grupo 2-(N-butililamino)etilo, un grupo 2-(N-isobutililamino)etilo, un grupo 2-(N-pentanoilamino)etilo, un grupo 2-(N-terc-butilcarbonilamino)etilo, un grupo 2-(N-hexanoilamino)etilo, un grupo N-acetilaminometilo, un grupo 1-(N-acetilamino)etilo, un grupo 3-(N-

acetilamino)propilo, un grupo 4-(N-acetilamino)butilo, un grupo 5-(N-acetilamino)pentilo, un grupo 6-(N-acetilamino)hexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-(N-acetilamino)etilo, un grupo 2-metil-3-(N-acetilamino)propilo, y un grupo 2-(N,N-diacetilamino)etilo.

- 5 Los ejemplos del grupo alquil(inferior)amino sustituido con halógeno incluyen un grupo amino que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior sustituidos con halógeno como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo alquilo lineal o ramificado sustituido con halógeno que tiene de 1 a 6 átomos de carbono con 1 a 7 (preferiblemente de 1 a 3) átomo de halógeno). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo N-fluorometilamino, un grupo N-difluorometilamino, un grupo N-trifluorometilamino, un grupo N-clorometilamino, un grupo N-diclorometilamino, un grupo N-triclorometilamino, un grupo N-bromometilamino, N-dibromometilamino, un grupo N-diclorofluorometilamino, un grupo N-2,2,2-trifluoroetilamino, un grupo N-pentafluoroetilamino, un grupo N-2-cloroetilamino, un grupo N-3,3,3-trifluoropropilamino, un grupo N-heptafluoropropilamino, un grupo N-heptafluoroisopropilamino, un grupo N-3-cloropropilamino, un grupo N-2-cloropropilamino, un grupo N-3-bromopropilamino, un grupo N-4,4,4-trifluorobutilamino, un grupo N-4,4,4,3,3-pentafluorobutilamino, un grupo N-4-clorobutilamino, un grupo N-4-bromobutilamino, un grupo N-2-clorobutilamino, un grupo N-5,5,5-trifluoropentilamino, un grupo N-5-cloropentilamino, un grupo N-6,6,6-trifluorohexilamino, un grupo N-6-clorohexilamino, un grupo N-(1,1-dimetil-2-cloroetil)amino, un grupo N-(2-metil-3-fluoropropil)amino, y un grupo N,N-di(fluorometil)amino.

- 20 Los ejemplos del grupo alquil(inferior)tioalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 grupos alquil(inferior)tio cuyo radical alquilo es un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-metiltioetilo, un grupo 2-etiltioetilo, un grupo 2-n-propiltioetilo, un grupo 2-n-butiltioetilo, un grupo 2-terc-butiltioetilo, un grupo 2-n-pentiltioetilo, un grupo 2-n-hexiltioetilo, un grupo metiltiometilo, un grupo 1-metiltioetilo, un grupo 3-metiltiopropilo, un grupo 4-metiltiobutilo, un grupo 5-metiltiopentilo, un grupo 6-metiltiohexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-metiltioetilo, un grupo 2-metil-3-metiltiopropilo, un grupo 2,2-dietiltioetilo, y un grupo 2,2,2-trietiltioetilo.

- 30 Los ejemplos del grupo amidino que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo amidino que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo amidino, un grupo N-metilamidino, un grupo N-etilamidino, un grupo N-n-propilamidino, un grupo N-n-butilamidino, un grupo N-n-pentilamidino, un grupo N-n-hexilamidino, un grupo N-isopropilamidino, un grupo N-terc-butilamidino, un grupo N,N-dimetilamidino, un grupo N,N'-dimetilamidino, y un grupo N-metil-N'-etil-amidino.

- 35 Los ejemplos del grupo amidinoalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 amidino grupos. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo amidinometilo, un grupo 2-amidinoetilo, un grupo 3-amidinopropilo, un grupo 4-amidinobutilo, un grupo 5-amidinopropilo, un grupo 6-amidinohexilo, un grupo 1-amidinoetilo, un grupo 1,1-dimetil-2-amidinoetilo, un grupo 2-metil-3-amidinopropilo, un grupo 2,2-diamidinoetilo, y un grupo 2,2,2-triamidinoetilo.

- 40 Los ejemplos del grupo alquenal(inferior)oxi incluyen un grupo alquenal(inferior)oxi cuyo radical alqueno inferior es como el ilustrado anteriormente (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo viniloxi, un grupo 1-propeniloxi, un grupo 1-metil-1-propeniloxi, un grupo 2-metil-1-propeniloxi, un grupo 2-propeniloxi, un grupo 2-buteniloxi, un grupo 1-buteniloxi, un grupo 3-buteniloxi, un grupo 2-penteniloxi, un grupo 1-penteniloxi, un grupo 3-penteniloxi, un grupo 4-penteniloxi, un grupo 1,3-butadieniloxi, un grupo 1, 3-pentadieniloxi, un grupo 2-penten-4-iniloxi, un grupo 2-hexeniloxi, un grupo 1-hexeniloxi, un grupo 5-hexeniloxi, un grupo 3-hexeniloxi, un grupo 4-hexeniloxi, un grupo 3,3-dimetil-1-propeniloxi, un grupo 2-etil-1-propeniloxi, un grupo 1,3,5-hexatrieniloxi, un grupo 1,3-hexadieniloxi, y un grupo 1,4-hexadieniloxi.

- 50 Los ejemplos del grupo alquenal(inferior)oxialquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 grupos alquenal(inferior)oxi cuyo radical alquenal(inferior)oxi es un grupo alquenal(inferior)oxi como se ha ilustrado antes (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 3 enlaces dobles). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo viniloximetilo, un grupo 2-viniloxietilo, un grupo 2-(1-propeniloxi)etilo, un grupo 2-(1-metil-1-propeniloxi)etilo, un grupo 2-(2-metil-1-propeniloxi)etilo, un grupo 2-(2-propeniloxi)etilo, un grupo 2-(2-buteniloxi)etilo, un grupo 2-(1-buteniloxi)etilo, un grupo 2-(3-buteniloxi)etilo, un grupo 2-(2-penteniloxi)etilo, un grupo 2-(1,3-penteniloxi)etilo, un grupo 2-(3-penteniloxi)etilo, un grupo 2-(4-penteniloxi)etilo, un grupo 2-(1,3-butadieniloxi)etilo, un grupo 2-(1,3-pentadieniloxi)etilo, un grupo 2-(2-penten-4-iniloxi)etilo, un grupo 2-(2-hexeniloxi)etilo, un grupo 2-(1-hexeniloxi)etilo, un grupo 2-(5-hexeniloxi)etilo, un grupo 2-(3-hexeniloxi)etilo, un grupo 2-(4-hexeniloxi)etilo, un grupo 2-(3,3-dimetil-1-propeniloxi)etilo, un grupo 2-(2-etil-1-propeniloxi)etilo, un grupo 2-(1,3,5-hexatrieniloxi)etilo, un grupo 2-(1,3-hexadieniloxi)etilo, un grupo 2-(1,4-hexadieniloxi)etilo, un grupo 3-viniloxipropilo, un grupo 4-viniloxibutilo, un grupo 5-viniloxipropilo, un grupo 6-viniloxihexilo, un grupo 1-viniloxietilo, un grupo 1,1-dimetil-2-viniloxietilo, un grupo 2-metil-3-viniloxipropilo, un grupo 2,2-diviniloxietilo, y un grupo 2,2,2-triviniloxietilo.

Los ejemplos del grupo arilamino que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, y un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno en el grupo arilo incluyen

un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos arilo como se ha ilustrado antes que pueden tener de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente de 1 a 2 sustituyentes, en el grupo arilo, que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alquilo sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono con 1 a 7, preferiblemente de 1 a 3 átomos de halógeno); y

un grupo alcoxi sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono con preferiblemente de 1 a 7, más preferiblemente de 1 a 3 átomos de halógeno). Sus

ejemplos específicos incluyen un grupo N-fenilamino, un grupo N-2-naftilamino, un grupo N-(2-metilfenil)amino, un grupo N-(3-etil-1-naftil)amino, un grupo N-(4-n-propilfenil)amino, un grupo N-(2-n-butil-1-fenil)amino, un grupo N-(3-n-pentilfenil)amino, un grupo N-(4-n-hexil-1-naftil)amino, un grupo N-(2-isobutilfenil) amino, un grupo N-(3-terc-butil-1-naftil)amino, un grupo N-(2-metoxifenil)amino, un grupo N-(3-etoxi-1-naftil)amino, un grupo N-(4-n-propoxifenil)amino, un grupo N-(3-isopropoxi-1-naftil)amino, un grupo N-(n-butoxifenil)amino, un grupo N-(1-isobutoxi-2-naftil)amino, un grupo N-(terc-butoxifenil)amino, un grupo N-(5-sec-butoxi-1-naftil)amino, un grupo N-(n-pentiloxifenil)amino, un grupo N-(5-isopentiloxi-1-naftil)amino, un grupo N-(1-neopentiloxifenil)amino, un grupo N-(6-n-hexiloxi-2-naftil)amino, un grupo N-(isohehexiloxifenil)amino, un grupo N-(3-metilpentiloxi-1-naftil)amino, un grupo N-(2-trifluorometilfenil)amino, un grupo N-(4-trifluorometilfenil)amino, un grupo N-(2-clorometilfenil)amino, un grupo N-[3-(2-fluoroetil)-1-naftil]amino, un grupo N-[4-(3-bromopropil)fenil]amino, un grupo N-[2-(4-clorobutil)-1-fenil]amino, un grupo N-[3-(5-fluoropentil)fenil]amino, un grupo N-[4-(6-bromohexil)-1-naftil]amino, un grupo N-[2-(1,1-dimetil-2-cloroetil)fenil]amino, un grupo N-[7-(2-metil-3-fluoropropil)-2-naftil]amino, un grupo N-(2-clorometoxifenil)amino, un grupo N-(4-trifluorometoxifenil)amino, un grupo N-(3-(2-fluoroetoxi)-1-naftil)amino, un grupo N-[4-(3-bromopropoxi)fenil]amino, un grupo N-[2-(4-clorobutoxi)-1-fenil]amino, un grupo N-[3-(5-fluoropentiloxi)fenil]amino, un grupo N-[4-(6-bromohexiloxi)-1-naftil]amino, un grupo N-[2-(1,1-dimetil-2-cloroetoxi)fenil]amino, un grupo N-[7-(2-metil-3-fluoropropoxi)-2-naftil]amino, un grupo N-(2-clorometoxifenil)amino, un grupo N-[3-(2-fluoroetoxi)-1-naftil]amino, un grupo N-[4-(3-bromopropoxi)fenil]amino, un grupo N-[2-(4-clorobutoxi)-1-fenil]amino, un grupo N-[3-(5-fluoropentiloxi)fenil]amino, un grupo N-[4-(6-bromohexiloxi)-1-naftil]amino, un grupo N-[2-(1,1-dimetil-2-cloroetoxi)fenil]amino, un grupo N-[7-(2-metil-3-fluoropropoxi)-2-naftil]amino, y un grupo N,N-difenilamino.

Los ejemplos del grupo arilalqueno inferior incluyen un grupo alqueno inferior como se ha ilustrado antes que tiene un grupo arilo como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 arilo grupos y de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-feniletlenilo, un grupo 3-fenil-2-propenilo, un grupo 3-[(1- o 2-)naftil]-2-propenilo, un grupo 4-[(2-, 3-, o 4-)metilfenil]-2-butenilo, un grupo 4-[(2-, 3-, o 4-)etilfenil]-3-butenilo, un grupo 4-[(2-, 3-, o 9-)n-propilfenil]-1,3-butadienilo, un grupo 5-[(2-, 3-, o 4-)n-butilfenil]-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-[(2-, 3-, o 9-)n-pentilfenil]-2,4-hexadienilo, un grupo 5-[(2-, 3-, o 4-)n-hexilfenil]-3-pentenilo, un grupo 3-[(2-, 3-, o 4-)isobutilfenil]-2-propenilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)terc-butilfenil]fenilo, un grupo 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-1-naftil]-2-propenilo, un grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-2-naftil]-2-butenilo, un grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-1-naftil]-3-butenilo, un grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-2-naftil]-1,3-butadienilo, un grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-1-naftil]-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-2-naftil]-2,4-hexadienilo, un grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-1-naftil]-3-pentenilo, un grupo 3-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-2-naftil]-2-propenilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-1-naftil]etenilo, un grupo 3-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-2-naftil]-2-propenilo, un grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-1-naftil]-2-butenilo, un grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-2-naftil]-3-butenilo, un grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-1-naftil]-1,3-butadienilo, un grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-2-naftil]-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-1-naftil]-2,4-hexadienilo, un grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-2-naftil]-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-[(2-, 3-, o 4-)clorofenil]-2-butenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)fluorofenil]-2,4-hexadienilo, un grupo 5-[(2-, 3-, o 4-)bromofenil]-3-pentenilo, un grupo 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-1-naftil]-2-propenilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-2-naftil]etenilo, un grupo 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-1-naftil]-2-propenilo, un grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-2-naftil]-2-butenilo, un grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-1-naftil]-3-butenilo, un grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-2-naftil]-1,3-butadienilo, un grupo 5-[(2-, 3-, o 4-)aminofenil]-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-1-naftil]-2,4-hexadienilo, un grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-2-naftil]-3-pentenilo, un grupo 3-(2,3-dimetilfenil)-2-propenilo, un grupo 2-(3,4-dimetilfenil)vinilo, un grupo 3-(2,4-dimetilfenil)-2-propenilo, un grupo 4-(2,5-dimetilfenil)-2-butenilo, un grupo 4-(2,6-dimetilfenil)-3-butenilo, un grupo 4-(2,4,6-trimetilfenil)-1,3-butadienilo, un grupo 5-(3,4,5-trimetilfenil)-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-(2,3,4,5-tetraetilfenil)-2,4-hexadienilo, un grupo 5-(pentametilfenil)-3-pentenilo, un grupo 3-(2-metilnaftil)-2-propenilo, un grupo 2-(2,3-dimetilnaftil)etenilo, un grupo 3-(3,4-dimetilfenil)-2-propenilo, un grupo 4-(3,5,7-trietilnaftil)-2-butenilo, un grupo 4-(3,4,5,7-tetrametilnaftil)-3-butenilo, un grupo 4-(2,3,4,5,7-pentametilnaftil)-1,3-butadienilo, un grupo 5-(2,3,4,5,6,7-hexaetilnaftil)-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-(heptametilnaftil)-2,4-hexadienilo, un grupo 5-(2,3-diaminofenil)-3-pentenilo, un grupo 3-(2,4,6-triaminofenil)-2-propenilo, y un grupo 2-(2-metil-5-cloronaftil)etenilo.

Los ejemplos del grupo piridilamino que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo piridilamino que puede tener de 1 a 3, preferiblemente de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono), en el grupo piridilo y/o un grupo amino. Sus ejemplos
 5 específicos incluyen un grupo N-(2-, 3-, o 4-)piridilamino, un grupo N-3-metil-2-piridilamino, un grupo N-(4-metil-2-piridil)amino, un grupo N-(5-metil-2-piridil)amino, un grupo N-(6-metil-2-piridil)amino, un grupo N-(2-metil-3-piridil)amino, un grupo N-(4-metil-3-piridil)amino, un grupo N-(5-metil-3-piridil)amino, un grupo N-(6-metil-3-piridil)amino, un grupo N-(2-metil-4-piridil)amino, un grupo N-(3-metil-4-piridil)amino, un grupo N-(3-etil-2-piridil)amino, un grupo N-(4-n-propil-2-piridil)amino, un grupo N-(5-n-propil-2-piridil)amino, un grupo N-(2-n-butil-3-piridil)amino, un grupo N-(4-n-pentil-3-piridil)amino, un grupo N-(5-n-hexil-3-piridil)amino, un grupo N-(2-isopropil-4-piridil)amino, un grupo N-(3-terc-butil-4-piridil)amino, un grupo N-(3-metil-2-piridil)-N-metil-amino, y un grupo N-(2,4-dietil-3-piridil)-N-metil-amino.

Los ejemplos del grupo arilalquilo inferior (que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo sustituido con halógeno, un grupo alcoxi sustituido con halógeno, un grupo alcoxi inferior, un grupo carbamoilo, y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, como sustituyente, en el grupo arilo y/o el grupo alquilo inferior) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 (preferiblemente 1) arilo grupos como se ha ilustrado antes. Obsérvese que, en el grupo arilo y/o el radical alquilo, puede haber de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente, de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en
 20 un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes;

un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono preferiblemente sustituido con 1 a 7 átomo de halógeno);

un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con 1 a 7 átomo de halógeno);

un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo carbamoilo; y

un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes. Los ejemplos específicos del grupo arilalquilo inferior (que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi sustituido con halógeno, un grupo alcoxi inferior, un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, en el grupo arilo y/o el grupo alquilo inferior) incluyen un grupo bencilo, un grupo 1-feniletilo, un grupo 2-feniletilo, un grupo 1-metil-1-feniletilo, un grupo 1,1-dimetil-2-feniletilo, un grupo 1,1-dimetil-3-fenilpropilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)fluorobencilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)fluorofenil]etilo, un grupo 1-[(2-, 3-, o 4-)fluorofenil]etilo, un grupo 1-[(2-, 3-, o 4-)fluorofenil]propilo, un grupo 2-[(2,6- o 3,5-)difluorofenil]etilo, un grupo 1-(3,5-difluorofenil)etilo, un grupo 1-(3,5-difluorofenil)propilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)clorobencilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)clorofenil]etilo, un grupo 2-(3,4-diclorofenil)etilo, un grupo 1-(3-clorofenil)butilo, un grupo 1-(4-clorofenil)butilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)trifluorometilfenilbencilo, un grupo 1-[(2-, 3-, o 4-)trifluorometilfenil]etilo, un grupo 1-[(2-, 3-, o 4-)trifluorometilfenil]propilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metilbencilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)metilfenil]etilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)trifluorometoxibencilo, un grupo 1-[(2-, 3-, o 4-)metilfenil]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)metoxifenil]propilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etoxibencilo, un grupo (3,4- o 3,5-)dimetoxibencilo, un grupo (3,4- o 3,5-)di(n-butoxi)bencilo, un grupo 2-[(3,5- o 3,4-)dimetoxifenil]etilo, un grupo 2-(2-etoxifenil)etilo, un grupo 1-(4-metoxifenil)butilo, un grupo 1-fenil-1-metoxycarbonilmetilo, un grupo 1-carbamoil-2-feniletilo, un grupo 1-metoxycarbonil-2-feniletilo, un grupo 2-metoxycarbonil-2-feniletilo, un grupo 2-fenil-2-hidroxietilo, un grupo 2-(4-hidroxifenil)-1-metoxycarboniletilo, un grupo 3-cloro-4-difluorometoxifenilmetilo, y un grupo naftilmetilo.

Los ejemplos del grupo alquinilo inferior incluyen un grupo alquinilo lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo etinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-pentinilo, y un grupo 2-hexinilo.

Los ejemplos del grupo ariloxialquilo inferior (en el grupo arilo, pueden estar presentes un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior; un grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior; y un grupo pirrolidinilo que puede tener un grupo oxo, incluyen un grupo arilalquilo inferior cuyo radical arilo y un grupo alquilo inferior son los ilustrados antes. En el grupo arilo de la presente memoria, pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 5 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior como se ha
 60 ilustrado antes; un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes y un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes; y un grupo oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-[(2-, 3- o 4-)metoxifenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- o 4-)carbamoilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- o 4-)(N-metil-N-etoxycarbamoil)fenoxi]etilo y un grupo 2-[(2-, 3- o 4-)(2-oxo-1-pirrolidinil)fenoxi]etilo.

Los ejemplos del grupo isoxazolidinilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo isoxazolilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 3-oxoisoxazolidin-4-ilo y un grupo 3,5-dioxoisoxazolidin-4-ilo.

5 Los ejemplos del grupo dihidroindenilo incluyen un grupo (1-, 2-, 4- o 5-)-1,2-dihidroindenilo.

Los ejemplos del grupo arilalcoxi(inferior)alquilo inferior incluyen un grupo arilalcoxi(inferior)alquilo inferior cuyo radical arilo, radical alcoxi inferior y radical alquilo inferior son los ilustrados antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo benciloximetilo, un grupo 2-benciloxietilo y un grupo 2-benciloxibutilo.

10 Los ejemplos del grupo azetidinilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior y un grupo aroilo incluyen un grupo azetidinilo que puede tener a de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos seleccionados de un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes y un grupo aroilo como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2- o 3-azetidinilo, un grupo 1-acetil-(2- o 3-)azetidinilo, un grupo 1-butil-(2- o 3-)azetidinilo y un grupo 1-benzoil-(2- o 3-)azetidinilo.

15 Los ejemplos del grupo azetidinilalquilo inferior que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior y un grupo aroilo incluyen un grupo azetidinilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (preferible 1) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes y un grupo aroilo como se ha ilustrado antes y tienen un radical alquilo inferior como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2- o 3-azetidinilmetilo, un grupo 2-(2- o 3-azetidinil)etilo, un grupo 1-acetil-(2- o 3-)azetidinilmetilo, un grupo 1-butil-(2- o 3-)azetidinilmetilo, un grupo 1-benzoil-(2- o 3-)azetidinilmetilo, un grupo 2-[1-acetil-(2- o 3-)azetidinil]etilo, un grupo 2-[1-butil-(2- o 3-)azetidinil]etilo y un grupo 2-[1-benzoil-(2- o 3-)azetidinil]etilo.

25 Los ejemplos del grupo tetrazolilo incluyen un grupo (1- o 5-)tetrazolilo.

Los ejemplos del grupo indolinilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo indolinilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 3-, 5-, 6-, 7- u 8-)indolinilo, un grupo 2-oxo-(1-, 3-, 5-, 6-, 7- u 8-)indolinilo y 2,3-dioxo-(1-, 5-, 6-, 7- u 8-)indolinilo.

30 Los ejemplos del grupo triazolilo incluyen un grupo 1,2,4-triazolilo y un grupo 1,3,5-triazolilo.

Los ejemplos del grupo triazolilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquil(inferior)tio incluyen un grupo triazolilo como se ha ilustrado antes que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes y un grupo alquil(inferior)tio como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 3- o 5-)-1,2,4-triazolilo, un grupo (1-, 2- o 5-)-1,3,5-triazolilo, un grupo 1-metil-5-metiltio-1,2,4-triazol-3-ilo y un grupo 1-metil-5-metiltio-1,2,3-triazol-2-ilo.

40 Los ejemplos del grupo imidazolilo que puede tener un grupo carbamoilo incluyen un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos carbamoilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 2-, 4- o 5-)imidazolilo y un grupo 4-carbamoil-(1-, 2- o 5-)imidazolilo.

45 Los ejemplos del grupo oxazolilo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo oxazolilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 3- o 4-)oxazolilo y un grupo 4-metil-(2- o 3-)oxazolilo.

Los ejemplos del grupo isotiazolilo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo isotiazolilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (3-, 4- o 5-)isotiazolilo y un grupo (3- o 4-)metil-2-isotiazolilo.

50 Los ejemplos del grupo dihidrobenzotiazolilo incluyen un grupo (1-, 2-, 4-, 5-, 6- o 7-)2,3-dihidrobenzotiazolilo.

55 Los ejemplos del grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener un solo grupo oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 2-, 5-, 6-, 7- u 8-)2,3-dihidrobenzotiazolilo y un grupo 2-oxo-(1-, 5-, 6-, 7- u 8-)2,3-dihidrobenzotiazolilo.

Los ejemplos del grupo tienilo que puede tener un grupo alcoxi(inferior)carbonilo incluyen un grupo tienilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2- o 3-)tienilo y un grupo 3-metoxicarbonil-2-tienilo.

60 Los ejemplos del grupo oxazolilalquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo oxazolilalquilo inferior como se ha ilustrado antes, cuyo grupo alquilo como se ha ilustrado antes, tiene de 1 a 3 (más

preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes en el anillo de oxazol. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 4- o 5-)oxazolilmetilo, un grupo 2-(2-, 4- o 5-)oxazolilmetilo, un grupo [2-metil-(4- o 5-)oxazolil]metilo y un grupo (2,5-dimetil-4-oxazolil)metilo.

- 5 Los ejemplos del grupo aminoalquilo inferior que puede tener un grupo, en el grupo amino, que se selecciona del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior, un grupo arilo, un grupo arilalquilo inferior, un grupo aroilo, y un grupo alquilo sustituido con amino (en el grupo amino del grupo alquilo sustituido con amino, puede estar presente un grupo alquilo inferior como sustituyente) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 5, preferible de 1 a 3, más preferiblemente 1, un grupo amino. Obsérvese que, en el grupo amino, pueden estar presentes de 1 a 2 sustituyentes que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);
- 10 un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono con 1 a 13, preferiblemente de 1 a 7, más preferiblemente de 1 a 3 átomos de halógeno);
- 15 un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes;
- un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcanilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);
- 20 un grupo arilo como se ha ilustrado antes;
- un grupo arilalquilo inferior como se ha ilustrado antes;
- un grupo aroilo como se ha ilustrado antes; y un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 5, preferiblemente de 1 a 3, más preferiblemente 1, grupos amino (pueden estar presentes de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo amino, como sustituyente o sustituyentes). Los ejemplos específicos del grupo aminoalquilo inferior que puede tener, en el grupo amino, un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior, un grupo arilo, un grupo arilalquilo inferior, un grupo aroilo, y un grupo alquilo sustituido con amino ((en el grupo amino del grupo alquilo sustituido con amino, puede estar presente un grupo alquilo inferior como sustituyente) incluyen un grupo N-metilaminometilo, un grupo N-etilaminometilo, un grupo N-n-propilaminometilo, un grupo N,N-dimetilaminometilo, un grupo N,N-dietilaminometilo, un grupo N-metil-N-n-propilaminometilo, un grupo N-metil-N-etilaminometilo, un grupo N-(2,2,2-trifluoroetil)aminometilo, un grupo N-metil-N-bencilaminometilo, un grupo N-fenilaminometilo, un grupo N-metil-N-fenilaminometilo, un grupo N-formilaminometilo, un grupo N-metil-N-acetilaminometilo, un grupo N-metil-N-propionilaminometilo, un grupo N-(2-(N,N-dietilamino)etil)aminometilo, un grupo N-metil-N-benzoilaminometilo, un grupo N-metilaminoetilo, un grupo N-etilaminoetilo, un grupo N-(2,2,2-trifluoroetil)aminoetilo, un grupo N,N-dimetilaminoetilo, un grupo N,N-dietilaminoetilo, un grupo N-metil-N-acetilaminoetilo, un grupo N-metil-N-benzoilaminoetilo, un grupo N-metil-N-propionilaminoetilo, un grupo N-metil-N-bencilaminoetilo, y un grupo N-metil-N-terc-butoxicarbonilaminoetilo.
- 25
- 30
- 35
- 40

- Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido con un grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) y sustituido con 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos carbamoilo que pueden tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); y
- 45 un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 13, preferiblemente de 1 a 7, más preferiblemente de 1 a 3 átomos de halógeno). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo carbamoilmetilo, un grupo 2-carbamoiletilo, un grupo 1-carbamoiletilo, un grupo 3-carbamoilpropilo, un grupo 4-carbamoilbutilo, un grupo 5-carbamoilpentilo, un grupo 6-carbamoilhexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-carbamoiletilo, un grupo 2-metil-3-carbamoilpropilo, un grupo 1,2-dicarbamoiletilo, un grupo 2,2-dicarbamoiletilo, un grupo 1,2,3-tricarbamoilpropilo, un grupo N-metilcarbamoilmetilo, un grupo N-etilcarbamoilmetilo, un grupo 2-(N-n-propilcarbamoil)etilo, un grupo 3-(N-n-butilcarbamoil)propilo, un grupo 4-(N-isobutilcarbamoil)butilo, un grupo 5-(N-terc-butilcarbamoil)pentilo, un grupo 6-(N-pentilcarbamoil)hexilo, un grupo N,N-dimetilcarbamoilmetilo, un grupo N,N-dietilcarbamoilmetilo, un grupo 2-(N-2-fluoroetilcarbamoil)etilo, un grupo 3-(N-2-cloroetilcarbamoil)propilo, un grupo 4-(N-2-bromoetilcarbamoil)butilo, un grupo 2-(N-2,2-dicloroetilcarbamoil)etilo, un grupo N-2,2,2-trifluoroetilcarbamoilmetilo, y un grupo N-heptafluoropropilcarbamoilmetilo.
- 50
- 55
- 60

Los ejemplos del grupo tiocarbamoilo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo tiocarbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo tiocarbamoilo, un grupo N-metil-

tiocarbamoilo, un grupo N-etil-tiocarbamoilo, un grupo N-n-propiltiocarbamoilo, un grupo N-n-butil-tiocarbamoilo, un grupo N-n-pentil-tiocarbamoilo, un grupo N-n-hexil-tiocarbamoilo, un grupo N-isobutil-tiocarbamoilo, un grupo N-terc-butil-tiocarbamoilo, un grupo N,N-dimetil-tiocarbamoilo, y un grupo N-metil-N-etil-tiocarbamoilo.

5 Los ejemplos del oxazolidinilo grupo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo oxazolidinilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo oxazolidin-3-ilo, un grupo oxazolidin-4-ilo, un grupo oxazolidin-5-ilo, un grupo 2-oxo-oxazolidin-4-ilo, un grupo 2-oxo-oxazolidin-3-ilo, y un grupo 2-oxo-oxazolidin-5-ilo.

10 Los ejemplos del grupo imidazolidinilo que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior incluyen un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 3, preferiblemente de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un imidazolidin-1-ilo, un grupo imidazolidin-2-ilo, un grupo imidazolidin-4-ilo, un grupo 2-oxo-imidazolidin-1-ilo, un grupo 4-oxo-imidazolidin-1-ilo, un grupo 5-oxo-imidazolidin-1-ilo, un grupo 4-oxo-imidazolidin-2-ilo, un grupo 2-oxo-imidazolidin-4-ilo, un grupo 2-metil-imidazolidin-1-ilo, un grupo 4-etil-imidazolidin-1-ilo, un grupo 5-n-propil-imidazolidin-1-ilo, un grupo 4-n-butil-imidazolidin-2-ilo, un grupo 2-n-pentil-imidazolidin-4-ilo, un grupo 2-n-hexil-imidazolidin-1-ilo, un grupo 4-isobutil-imidazolidin-2-ilo, un grupo 2-terc-butil-imidazolidin-4-ilo, un grupo 2-oxo-3-metil-imidazolidin-1-ilo, y un grupo 2-oxo-3,4-dimetil-imidazolidin-1-ilo.

20 Los ejemplos del grupo pirrolidinilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 2- o 3-)pirrolidinilo, un grupo (2- o 3-)oxo-1-pirrolidinilo, un grupo (3-, 4- o 5-)oxo-2-pirrolidinilo, y un grupo (2-, 4- o 5-)oxo-3-pirrolidinilo.

25 Los ejemplos del grupo imidazolilo incluyen un grupo (1-, 2-, 4- o 5-)imidazolilo.

Los ejemplos del grupo isoxazolilo incluyen un grupo (3-, 4- o 5-)isoxazolilo.

30 Los ejemplos del grupo arilsulfonilo incluyen un grupo arilsulfonilo cuyo radical arilo es fenilo, bifenilo, bifenilo sustituido, fenilo sustituido, naftilo y naftilo sustituido, y que puede tener, en el radical arilo, de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente de 1 a 2 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos del sustituyente tal como fenilo, bifenilo y naftilo incluyen un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un átomo de halógeno, un grupo amino y similares. Pueden estar presentes de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente de 1 a 2 sustituyentes de al menos un tipo de estos en el anillo de

35 fenilo, bifenilo, naftilo y similares. Los ejemplos específicos del grupo arilsulfonilo que puede tener un grupo alquilo inferior en el grupo arilo incluyen un grupo fenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bifenilsulfonilo, un grupo (1- o 2-)naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-hexilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)isobutilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butilfenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-propil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-propil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-butil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-butil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-butil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)clorofenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)fluorofenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bromofenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-

, 7-, u 8-)fluoro-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)aminofenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-2-naftilsulfonilo, un grupo 2,3-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 3,4-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,4-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,5-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,6-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,4,6-trimetilfenilsulfonilo, un grupo 3,4,5-trimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,3,4,5-tetraetilfenilsulfonilo, un grupo pentametilfenilsulfonilo, un grupo 2-metilnaftilsulfonilo, un grupo 2,3-dimetilnaftilsulfonilo, un grupo 3,4-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 3,5,7-trietilnaftilsulfonilo, un grupo 3,4,5,7-tetrametilnaftilsulfonilo, un grupo 2,3,4,5,7-pentametilnaftilsulfonilo, un grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetilnaftilsulfonilo, un grupo heptametilnaftilsulfonilo, un grupo 2,3-diaminofenilsulfonilo, un grupo 2,4,6-triaminofenilsulfonilo, y un grupo 2-metil-5-cloronaftilsulfonilo.

Los ejemplos del grupo piperidilo que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior; un grupo alcanilo inferior; un grupo arilsulfonilo; un grupo oxo; un grupo hidroxilo y un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior incluyen un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 5, preferiblemente de 1 a 3, más preferiblemente 1 sustituyente seleccionado del grupo que consiste en

un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcanilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); y

un grupo arilsulfonilo como se ha ilustrado antes; un grupo oxo; un grupo hidroxilo; y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes y un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)piperidilo, un grupo 1-metil-9-piperidilo, un grupo 2-etil-4-piperidilo, un grupo 3-n-propil-4-piperidilo, un grupo 4-isopropil-4-piperidilo, un grupo 2-n-butil-1-piperidilo, un grupo 3-isobutil-1-piperidilo, un grupo 4-terc-butil-1-piperidilo, un grupo 1-sec-butil-2-piperidilo, un grupo 2-n-pentil-2-piperidilo, un grupo 3-(1-etilpropil)-2-piperidilo, un grupo 4-iso-pentil-2-piperidilo, un grupo 5-neopentil-2-piperidilo, un grupo 6-n-hexil-2-piperidilo, un grupo 1-(1,2,2-trimetilpropil)-3-piperidilo, un grupo 2-(3,3-dimetilbutil)-3-piperidilo, un grupo 3-(2-etilbutil)-3-piperidilo, un grupo 4-isohexil-3-piperidilo, un grupo 5-(3-metilpentilo grupo)-3-piperidilo, un grupo 6-formil-3-piperidilo, un grupo 1-acetil-4-piperidilo, un grupo 2-propionil-4-piperidilo, un grupo 3-butil-4-piperidilo, un grupo 4-isobutil-9-piperidilo, un grupo 2-pentanoil-1-piperidilo, un grupo 3-terc-butilcarbonil-1-piperidilo, un grupo 4-hexanoil-1-piperidilo, un grupo 1-fenilsulfonil-2-piperidilo, un grupo 2-(2-bifenilsulfonil)-2-piperidilo, un grupo 3-(1-naftilsulfonil)-2-piperidilo, un grupo 1-tosil-4-piperidilo, un grupo 4-(4-etilfenilsulfonil)-2-piperidilo, un grupo 5-(2-n-propilfenilsulfonil)-2-piperidilo, un grupo 6-(3-n-butilfenilsulfonil)-2-piperidilo, un grupo 1-(4-n-pentilfenilsulfonil)-3-piperidilo, un grupo 2-(2-n-hexilfenilsulfonil)-3-piperidilo, un grupo 3-(3-isobutilfenilsulfonil)-3-piperidilo, un grupo 4-(4-terc-butilfenilsulfonil)-3-piperidilo, un grupo 5-(2-clorofenilsulfonil)-3-piperidilo, un grupo 6-(4-fluorofenilsulfonil)-3-piperidilo, un grupo 1-(3-bromofenilsulfonil)-4-piperidilo, un grupo 2-(2-aminofenilsulfonil)-4-piperidilo, un grupo 3-(2,3-dimetilfenilsulfonil)-4-piperidilo, un grupo 4-(3,4,5-trimetilfenilsulfonil)-9-piperidilo, un grupo 2-(2,3-diaminofenilsulfonil)-1-piperidilo, un grupo 4-oxo-1-piperidilo, un grupo 2-oxo-3-piperidilo, un grupo 4-hidroxilo-1-piperidilo, un grupo 2-hidroxilo-3-piperidilo, un grupo 4-amino-1-piperidilo, un grupo 2-amino-4-piperidilo, un grupo 4-metilamino-1-piperidilo, un grupo 2-metilamino-4-piperidilo, un grupo 4-etilamino-1-piperidilo, un grupo 2-etilamino-4-piperidilo, un grupo 2-dimetilamino-4-piperidilo, un grupo 4-dietilamino-1-piperidilo, un grupo 4-formilamino-1-piperidilo, un grupo 4-acetilamino-1-piperidilo, un grupo 9-(N-metil-N-acetilamino)-1-piperidilo, un grupo 4-(N-metil-N-metoxycarbonilamino)-1-piperidilo, un grupo 4-(N-metil-N-terc-butoxycarbonilamino)-1-piperidilo, un grupo 4-[N-metil-N-(N-acetilamino)acetilamino]-1-piperidilo.

Los ejemplos del piperidilcarbonilo grupo que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo carboxialquilo inferior, un grupo alquilo(inferior)carbamoilalquilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi inferior, un grupo carboxi, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2, grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo aroilo), un grupo piperidilo (en el que puede estar presente un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo aroilo), un grupo piperazinilo (en el que puede estar presente como sustituyente un grupo alquilo inferior), un grupo 1,4-dioxo-8-azaespiro[4,5]decilo, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que puede estar presente como sustituyente un grupo alquilo inferior), un grupo piridilo, un grupo piridilo, un grupo piridilalcoxi inferior, un grupo tetrahidroquinolilo (en el que puede estar presente un grupo oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo arilalcoxi inferior (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alcoxi sustituido con halógeno), un grupo arilo (en el que puede estar presente un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxi inferior y un grupo hidroxilo), un grupo ariloxi (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y

- un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), un grupo arilalquilo inferior (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno) y un grupo aroilo (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxi inferior) incluyen
- 5 un grupo piperidilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) sustituyentes, en el grupo piperidilo, seleccionados del grupo que consiste en
- un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);
- un grupo hidroxil;
- 10 un grupo hidroxialquilo inferior como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y que tiene de 1 a 3 grupos hidroxil);
- un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes;
- un grupo carboxialquilo inferior como se ha ilustrado antes que tiene un radical alquilo inferior como se ha ilustrado antes;
- 15 un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y sustituido con un grupo carbamoilo que tiene de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono);
- un grupo carbamoilo;
- un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);
- 20 un grupo carboxil;
- un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado
- un grupo amino (en el que pueden estar presentes 1 o 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo
- 25 alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes y un grupo aroilo como se ha ilustrado antes);
- un grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes y un grupo aroilo como se ha ilustrado antes);
- un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono));
- 30 un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decilo;
- un grupo morfolinilo;
- un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono));
- 35 un grupo piridilo;
- un grupo piridiloxil;
- un grupo piridilalcoxi inferior que tiene un radical alcoxi inferior como se ha ilustrado antes;
- un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo);
- 40 un grupo benzodioxolilo (preferiblemente un grupo benzo[1,3]dioxolilo);
- un grupo arilalcoxi inferior que tiene un radical arilo y un radical alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes, un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes y un grupo alcoxi sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes);
- 45 un grupo arilo como se ha ilustrado antes (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes, un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes y un grupo hidroxil);
- un grupo ariloxil que tiene un radical arilo como se ha ilustrado antes (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes);
- 50 un grupo arilalquilo inferior que tiene un radical arilo y un radical alquilo inferior como se ha ilustrado antes (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno); y
- un grupo aroilo como se ha ilustrado antes (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes y un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)etil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)metil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)hidroxil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)hidroxil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)hidroxil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)hidroxil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)hidroximetil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)hidroximetil-

2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)hidroximetil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)hidroximetil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)(2-hidroxietil)-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-etil-carbamoilmetil)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(N-etil-carbamoilmetil)-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(N-etil-carbamoilmetil)-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)N-etil-carbamoilmetil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)carbamoil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)carbamoil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)carbamoil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)carbamoil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)carboxi-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)carboximetil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metoxi-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metoxi-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metoxi-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 9-)metoxi-9-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metoxicarbonil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metoxicarbonil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)metoxicarbonil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 5-)etoxicarbonil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)etoxicarbonil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)etoxicarbonil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)acetilamino-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)acetilamino-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)acetilamino-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)acetilamino-9-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butoxicarbonilamino-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)terc-butoxicarbonilamino-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)terc-butoxicarbonilamino-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)terc-butoxicarbonilamino-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)butirilamino-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)benzoilamino-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(N-metil-N-acetilamino)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(N-metil-N-butilamino)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(N-metil-N-terc-butoxicarbonilamino)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-metil-N-benzoilamino)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidil]-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidil]-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidil]-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[1-acetil-(2-, 3-, o 4-)piperidil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[1-butil-(2-, 3-, o 4-)piperidil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[1-terc-butoxicarbonil-(2-, 3-, o 4-)piperidil]-1-piperidilcarbonilo, grupos, (2-, 3-, o 4-)[1-benzoil-(2-, 3-, o 4-)piperidil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1-piperazinil)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[1-(3,4-dimetilpiperazinil)]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[1-(3,4-dimetilpiperazinil)]-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[1-(3,4-dimetilpiperazinil)]-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)[1-(3,4-dimetilpiperazinil)]-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[1-(4-metilpiperazinil)]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 3-, o 4-)[1-(4-metilpiperazinil)]-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, o 4-)[1-(4-metilpiperazinil)]-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, o 3-)[1-(4-metilpiperazinil)]-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)morfolinil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)morfolinil]-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 4-, 5-, o 6-)[(2-, 3-, o 4-)morfolinil]-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, o 3-)[(2-, 3-, o 4-)morfolinil]-4-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, o 7-)(4-metil-hexahidro-1,4-diazepinil)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(4-metil-hexahidro-1,4-diazepinil)-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(4-metil-hexahidro-1,4-diazepinil)-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)(4-metil-hexahidro-1,4-diazepinil)-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]dec-8-il)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]dec-8-il)-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]dec-8-il)-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)(1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]dec-8-il)-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 4-, o 5-)benzo[1,3]dioxolil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-oxo-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)-1,2,3,4-tetrahidroquinolil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo 4-[2-oxo-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)-1,2,3,9-tetrahidroquinolil]-(2-, o 3-metil)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)piridil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)piridiloxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)piridilmetoxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)fluorobenciloxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)clorobenciloxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)bromobenciloxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)metilbenciloxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)trifluorometoxibenciloxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3,4-diclorobenciloxil)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3,4-dimetoxibenciloxil)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-cloro-4-metoxibenciloxil)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)fluorofenoxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)clorofenoxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)cianofenoxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)metoxifenoxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)metilfenoxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)trifluorometoxifenoxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)fenil-1-piperidilcarbonilo, un grupo 4-hidroxi-(2-, 3-, o 4-)fenil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)clorofenil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)metoxifenil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)hidroxifenoxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo 4-hidroxi-(2-, 3-, o 4-)fenil-1-piperidilcarbonilo, un grupo 4-etoxicarbonil-(2-, 3-, o 4-)fenil-1-piperidilcarbonilo, un grupo 4-hidroxi-(2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)clorofenil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bencil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)clorobencil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)metilbencil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)metoxibencil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)trifluorometoxibencil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo 4-hidroxi-(2-, 3-, o 4-)bencil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)clorobenzoil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)metoxibenzoil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)fluorobenzoil]-1-piperidilcarbonilo, y un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)trifluorometoxibencil]-1-piperidilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo carbamoilo; un grupo hidroxilo, un grupo amino (que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, y un grupo aroilo en el mismo), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo piperidilalquilo inferior, un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener un grupo alquilo inferior en el mismo como sustituyente), un grupo aminoalquilo inferior (que puede tener un grupo alquilo inferior en el mismo como sustituyente) y un grupo ariloxi (que puede tener en el grupo arilo un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno), un grupo ariloxialquilo inferior (en el grupo arilo, puede estar presente un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno) y un grupo tetrahidroquinolilo (en el que puede estar presente un grupo oxo) incluyen un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) sustituyentes, en el grupo pirrolidinilo, que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes que tiene de 1 a 3 grupos hidroxilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo carbamoilo;

un grupo hidroxilo;

un grupo amino (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes, y un grupo aroilo como se ha ilustrado antes);

un grupo morfolinilalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es como el ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo pirrolidinilalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es como el ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo piperidilalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es como el ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo piperazinilalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es como el ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) (como sustituyente o sustituyentes pueden estar presentes de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo piperazinilo);

un grupo aminoalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es como el ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) (pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo amino), un grupo ariloxi que tiene un radical arilo como se ha ilustrado antes (que puede tener en el grupo arilo, de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alcoxi inferior sustituidos con halógeno), un grupo ariloxialquilo inferior que tiene un radical arilo y un radical alquilo inferior como se ha ilustrado antes (que puede tener en el grupo arilo, de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alcoxi inferior sustituidos con halógeno) y un grupo tetrahidroquinolilo (en el que puede estar presente un solo grupo oxo). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo

(1-, 2-, o 3-)pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- o 3-)hidroximetil-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)hidroximetil-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)hidroximetil-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- o 3-)carbamoil-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)carbamoil-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)carbamoil-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- o 3-)hidroxil-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)hidroxil-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)hidroxil-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- o 3-)amino-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- o 3-)acetamido-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)acetamido-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)acetamido-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)butirilamino-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)(N-metil-N-acetilamino)-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)(N-metil-N-butirilamino)-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)benzoilamino-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)(N-metil-N-benzoilamino)-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- o 3-)[(2-, 3-, o 4-)morfolinilmetil]-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)[(2-, 3-, o 4-)morfolinilmetil]-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)[(2-, 3-, o 4-)morfolinilmetil]-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- o 3-)[(1-, 2-, o 3-)pirrolidinilmetil]-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)[(1-, 2-, o 3-)pirrolidinilmetil]-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)[(1-, 2-, o 3-)pirrolidinilmetil]-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- o 3-)[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidilmetil]-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidilmetil]-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)[(1-, 2-, 3-, o 4-)piperidilmetil]-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- o 3-)(4-metil-1-piperazinilmetil)-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)(4-metil-1-piperazinilmetil)-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)(4-metil-1-piperazinilmetil)-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- o 3-)N,N-dimetilaminometil-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)N,N-dimetilaminometil-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)N,N-dietilaminometil-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)N,N-dietilaminometil-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)N,N-dietilaminometil-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)(4-trifluorometoxifenoxi)-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, o 5-)(4-trifluorometoxifenoxi)-3-pirrolidinilcarbonilo, y un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-) (2-oxi-1, 2, 3, 4-tetrahidroquinolil)-3-pirrolidinilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo piperazinilcarbonilo que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo alcanilo inferior, un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo aminoalquilo inferior (un grupo alquilo inferior puede estar presente en el grupo amino, como sustituyente), un grupo piperidilalquilo inferior (un grupo

alquilo inferior puede estar presente en el grupo piperidilo, como sustituyente), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior, un grupo tetrahidrofurilalquilo inferior, un grupo piridilalquilo inferior (un grupo fenilo puede estar presente en el grupo alquilo inferior como sustituyente), un grupo imidazolilalquilo inferior, un grupo furilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilcarbonilalquilo inferior, un grupo piperidilo que puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente, un grupo piridilo (un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciano, y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno puede estar presente en el grupo piridilo, como sustituyente), un grupo tieno[2,3-c]piridilo grupo arilo (en el que puede estar presente un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo aroilo, un grupo furilalquilo inferior, un grupo arilalcoxi(inferior)carbonilo y un grupo oxo, incluyen un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) sustituyentes, en el grupo piperazinilo, que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo cicloalquilo C₃-C₈ como se ha ilustrado antes;

un grupo alcanoil inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcanoil lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo hidroxialquilo inferior como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono con 1 a 3 grupos hidroxil);

un grupo alcoxi(inferior)alquilo inferior como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 3 grupos alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (grupos alcoxi lineales o ramificados que tiene de 1 a 6 átomos de carbono));

un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes;

un grupo aminoalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es como el ilustrado anteriormente, preferiblemente puede estar presente en el grupo amino, como sustituyente o sustituyentes un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono (de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono));

un grupo piperidilalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es como el ilustrado anteriormente, preferiblemente puede estar presente en el grupo piperidilo como sustituyente o sustituyentes un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono (de 1 a 3 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono));

un grupo morfolinilalquilo inferior cuyo radical alquilo es como el ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo pirrolidinilalquilo inferior cuyo radical alquilo es como el ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es como el ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono)

un grupo tetrahidrofurilalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es como el ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo piridilalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es como el ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) (pueden estar presentes de 1 a 3 grupos fenilo en el grupo alquilo, como sustituyente o sustituyentes);

un grupo imidazolilalquilo inferior, cuyo radical alquilo inferior es como el ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo furilalquilo inferior, cuyo radical alquilo inferior es como el ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo pirrolidinilcarbonilalquilo inferior, cuyo radical alquilo inferior es como el ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo piridilo (pueden estar presentes en el grupo piridilo de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un grupo ciano, y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con 1 a 7 átomo de halógeno)): un grupo tieno[2,3-c]piridilo; un grupo arilo como se ha ilustrado antes (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo aroilo como se ha ilustrado antes, un grupo furilalquilo inferior que tiene un radical alquilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo arilalcoxi(inferior)carbonilo que tiene un radical arilo y un radical alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes y un grupo oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1- o 2-)piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)etil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propil-1-piperazinilcarbonilo; (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)n-propil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)n-butil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-1[(1-etil-n-propil)]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[(1-etil-n-propil)]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)isopropil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)isopropil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)terc-butil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-,

o 4-)n-hexil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)n-hexil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)ciclopentil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)ciclopentil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)cicloheptil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)cicloheptil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)acetil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)butiril-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)acetil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-hidroxietil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(2-hidroxietil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-metoxietil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(2-metoxietil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-metoxipropil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(3-metoxipropil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(4-metoxibutil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(4-metoxibutil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etoxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)etoxicarbonil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butoxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)terc-butoxicarbonil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metoxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metoxicarbonil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[3-(N,N-dimetilamino)propil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[3-(N,N-dimetilamino)propil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(N,N-dimetilamino)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(N,N-dimetilamino)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-(1-piperidil)etil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(2-(1-piperidil)etil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(1-metil-3-piperidil)metil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[(1-metil-3-piperidil)metil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(1-metil-4-piperidil)metil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[(1-metil-4-piperidil)metil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(4-morfolinil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(4-morfolinil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(1-pirrolidinil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(1-pirrolidinil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(1,3-dioxolanil)metil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(1,3-dioxolanil)metil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(1,3-dioxolanil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(1,3-dioxolanil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-tetrahidrofurilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(2-tetrahidrofurilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-piridilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(2-piridilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-piridilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(3-piridilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(4-piridilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(4-piridilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(4-piridil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(4-piridil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(2-piridil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(2-piridil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-fenil-2-(4-piridil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-fenil-2-(4-piridil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(1-imidazolil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(1-imidazolil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-furilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(3-furilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1-pirrolidinilcarbonilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(1-pirrolidinilcarbonilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1-metil-4-piperidil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(1-metil-4-piperidil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)piridil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(2-, 3-, o 4-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-ciano-2-piridil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(3-ciano-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[4-metil-2-piridil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(4-metil-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-metil-2-piridil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(3-metil-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-trifluorometil-2-piridil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(3-trifluorometil-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)tieno[2,3-c]piridil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[(2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)tieno[2,3-c]piridil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)fenil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)clorofenil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)metilfenil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo 3-oxo-(2- o 4-)fenil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)benzoil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2- o 3-)furilcarbonil]-1-piperazinilcarbonilo, y un grupo (2-, 3-, o 4-)benciloxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo hexahidroazepinilcarbonilo incluyen un grupo (1-, 2-, 3- o 4-)hexahidroazepinilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo piridilo incluyen un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3, preferiblemente 1, sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) y un grupo piridilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (hexahidro-1,4-diazepin-(1-,2-, 5- o 6-)il)carbonilo, un grupo (4-metil-hexahidro-1,4-diazepin-1-il)carbonilo, y un grupo (4-(4-piridil)-metil-hexahidro-1,4-diazepin-1-il)carbonilo.

Los ejemplos del grupo dihidropirrolilcarbonilo incluyen un grupo 2,3-dihidropirrolilcarbonilo y un grupo 2,5-dihidropirrolilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo

dihidropirrolilcarbonilo como se ha ilustrado antes que puede tener de 1 a 4, preferiblemente de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 2- o 3-)(2,5-dihidropirrolilcarbonil), un grupo 2,5-dimetil-1-(2,5-dihidropirrolilcarbonil), y un grupo 2,5-dimetil-1-(2,3-dihidropirrolilcarbonil).

Los ejemplos del grupo tiomorfolinilcarbonilo incluyen un grupo (2-, 3- o 4-)tiomorfolinilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo morfolinilcarbonilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, y un grupo piperidilalquilo inferior, y un grupo arilo incluyen un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener de 1 a 5 grupos, más preferiblemente de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) (en los cuales pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos piperidilo) un grupo arilo como se ha descrito antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 3- o 4-)morfolinilcarbonilo, un grupo 2,6-dimetil-4-morfolinilcarbonilo, un grupo 2-(1-piperidilmetil)-4-morfolinilcarbonilo, y un grupo 2-fenil-4-morfolinilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo tiazolidinilcarbonilo incluyen un grupo (2-, 3-, 4- o 5-) tiazolidinilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener un grupo arilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo ciano incluyen un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) arilo grupos que pueden tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo ciano como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 3-, 4- o 5-)tiazolidinilcarbonilo, un grupo (2-, 4- o 5-)[(2-, 3- o 4-)metoxifenil]-3-tiazolidinilcarbonilo y un grupo (2-, 4- o 5-)[(2-, 3- o 4-)cianofenil]-3-tiazolidinilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo azabíciclo[3,2,2]nonilcarbonilo incluyen un grupo 1-azabíciclo[3,2,2]non-(2-, 3-, 5-, o 6-)ilcarbonilo, un grupo 2-azabíciclo[3,2,2]non-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6- o 7-)ilcarbonilo, un grupo 3-azabíciclo[3,2,2]non-(1-, 2-, 3-, o 6-)ilcarbonilo, un grupo y un grupo 6-azabíciclo[3,2,2]non-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- o 9-)ilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo azabíciclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener un grupo ariloxi sustituido con halógeno o insustituido incluyen un grupo azabíciclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos arilo sustituidos con halógeno como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo arilo que puede estar sustituido con 1 a 3, preferiblemente 1 átomo de halógeno), o un grupo azabíciclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos arilo insustituidos como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1-azabíciclo[3,2,1]oct-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)ilcarbonilo, un grupo 2-azabíciclo[3,2,1]oct-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)ilcarbonilo, un grupo 3-azabíciclo[3,2,1]oct-(1-, 2-, 3-, 6-, u 8-)ilcarbonilo, un grupo 6-azabíciclo[3,2,1]oct-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, o 8-)ilcarbonilo, un grupo 8-azabíciclo[3,2,1]oct-(1-, 2-, 3-, 6-, u 8-)ilcarbonilo, un grupo 3-(feniloxi)-1-azabíciclo[3,2,1]oct-2-ilcarbonilo, un grupo 3-(2-bifeniloxi)-1-azabíciclo[3,2,1]oct-3-ilcarbonilo, un grupo 3-(1-naftiloxi)-1-azabíciclo[3,2,1]oct-4-ilcarbonilo, un grupo 3-(3-metilfeniloxi)-1-azabíciclo[3,2,1]oct-5-ilcarbonilo, un grupo 3-(4-etilfeniloxi)-1-azabíciclo[3,2,1]oct-6-ilcarbonilo, un grupo 3-(2-n-propilfeniloxi)-1-azabíciclo[3,2,1]oct-7-ilcarbonilo, un grupo 3-(3-n-butilfeniloxi)-1-azabíciclo[3,2,1]oct-8-ilcarbonilo, un grupo 3-(4-n-pentilfeniloxi)-2-azabíciclo[3,2,1]oct-1-ilcarbonilo, un grupo 3-(2-n-hexilfeniloxi)-2-azabíciclo[3,2,1]oct-2-ilcarbonilo, un grupo 3-(3-isobutilfeniloxi)-2-azabíciclo[3,2,1]oct-3-ilcarbonilo, un grupo 3-(4-terc-butilfeniloxi)-2-azabíciclo[3,2,1]oct-4-ilcarbonilo, un grupo 3-(2-clorofeniloxi)-2-azabíciclo[3,2,1]oct-5-ilcarbonilo, un grupo 3-(3-fluorofeniloxi)-8-aza-bíciclo[3,2,1]oct-8-ilcarbonilo, un grupo 3-(3-bromofeniloxi)-2-azabíciclo[3,2,1]oct-6-ilcarbonilo, un grupo 3-(2-aminofeniloxi)-2-azabíciclo[3,2,1]oct-7-ilcarbonilo, un grupo 3-(2,3-dimetilfeniloxi)-2-azabíciclo[3,2,1]oct-8-ilcarbonilo, un grupo 3-(3,4,5-trimetilfeniloxi)-8-azabíciclo[3,2,1]oct-1-ilcarbonilo, y un grupo 3-(2,3-diaminofeniloxi)-8-azabíciclo[3,2,1]oct-2-ilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo indolinilcarbonilo incluyen un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, o 7-)indolinilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo tetrahidropirido[3,4-b]indolilcarbonilo incluyen un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- o 9-)(2-, 3-, 4-, 9-tetrahidropirido[3,4-b]indolilcarbonilo).

Los ejemplos del grupo piperazinilalquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior en el grupo piperazinilo incluyen un grupo piperazinilalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) y pueden estar presentes en el grupo piperazinilo de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente 1, grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1- o 2-)piperazinilmetilo, un grupo 2-[(1- o 2-)piperazinil]etilo, un grupo 1-[(1- o 2-)piperazinil]etilo, un grupo 3-[(1- o 2-)piperazinil]propilo, un grupo 4-[(1- o 2-)piperazinil]butilo, un grupo 5-[(1- o 2-)piperazinil]pentilo, un grupo 6-[(1- o 2-)piperazinil]hexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(1- o 2-)piperazinil]etilo, un grupo 2-metil-3-[(1- o 2-)piperazinil]propilo, un grupo 4-metil-1-piperazinilmetilo, un grupo 2-(4-metil-2-piperazinil)etilo, un grupo 3-(2-etil-1 piperazinil)propilo, un grupo 4-(3-n-propil-1-piperazinil)butilo, un grupo 5-(4-n-butil-1-piperazinil)pentilo, un grupo 6-(1-n-pentil-2-piperazinil)hexilo, un grupo 2-n-hexil-2-piperazinilmetilo, un grupo 2-(3-

isobutil-2-piperazinil)etilo, y un grupo 3-(4-terc-butil-2-piperazinil)propilo.

Los ejemplos del grupo morfolinilcarbonilalquilo inferior incluyen un grupo morfolinilcarbonilalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-morfolinilcarbonilmetilo, un grupo 3-morfolinil-carbonilmetilo, un grupo 4-morfolinilcarbonilmetilo, un grupo 2-(2-morfolinilcarbonil)etilo, un grupo 2-(3-morfolinilcarbonil)etilo, un grupo 2-(4-morfolinil-carbonil)etilo, un grupo 1-(2-morfolinilcarbonil)etilo, un grupo 1-(3-morfolinilcarbonil)etilo, un grupo 1-(4-morfolinilcarbonil)etilo, un grupo 3-(2-morfolinil-carbonil)propilo, un grupo 3-(3-morfolinil-carbonil)propilo, un grupo 3-(4-morfolinil-carbonil)propilo, un grupo 4-(2-morfolinil-carbonil)butilo, un grupo 4-(3-morfolinilcarbonil)butilo, un grupo 4-(4-morfolinilcarbonil)butilo, un grupo 5-(2-morfolinilcarbonil)pentilo, un grupo 5-(3-morfolinil-carbonil)pentilo, un grupo 5-(4-morfolinil-carbonil)pentilo, un grupo 6-(2-morfolinil-carbonil)hexilo, un grupo 6-(3-morfolinilcarbonil)hexilo, un grupo 6-(4-morfolinilcarbonil)hexilo, un grupo 3-metil-3-(2-morfolinilcarbonil)propilo, un grupo 3-metil-3-(3-morfolinilcarbonil)propilo, un grupo 3-metil-3-(4-morfolinilcarbonil)propilo, un grupo 1,1-dimetil-2-(2-morfolinilcarbonil)etilo, un grupo 1,1-dimetil-2-(3-morfolinilcarbonil)etilo, y un grupo 1,1-dimetil-2-(4-morfolinilcarbonil)etilo.

Los ejemplos del grupo piperazinilcarbonilalquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior en el grupo piperazinilo incluyen un grupo piperazinilcarbonilalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) y que puede tener de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente 1, grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo piperazinilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1- o 2-)piperazinilcarbonilmetilo, un grupo 2-[(1- o 2-)piperazinilcarbonil]etilo, un grupo 1-[(1- o 2-)piperazinilcarbonil]etilo, un grupo 3-[(1- o 2-)piperazinilcarbonil]propilo, un grupo 4-[(1- o 2-)piperazinilcarbonil]butilo, un grupo 5-[(1- o 2-)piperazinilcarbonil]pentilo, un grupo 6-[(1- o 2-)piperazinilcarbonil]hexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-(1- o 2-)piperazinilcarbonil]etilo, un grupo 2-metil-3-[(1- o 2-)piperazinilcarbonil]propilo, un grupo 4-metil-1-piperazinilcarbonilmetilo, un grupo 2-(4-metil-2-piperazinilcarbonil)etilo, un grupo 3-(2-etil-1-piperazinilcarbonil)propilo, un grupo 4-(3-n-propil-1-piperazinilcarbonil)butilo, un grupo 5-(4-n-butil-1-piperazinilcarbonil)pentilo, un grupo 6-(1-n-pentil-2-piperazinilcarbonil)hexilo, un grupo 2-n-hexil-2-piperazinilcarbonilmetilo, un grupo 2-(3-isobutil-2-piperazinilcarbonil)etilo, y un grupo 3-(4-terc-butil-2-piperazinilcarbonil)propilo.

Los ejemplos del grupo aminoalcoxi inferior (en el grupo amino, puede estar presente un grupo alquilo inferior) incluyen un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 5 (preferiblemente 1) grupos amino que pueden tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo aminometoxi, un grupo 2-aminoetoxi, un grupo 1-aminoetoxi, un grupo 3-aminopropoxi, un grupo 4-aminobutoxi, un grupo 5-aminopentoxi, un grupo 6-aminohexiloxi, un grupo 1,1-dimetil-2-aminoetoxi, un grupo N,N-dimetilaminometoxi, un grupo N-metil-N-etilaminometoxi, un grupo N-metilaminometoxi, un grupo 2-(N-metilamino)etoxi, un grupo 2-(N,N-dimetilamino)etoxi, un grupo 2-(N,N-diisopropilamino)etoxi y un grupo 3-(N,N-dimetilamino)propoxi.

Los ejemplos del grupo alcoxi(inferior)alcoxi inferior incluyen un grupo alcoxi(inferior)alcoxi inferior que tiene un radical alcoxi inferior como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metoximetoxi, un grupo 2-metoxietoxi, un grupo 1-etoxietoxi, un grupo 2-etoxietoxi, un grupo 2-isobutoxietoxi, un grupo 2,2-dimetoxietoxi y un grupo 2-metoxi-1-metiletox.

Los ejemplos del grupo piperazinilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo incluyen un grupo piperazinilo que puede tener un grupo de 1 a 3 (de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1- o 2-)piperazinilo, un grupo (2-, 3- o 4-)metil-1-piperazinilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- o 6-)etil-2-piperazinilo, un grupo (2-, 3- o 4-)etil-1-piperazinilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- o 6-)etil-2-piperazinilo, un grupo (2-, 3- o 4-)n-propil-1-piperazinilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- o 6-)n-propil-2-piperazinilo, un grupo (2-, 3- o 4-)formil-1-piperazinilo, un grupo (2-, 3- o 4-)acetil-1-piperazinilo, un grupo (2-, 3- o 4-)propionil-1-piperazinilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- o 6-)propionil-2-piperazinilo, un grupo (2-, 3- o 4-)butiril-1-piperazinilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- o 6-)butiril-2-piperazinilo, un grupo (2-, 3- o 4-)metoxycarbonil-1-piperazinilo, un grupo (2-, 3- o 4-)etoxycarbonil-1-piperazinilo, un grupo (2-, 3- o 4-)terc-butoxycarbonil-1-piperazinilo, un grupo (2- o 3-)oxo-1-piperazinilo, un grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5- o 6-)acetil-1-piperazinilo, un grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5- o 6-)butiril-1-piperazinilo, un grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5- o 6-)metoxycarbonil-1-piperazinilo y un grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5- o 6-)metoxycarbonil-1-piperazinilo.

Los ejemplos del grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanilcarbonilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo arilo incluyen un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo arilo como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanil-(1, 2, 3, 4 u 8-)ilcarbonilo,

un grupo 1-fenil-1,3,8-triazaespiro[4,5]decanil-8-ilcarbonilo y un grupo 1-fenil-4-oxo-1,3,8-triazaespiro[4,5]decanil-8-ilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo tetrahidropiridilo incluyen un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- o 6-)-1,2,3,4-tetrahidropiridilo y un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- o 6-)-1,2,3,6-tetrahidropiridilo.

Los ejemplos del grupo tetrahidropiridilcarbonilo que puede tener un grupo piridilo incluyen un grupo tetrahidropiridilcarbonilo como se ha ilustrado antes que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos piridilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 3- o 4-)piridil-1,2,3,6-tetrahidropiridil-1-ilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener un grupo tioxo incluyen un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos tioxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-tioxo-1-imidazolidinilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo tetrahidronaftilo incluyen un grupo (1- o 2-)-1,2,3,4-tetrahidronaftilo.

Los ejemplos del grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre incluyen grupos heteromonocíclicos representados por los apartados (1) a (9) siguientes.

- (1) un grupo heteromonocíclico de 3 a 8 (preferiblemente de 5 a 6) miembros saturado que tiene de 1 a 4 (preferiblemente de 1 a 2) átomos de nitrógeno (por ejemplo, un grupo pirrolidinilo, un grupo imidazolidinilo, un grupo piperidilo, un grupo hexahidropirimidinilo, un grupo piperazinilo, un grupo azepanilo y un grupo azocanilo);
- (2) un grupo heteromonocíclico de 3 a 8 (preferiblemente de 5 a 6) miembros insaturado que tiene de 1 a 4 (preferiblemente de 1 a 3) átomos de nitrógeno, por ejemplo, un grupo pirrolilo, un grupo dihidropirrolilo tal como un grupo 1H-2,5-dihidropirrolilo, un grupo imidazolilo (tal como un grupo 1H-imidazolilo grupo), un grupo dihidroimidazolilo (tal como un grupo 1H-2,3-dihidroimidazolilo), un grupo triazolilo (tal como un grupo 9H-1,2,4-triazolilo, un grupo 1H-1,2,3-triazolilo, y un grupo 2H-1,2,3-triazolilo), un grupo dihidrotriazolilo (tal como un grupo 1H-4,5-dihidro-1,2,4-triazolilo), un grupo pirazolilo, un grupo piridilo, un grupo dihidropiridilo (tal como un grupo 1,2-dihidropiridilo), un grupo pirimidinilo, un grupo dihidropirimidinilo (tal como un grupo 1,6-dihidropirimidinilo), un grupo pirazinilo, un grupo dihidropirazinilo (tal como 1,2-dihidropirazinilo), un grupo piridazinilo, y un grupo tetrazolilo (tal como un grupo 1H-tetrazolilo y un grupo 2H-tetrazolilo);
- (3) un grupo heteromonocíclico de 3 a 8 (preferiblemente de 5 a 6) miembros insaturado que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) átomos de oxígeno y de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) átomos de nitrógeno, por ejemplo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo oxadiazolilo (tal como un grupo 1,2,4-oxadiazolilo, un grupo 1,3,4-oxadiazolilo y un grupo 1,2,5-oxadiazolilo) y un grupo heteromonocíclico de 3 a 8 (preferiblemente de 5 a 6) miembros saturado que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) átomos de oxígeno y de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) átomos de nitrógeno, por ejemplo un grupo oxazolidinilo, un grupo isoxazolidinilo y un grupo morfolinilo;
- (4) un grupo heteromonocíclico de 3 a 8 (preferiblemente de 5) miembros insaturado que tiene de 1 a 2 átomos de azufre y de 1 a 3 átomos de nitrógeno, por ejemplo, un grupo tiazolilo, un grupo dihidrotiazolilo (tal como un grupo 2,3-dihidrotiazolilo), un grupo isotiazolilo, un grupo tiadiazolilo (tal como, un grupo 1,2,3-tiadiazolilo, un grupo 1,2,4-tiadiazolilo, un grupo 1,3,4-tiadiazolilo, y un grupo 1,2,5-tiadiazolilo) y un grupo dihidrotiazinilo.
- (5) un grupo heteromonocíclico de 3 a 8 (preferiblemente de 5 a 6) miembros saturado que tiene de 1 a 2 átomos de azufre y de 1 a 3 átomos de nitrógeno, por ejemplo, un grupo tiazolidinilo;
- (6) un grupo heteromonocíclico de 3 a 8 (preferiblemente de 5 a 6) miembros saturado que tiene de 1 a 2 átomos de oxígeno, por ejemplo, un grupo tetrahidrofurilo y un grupo tetrahidropiranilo;
- (7) un grupo heteromonocíclico de 3 a 8 (preferiblemente de 5 a 6) miembros insaturado que tiene de 1 a 2 átomos de oxígeno, por ejemplo, un grupo piranilo (tal como un grupo 2H-piranilo);
- (8) un grupo heteromonocíclico de 3 a 8 (preferiblemente de 5 a 6) miembros saturado que tiene de 1 a 2 átomos de azufre, por ejemplo, un grupotetrahidrotiofurilo y un grupo tetrahidrotiopiranilo; y
- (9) un grupo heteromonocíclico de 3 a 8 (preferiblemente de 5 a 6) miembros insaturado que tiene de 1 a 2 átomos de azufre, por ejemplo, un grupo tienilo y un grupo tiopiranilo (tal como 2H-tiopiranilo).

De ellos, se puede hacer mención preferiblemente de un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 2 heteroátomos seleccionados entre un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre y seleccionados del grupo que consiste en un grupo pirrolidinilo, un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo, un grupo pirazinilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo piranilo y un grupo tienilo; y constituidos preferiblemente adicionalmente de un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 2 átomos de nitrógeno y seleccionados del grupo de un grupo pirrolidinilo, un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo y un grupo tiazolilo.

Los ejemplos del grupo tetrahydroquinoxalinilo incluyen un grupo (1-, 2-, 5- o 6-)-1,2,3,4-tetrahydroquinoxalinilo y un grupo (1-, 2-, 5- o 6-)-5,6,7,8-tetrahydroquinoxalinilo.

5 Los ejemplos del grupo tetrahydroquinazolinilo incluyen un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)-1,2,3,4-tetrahydroquinazolinilo y un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)-5,6,7,8-tetrahydroquinazolinilo.

Los ejemplos del grupo dihydroquinazolinilo incluyen un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-) -3, 4-dihydroquinazolinilo y un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)-1,2-dihydroquinazolinilo.

10 Los ejemplos del grupo dihydrobenzimidazolilo incluyen un grupo (1-, 2-, 4- o 5-)-2,3-dihidro-1H-benzimidazolilo.

Los ejemplos del grupo tetrahydrobenzazepinilo incluyen un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- o 9-)-2,3,4,5-tetrahydro-1H-benzo[b]azepinilo y un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- o 9-)-2,3,4,5-tetrahydro-1H-benzo[c]azepinilo.

15 Los ejemplos del grupo tetrahydrobenzodiazepinilo incluyen un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- o 9-)-2,3,4,5-tetrahydro-1H-benzo[b][1,4]diazepinilo y un grupo (1-, 2-, 3-, 4- 5-, 6-, 7-, 8- o 9-)-2,3,4,5-tetrahydro-1H-benzo[e][1,4]diazepinilo.

20 Los ejemplos del grupo hexahydrobenzazocinilo incluyen un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 9-, o 10-)-1,2,3,4,5,6-tetrahydrobenzo[b]azocinilo y un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 9- o 10-)-1, 2, 3, 4, 5, 6-hexahydrobenzo[c]azocinilo.

Los ejemplos del grupo dihydrobenzoxazinilo incluyen un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)-3,4-dihidro-2H-benzo[b][1,4]oxazinilo y un grupo (1-, 2-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)-2,4-dihidro-1H-benzo[d][1,3]oxazinilo.

25 Los ejemplos del grupo dihydrobenzoxazolilo incluyen un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6- o 7-)-2,3-dihydrobenzoxazolilo.

Los ejemplos del grupo benzisoxazolilo incluyen un grupo (3-, 4-, 5-, 6- o 7-)-benzo[d]-isoxazolilo y un grupo (3-, 4-, 5-, 6- o 7-)-benzo[c]-isoxazolilo.

30 Los ejemplos del grupo benzoxadiazolilo incluyen un grupo (4- o 5-)-benzo[c][1,2,5]oxadiazolilo.

Los ejemplos del grupo tetrahydrobenzoxazepinilo incluyen un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- o 9-)-2,3,4,5-tetrahydrobenzo[b][1,4]oxazepinilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- o 9-)-1,3,4,5-tetrahydrobenzo[e][1,3]oxazepinilo y un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- o 9-)-2,3,4,5-tetrahydrobenzo[f][1,4]oxazepinilo.

35 Los ejemplos del grupo dihydrobenzotiazinilo incluyen un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)-3,4-dihidro-2H-benzo[b][1,4]tiazinilo y un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)-3,4-dihidro-2H-benzo[e][1,3]tiazinilo.

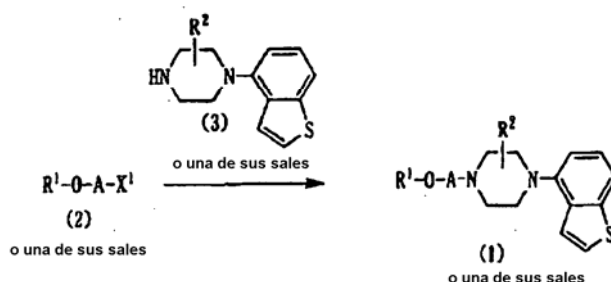
40 Los ejemplos del grupo benzoxatiolilo incluyen un grupo (2-, 4-, 5-, 6- o 7-)-benzo[d][1,3]oxatiolilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6- o 7-)-3H-benzo[c][1,2]oxatiolilo y, un grupo (3-, 4-, 5-, 6- o 7-)-3H-benzo[d][1,2]oxatiolilo.

Los ejemplos del grupo dihydrobenzofurilo incluyen un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6- o 7-)-2,3-dihydrobenzofurilo.

45 Un compuesto heterocíclico (referido más adelante como un compuesto (1)) representado por la fórmula general (1) se puede producir mediante varias clases de métodos, por ejemplo, un método mostrado en la fórmula de reacción 1 o fórmula de reacción 2 siguientes.

[Fórmula 4]

Fórmula de Reacción 1



donde R^1 , R^2 y A son los mismos que se han definido antes; y X^1 es un átomo de halógeno o un grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno.

5 Los ejemplos del grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno incluyen un grupo alcano(inferior)sulfonilo, un grupo arilsulfonilo, y un grupo aralkilsulfonilo.

El átomo de halógeno representado por X^1 en la fórmula general (2) es un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

10 Los ejemplos específicos del grupo alcano(inferior)sulfonilo representado por X^1 incluyen un grupo alcanosulfonilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tal como un grupo metanosulfonilo etanosulfonilo, un grupo isopropanosulfonilo, un grupo n-propanosulfonilo, un grupo n-butanosulfonilo, un grupo terc-butanosulfonilo, un grupo n-pentanosulfonilo, y un grupo n-hexanosulfonilo.

15 Los ejemplos específicos del grupo arilsulfonilo representado por X^1 incluyen un grupo fenilsulfonilo y un grupo naftilsulfonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo nitro, y un átomo de halógeno, en el anillo de fenilo. Los ejemplos específicos del grupo fenilsulfonilo que puede tener un sustituyente incluyen un grupo fenilsulfonilo, un grupo 4-metilfenilsulfonilo, un grupo 2-metilfenilsulfonilo, un grupo 4-nitrofenilsulfonilo, un grupo 4-metoxifenilsulfonilo, un grupo 2-nitrofenilsulfonilo, y un grupo 3-clorofenilsulfonilo. Los ejemplos específicos del grupo naftilsulfonilo incluyen un grupo α -naftilsulfonilo y un grupo β -naftilsulfonilo.

25 Los ejemplos del grupo aralkilsulfonilo representado por X^1 incluyen un grupo alquilsulfonilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y sustituido con un grupo fenilo; y un grupo alquilsulfonilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y sustituido con un grupo naftilo; ambos los cuales pueden tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo nitro y un átomo de halógeno, en el anillo de fenilo.

30 Los ejemplos específicos del grupo alquilsulfonilo sustituido con un grupo fenilo como se ha mencionado antes incluyen un grupo bencilsulfonilo, un grupo 2-feniletilsulfonilo, un grupo 4-fenilbutilsulfonilo, un grupo 2-metilbencilsulfonilo, un grupo 4-metoxibencilsulfonilo, un grupo 4-nitrobencilsulfonilo, y un grupo 3-clorobencilsulfonilo. Los ejemplos específicos del grupo alquilsulfonilo sustituido con un grupo naftilo incluyen un grupo α -naftilmetilsulfonilo y un grupo β -naftilmetilsulfonilo.

35 El compuesto (1) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto (referido más adelante como un compuesto (2)) representado por la fórmula general (2) y un compuesto (referido más adelante como un compuesto (3)) representado por la fórmula general (3).

40 Esta reacción se realiza generalmente en un disolvente convencional que no puede afectar negativamente a la reacción, tal como agua; un disolvente con una base alcohólica tal como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoroetanol, y etilenglicol; un disolvente con una base cetónica tal como acetona y metiletilcetona; un disolvente con una base éterica tal como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico, y diglima; un disolvente con una base de éster tal como acetato de metilo y acetato de etilo; un disolvente polar no protónico tal como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida, y dimetilsulfóxido; un disolvente con una base de hidrocarburo halogenado tal como cloruro de metileno y cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, la reacción se puede realizar en una mezcla disolvente de estos disolventes convencionales. La reacción se realiza generalmente en presencia de una base inorgánica tal como un metal alcalino (p. ej., sodio y potasio), un hidrogenocarbonato de metal alcalino (p. ej., hidrogenocarbonato de litio, hidrogenocarbonato de sodio, e hidrogenocarbonato de potasio), hidróxido de metal alcalino (p. ej., hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, e hidróxido de cesio), carbonato de metal alcalino (p. ej., carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, y carbonato de cesio), alcóxido inferior de metal alcalino (p. ej., metóxido de sodio y etóxido de sodio), y un hidruro (p. ej., hidruro de sodio e hidruro de potasio); o en presencia de una base orgánica tal como una trialkilamina (p. ej., trimetilamina, trietilamina, N-etildisopropilamina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilalanina, N-metilmorfolina, 1,5-diazabicyclo[4,3,0]non-5-eno (DEN), 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano (DABCO), y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undeceno-7 (DBU). Cuando estas bases adoptan forma líquida, se pueden utilizar como disolventes.

Estos compuestos alcalinos se pueden utilizar solos o en una mezcla de dos tipos o más.

60 Un compuesto alcalino se puede utilizar en una cantidad molar, que es generalmente 0,5 a 10 veces, preferiblemente 0,5 a 6 veces tan grande como la del compuesto (2).

La reacción mencionada anteriormente se puede realizar, si fuera necesario, con la adición de un yoduro de metal

alcalino que sirve como acelerador, tal como yoduro de potasio y yoduro de sodio.

La razón de un compuesto (2) con respecto a compuesto (3) utilizada en la fórmula de reacción 1 puede ser al menos de aproximadamente 0,5 veces en moles, preferiblemente de aproximadamente 0,5-5 veces en moles.

5 La temperatura de reacción no está limitada particularmente y se puede realizar generalmente en condiciones de refrigeración o calentamiento y preferiblemente se realiza una temperatura de casi la temperatura ambiente a aproximadamente 150°C durante 1 a 30 horas.

10 El compuesto (2) que sirve como sustancia de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención incluye un compuesto novedoso y se puede producir mediante diferentes métodos, por ejemplo, un método representado por la siguiente fórmula de reacción 3.

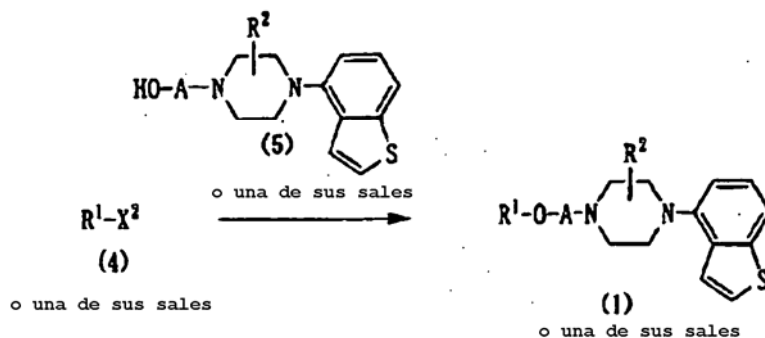
15 El compuesto (3) que sirve como sustancia de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención es un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

20 Se puede utilizar una sal de un compuesto (2) en lugar del compuesto (2) y una sal de un compuesto (3) en lugar del compuesto (3). Las sales de los compuestos (2) y (3) incluyen sales de adición de ácido. Estas sales de adición de ácido se pueden preparar haciendo reaccionar un ácido farmacéuticamente aceptable con un compuesto (2) o (3). Los ejemplos del ácido utilizado en la presente memoria incluyen ácidos inorgánicos tales como ácido sulfúrico, ácido nítrico, ácido clorhídrico, ácido fosfórico, y ácido bromhídrico; ácidos sulfónicos tales como ácido p-toluenosulfónico, ácido metanosulfónico, y ácido etanosulfónico; y ácidos orgánicos tales como ácido acético, ácido oxálico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido málico, ácido tartárico, ácido cítrico, ácido succínico, y ácido benzoico.

25 De los compuestos (2), un compuesto que tiene un grupo ácido puede producir fácilmente una sal haciéndolo reaccionar con un compuesto alcalino farmacéuticamente aceptable. Los ejemplos de tal compuesto alcalino incluyen hidróxidos metálicos tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de litio, e hidróxido de calcio; carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos tales como carbonato de sodio, hidrogenocarbonato de sodio, hidrogenocarbonato de potasio; y alcoholatos de metales alcalinos tales como metilato de sodio y etilato de potasio.

[Fórmula 5]

Fórmula de reacción 2



30 donde R^1 , R^2 y A son los mismos que se han definido antes; y X^2 es un grupo hidroxilo, un átomo de halógeno o un grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno.

35 Los ejemplos del átomo de halógeno representado por X^2 y el grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno en relación con la fórmula general (4) son los mismos que se han mencionado antes. El compuesto (1) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto (referido más adelante como un compuesto (4)) representado por la fórmula general (4) y un compuesto (referido más adelante como un "compuesto (5)") representado por la fórmula general (5).

40 La reacción se puede realizar en condiciones similares a las de la fórmula de reacción 1,

En el caso de un compuesto (4) donde X^2 es un grupo hidroxilo, la reacción se puede realizar en un disolvente apropiado en presencia de un agente condensante apropiado.

45 Esta reacción se realiza generalmente en un disolvente convencional que no puede afectar negativamente a la reacción, tal como agua; un disolvente con una base alcohólica tal como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol,

trifluoroetanol, y etilenglicol; un disolvente con una base cetónica tal como acetona y metiletilcetona; un disolvente con una base etérica tal como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico, y diglima; un disolvente con una base de éster tal como acetato de metilo y acetato de etilo; un disolvente polar no protónico tal como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida, y dimetilsulfóxido; un disolvente con una base de hidrocarburo halogenado tal como cloruro de metileno y cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, como disolvente que se va a utilizar en la presente memoria, se puede mencionar una mezcla disolvente de estos disolventes convencionales.

En cuanto al agente condensante, se puede mencionar una mezcla de un azocarboxilato tal como azodicarboxilato de dietilo y un compuesto de fosfina tal como trifenilfosfina.

La cantidad del agente condensante utilizado en la presente memoria es generalmente al menos equimolar, preferiblemente de equimolar a dos veces más grande que el de un compuesto (4).

La razón de un compuesto (4) con respecto al compuesto (5) utilizada la fórmula de reacción 2 puede ser generalmente al menos equimolar preferiblemente aproximadamente 2 veces en moles.

La temperatura de reacción no está limitada particularmente y se puede realizar generalmente en condiciones de refrigeración o calentamiento, y preferiblemente se realiza a una temperatura de 0°C a aproximadamente 150°C durante 1 a 10 horas.

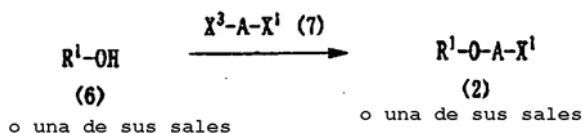
El compuesto (4) que sirve como sustancia de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención es un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

El compuesto (5) que sirve como sustancia de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención incluye un compuesto novedoso y un compuesto que se puede producir mediante diferentes métodos, por ejemplo, un método representado por la siguiente fórmula de reacción 4 o 5.

Se pueden utilizar una sal de un compuesto (4) en lugar del compuesto (4) y una sal de un compuesto (5) en lugar del compuesto (5). En cuanto a la sal preferible de un compuesto (4), se puede mencionar la misma sal que se ha mostrado en un compuesto (2). En cuanto a la sal preferible de un compuesto (5), se puede mencionar la misma sal que se ha mostrado en un compuesto (3).

[Fórmula 6]

Fórmula de reacción 3



donde R¹, X¹ y A son los mismos que se han definido antes; y X³ es un átomo de halógeno o un grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno.

Los ejemplos del átomo de halógeno representado por X³ y el grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno en relación con la fórmula general (7) son los mismos que se han mencionado antes.

El compuesto (2) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto (referido más adelante como un compuesto (6)) representado por la fórmula general (6) y un compuesto (referido más adelante como un compuesto (7)) representado por la fórmula general (7).

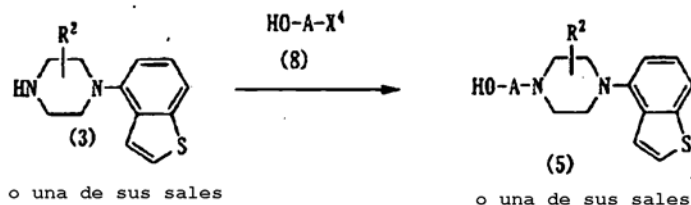
La reacción se puede realizar en condiciones similares a las de la fórmula de reacción 1.

Los compuestos (6) y (7) que sirven como sustancias de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención son compuestos conocidos o compuestos que se puede producir fácilmente a partir de compuestos conocidos.

En lugar de un compuesto (6), se puede utilizar una sal del compuesto (6). En cuanto a la sal preferible de un compuesto (6), se puede mencionar la misma sal que se ha mostrado en un compuesto (2).

[Fórmula 7]

Fórmula de reacción 4



donde R^2 y A son los mismos que se han definido antes; y X^4 es un átomo de halógeno o un grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno.

5 Los ejemplos del átomo de halógeno representado por X^4 y el grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno en relación con la fórmula general (8) son los mismos que se han mencionado antes.

El compuesto (5) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto (3) y un compuesto (referido más adelante como un compuesto (8)) representado por la fórmula general (8).

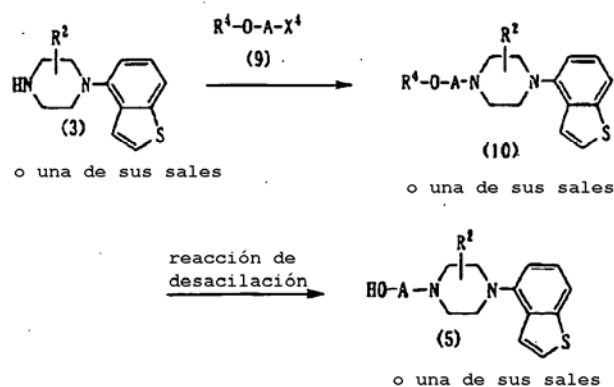
La reacción se puede realizar en condiciones similares a las de la fórmula de reacción 1.

El compuesto (8) que sirve como sustancia de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención es un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

En lugar de un compuesto (3), se puede utilizar una sal del compuesto (3). En cuanto a la sal preferible de un compuesto (3), se pueden mencionar las mismas sales que antes.

[Fórmula 8]

Fórmula de reacción 5



20 donde R^2 y A son los mismos que se han definido antes; R^4 es un grupo alcanoilo inferior; y X^4 es un átomo de halógeno o un grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno.

Los ejemplos del grupo alcanilo inferior representado por R^4 en las fórmulas generales (9) y (10) son los mismos que se han mencionado antes.

Además, los ejemplos del átomo de halógeno representado por X^4 y el grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno en relación con la fórmula general (9) son los mismos que se han mencionado antes.

30 Un compuesto (referido más adelante como un compuesto (10)) representado por la fórmula general (10) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto (3) y un compuesto (9).

La reacción se puede realizar en condiciones similares a las de la fórmula de reacción 1.

El compuesto (9) que sirve como sustancia de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención es un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

En lugar de un compuesto (3), se puede utilizar una sal del compuesto (3). En cuanto a la sal preferible de un compuesto (3), se pueden mencionar las mismas sales que antes.

Con posterioridad, el compuesto (10) se somete a una reacción para eliminar un grupo acilo para producir un compuesto (5).

Como método de reacción preferible, se puede mencionar una reacción convencional tal como la hidrólisis. La reacción de hidrólisis se puede realizar preferiblemente en presencia de una base o un ácido incluyendo un ácido de Lewis. Los ejemplos de la base preferible incluyen sales inorgánicas tales como un metal alcalino (p. ej., sodio y potasio), un hidrogenocarbonato de metal alcalino (p. ej., hidrogenocarbonato de litio, hidrogenocarbonato de sodio, e hidrogenocarbonato de potasio), un hidróxido de metal alcalino (p. ej., hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, e hidróxido de cesio), un carbonato de metal alcalino (p. ej., carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, y carbonato de cesio), un alcóxido inferior de metal alcalino (p. ej., metóxido de sodio y etóxido de sodio), e hidruros (p. ej., hidruro de sodio e hidruro de potasio); y bases orgánicas tales como una trialkilamina (p. ej., trimetilamina, trietilamina, y N-etildisopropilamina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilanilina, N-metilmorfolina, DBN, DABCO, y DBU. Como ácido preferible, se puede hacer mención a ácidos orgánicos (tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido tricloroacético, ácido trifluoroacético) y ácidos inorgánicos (tales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, cloruro de hidrógeno, y bromuro de hidrógeno). La reacción de eliminación utilizando un ácido de Lewis tal como un ácido trihaloacético (p. ej., ácido tricloroacético y ácido trifluoroacético) se puede realizar preferiblemente en presencia de un agente captador de cationes (p. ej., anisol y fenol).

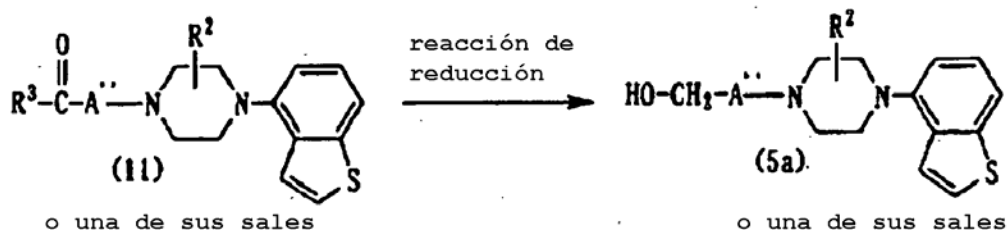
Esta reacción se realiza generalmente en un disolvente convencional que no puede afectar negativamente a la reacción, tal como agua; un disolvente con una base alcohólica tal como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoroetanol, y etilenglicol; un disolvente con una base cetónica tal como acetona y metiletilcetona; un disolvente con una base etérica tal como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico, y diglima; un disolvente con una base de éster tal como acetato de metilo y acetato de etilo; un disolvente polar no protónico tal como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida, y dimetilsulfóxido; un disolvente con una base de hidrocarburo halogenado tal como cloruro de metileno y cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, la reacción se puede realizar en una mezcla disolvente de estos disolventes convencionales. Entre ellos, es preferible el etanol. La temperatura de reacción no está limitada particularmente y se puede realizar generalmente en condiciones de refrigeración o calentamiento, y preferiblemente realizar de cerca de la temperatura ambiente a cerca del punto de ebullición del disolvente que se vaya a utilizar durante 0,5 a 75 horas.

En lugar del compuesto (10), se puede utilizar una sal del compuesto (10). En cuanto a la sal preferible de un compuesto (10), se puede mencionar la misma sal que se ha mostrado en un compuesto (3).

Además, un compuesto (referido más adelante como un compuesto (5a)) donde A del compuesto (5) representa $-\text{CH}_2\text{A}-$ donde A" representa un grupo alquileo C_1 a C_5 se puede producir mediante un método representado por la siguiente fórmula de reacción 6.

[Fórmula 9]

Fórmula de reacción 6



donde R^2 es el mismo que se ha definido antes; y R^3 es un grupo alcoxi inferior. A" representa un grupo alquileo C_1 a C_5 . El grupo alcoxi inferior representado por R^3 en la fórmula general (11) es el mismo que se ha definido antes. Los ejemplos del grupo alquileo C_1 a C_5 representado por A" en las fórmulas generales (11) y (5a) incluyen un grupo alquileo lineal o ramificado que tiene de 1 a 5 átomos de carbono tal como metileno, etileno, metilmetileno,

trimetileno, tetrametileno, 1-metiltrimetileno, 2-metiltrimetileno, 3-metiltetrametileno, pentametileno, y 2,2-dimetiltrimetileno.

5 representado por la fórmula general (11) a una reacción de reducción.

La reacción se puede realizar mediante el método mostrado en el Ejemplo de Referencia 6 o un método similar al mismo. La reacción también se puede realizar mediante un método convencional utilizando un agente reductor.

10 Como agente reductor preferible, se puede mencionar un hidruro (tal como hidruro de litio y aluminio, borohidruro de sodio, borohidruro de litio, diborano, y cianoborohidruro de sodio).

15 trifluoroetano, y etilenglicol; un disolvente con una base cetónica tal como acetona y metiletilcetona; un disolvente con una base etérica tal como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico, y diglima; un disolvente con una base de éster tal como acetato de metilo y acetato de etilo; un disolvente polar no protónico tal como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida, y dimetilsulfóxido; un disolvente con una base de hidrocarburo halogenado tal como cloruro de metileno y cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, la reacción se puede realizar en una mezcla
20 disolvente de estos disolventes convencionales. La temperatura de reacción no está limitada particularmente y se puede realizar generalmente en condiciones de refrigeración o calentamiento, y realizar preferiblemente de cerca de la temperatura ambiente a cerca del punto de ebullición del disolvente que se vaya a utilizar durante 0.5 a 75 horas.

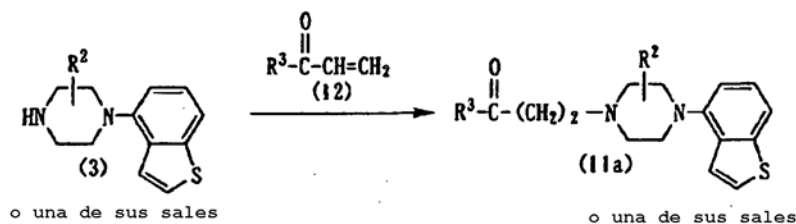
25 un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

En lugar de un compuesto (11), se puede utilizar una sal del compuesto (11). En cuanto a la sal preferible de un compuesto (11), se puede mencionar la misma sal que se ha mostrado en un compuesto (2).

30 Además, un compuesto (referido más adelante como un compuesto (11a)) donde A" del compuesto (11) representa "-(CH₂)₂-" se puede producir mediante un método representado por la siguiente fórmula de reacción 7.

[Fórmula 10]

Fórmula de reacción 7



donde R^2 y R^3 son los mismos que se han definido antes.

35 El compuesto (11a) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto (3) y un compuesto (referido más adelante como un compuesto (12)) representado por la fórmula general (12).

40 mismo. Esta reacción se realiza generalmente en un disolvente convencional que no pueda actuar negativamente a la reacción, tal como agua, un disolvente con una base alcohólica tal como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoroetanol, y etilenglicol; un disolvente con una base cetónica tal como acetona y metiletilcetona; un disolvente con una base etérica tal como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico, y diglima; un disolvente con una base de éster tal como acetato de metilo y acetato de etilo; un disolvente polar no protónico tal como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida, y dimetilsulfóxido; un disolvente con una base de hidrocarburo halogenado tal como cloruro de metileno y cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, la reacción se puede realizar en una mezcla
45 disolvente de estos disolventes convencionales. La temperatura de reacción no está limitada particularmente y se puede realizar generalmente en condiciones de refrigeración o calentamiento, y realizar preferiblemente de cerca de la temperatura ambiente a cerca del punto de ebullición del disolvente que se vaya a utilizar durante 0,5 a 75 horas.

50 El compuesto (12) que sirve como sustancia de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención es

un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

Se puede utilizar una sal de un compuesto (3) en lugar del compuesto (3) y una sal de un compuesto (12) en lugar del compuesto (12). En cuanto a la sal preferible de un compuesto (3), se puede mencionar la misma sal que se ha mostrado antes. En cuanto a la sal preferible de un compuesto (12), se puede mencionar la misma sal que se ha mostrado en un compuesto (2).

El compuesto objeto obtenido mediante cada una de las fórmulas de reacción anteriores puede formar una sal adecuada. Estas sales adecuadas incluyen las sales preferibles del compuesto (1) ilustradas más abajo.

Las sales preferibles del compuesto (1) son sales farmacológicamente aceptables y sus ejemplos incluyen sales metálicas tales como sales de metales alcalinos (por ejemplo, sal de sodio, sal de potasio, etc.), sales de metales alcalinotérreos (por ejemplo, sal de calcio, sal de magnesio, etc.), sales de bases inorgánicas tales como sal de amonio, carbonatos de metales alcalinos (por ejemplo, carbonato de litio, carbonato de potasio, carbonato de sodio, carbonato de cesio, etc.), hidrogenocarbonatos de metales alcalinos (por ejemplo, hidrogenocarbonato de litio, hidrogenocarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, etc.), hidróxidos de metales alcalinos (por ejemplo, hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio, etc.); por ejemplo, sales de bases orgánicas tales como trialkil(inferior)aminas (por ejemplo, trimetilamina, trietilamina, N-etildisopropilamina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilalanilina, N-alkil(inferior)-morfolina (por ejemplo, N-metilmorfolina), 1,5-diazabicyclo[4,3,0]noneno-5 (DBN), 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undeceno-7 (DBU), 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano (DABCO); sales de ácidos inorgánicos tales como hidrocloruro, hidrobromuro, hidroyoduro, sulfato, nitrato, fosfato; sales de ácidos orgánicos tales como formiato, acetato, propionato, oxalato, malonato, succinato, fumarato, maleato, lactato, malato, citrato, tartrato, carbonato, picrato, metanosulfonato, etanosulfonato, p-toluenosulfonato, glutamato.

Además, los compuestos en forma la forma en la que se añadió el solvato (por ejemplo, hidrato, etanolato, etc.) a los compuestos de partida y al compuesto objeto mostrados en cada una de las fórmulas de reacción se incluyen en cada una de las formulas generales. Como solvato preferible, se pueden mencionar el hidrato.

Cada uno de los compuestos objeto obtenidos mediante cada una de las formulas generales se puede aislar y purificar de la mezcla de reacción, por ejemplo, sometiendo la mezcla de reacción a una operación de aislamiento tal como filtración, concentración y extracción después de enfriar para separar un producto de reacción bruto seguido de una operación de purificación convencional tal como cromatografía en columna o recristalización.

El compuesto representado por la fórmula general (1) de la presente invención abarca naturalmente isómeros tales como isómeros geométricos, estereoisómeros y enantiómeros.

Un compuesto y una de sus sales representados por la fórmula general (1) se puede utilizar en forma de una preparación farmacéutica general. La preparación se puede formar mediante el uso de un diluyente o un excipiente tal como una carga, un agente expansor, un aglutinante, un humectante, un disgregante, un tensioactivo, y un lubricante. En cuanto a la preparación farmacéutica, se pueden seleccionar diferentes formas dependiendo del propósito terapéutico. Sus formas típicas incluyen un comprimido, píldora, polvo, líquido, suspensión, emulsión, gránulo, cápsula, supositorio, e inyección (líquido, suspensión).

Al formar un comprimido, se puede utilizar una gran variedad de tipos de portadores conocidos convencionalmente en la técnica. Los ejemplos del portador que se pueden utilizar incluyen un excipiente tal como lactosa, sacarosa, cloruro de sodio, glucosa, urea, almidón, carbonato de calcio, caolín, celulosa cristalina, y un silicato; un aglutinante tal como agua, etanol, propanol, jarabe simple, disolución de glucosa, disolución de almidón, disolución de gelatina, carboximetilcelulosa, goma laca, metilcelulosa, fosfato de potasio, y polivinilpirrolidina; un disgregante tal como almidón seco, alginato de sodio, agar en polvo, laminaria en polvo, hidrogenocarbonato de sodio, carbonato de calcio, ésteres de ácidos grasos y polioxietilensorbitán, laurilsulfato de sodio, monoglicérido de ácido esteárico, almidón, y lactosa; un supresor de la disgregación tal como sacarosa, estearina, manteca de cacao, y aceite hidrogenado; un sorbefaciente tal como una base de amonio cuaternario y laurilsulfato de sodio; un humectante tal como glicerina y almidón; un agente adsorbente tal como almidón, lactosa, caolín, bentonita, y sílice coloidal; y un lubricante tal como talco refinado, estearato, ácido bórico en polvo, y polietilenglicol. Además, si fuera necesario, un comprimido se puede revestir con una película general. Los ejemplos de tal comprimido revestido incluyen un comprimido revestido de azúcar, un comprimido encapsulado de gelatina, un comprimido con revestimiento entérico, un comprimido con revestimiento pelicular o un comprimido bicapa, y un comprimido de múltiples capas.

Al formar una píldora, se puede utilizar una amplia variedad de tipos de portadores conocidos convencionalmente en la técnica. Los ejemplos del portador que se pueden utilizar incluyen un excipiente tal como glucosa, lactosa, almidón, manteca de cacao, aceite vegetal endurecido, caolín y talco; un aglutinante tal como goma arábiga en polvo, tragacanto en polvo, gelatina y etanol; y un disgregante tal como laminaria y agar.

Al formar un supositorio, se puede utilizar una gran variedad de tipos de portadores convencionalmente conocidos en la técnica. Los ejemplos del portador que se puede utilizar incluyen polietilenglicol, manteca de cacao, alcoholes superiores, ésteres de alcoholes superiores, gelatina, y glicéridos semisintéticos.

- 5 Las capsulas se preparan usualmente mezclando un compuesto ingrediente activo con un portador como se ha ilustrado antes de acuerdo con un método convencional y cargando la mezcla en una capsula de gelatina dura o una capsula blanda.

- 10 Al preparar un inyectable, un agente líquido, una emulsión y una suspensión se esterilizan preferiblemente y se vuelven isotónicas con respecto a la sangre. Cuando se preparan en un inyectable, se puede utilizar cualquier diluyente con tal que se utilice convencionalmente como diluyente en la técnica. Los ejemplos del diluyente que se puede utilizar incluyen agua, alcohol etílico, macrogol, propilenglicol, alcohol isoesterarílico etoxilado, alcohol isoesterarílico polioxilado, ésteres de ácidos grasos y polioxietilensorbitán.

- 15 Obsérvese que, en este caso, una preparación farmacéutica puede contener una sal, glucosa o glicerina en una cantidad suficiente para preparar una disolución isotónica. Alternativamente, se pueden añadir un solubilizante auxiliar general, tampón, agente analgésico. Además, se pueden añadir a la preparación farmacéutica un pigmento, conservante, aroma, saborizante, agente edulcorante y otras sustancias medicinales, si fuera necesario.

- 20 La cantidad de un compuesto de fórmula general (1) y una de sus sales que va a estar contenida en una preparación farmacéutica de acuerdo con la presente invención no está limitada particularmente y se selecciona apropiadamente de un amplio intervalo; sin embargo será generalmente de aproximadamente 1 a 70% en peso, preferiblemente de aproximadamente 1 a 30% en peso en una composición de preparación.

- 25 El método para administrar una preparación farmacéutica de acuerdo con la presente invención no está limitado y se administra mediante un método de acuerdo con la forma de preparación, la edad, el género y otras condiciones del paciente, y la gravedad de la enfermedad. Por ejemplo, en el caso de un comprimido, píldora, agente líquido, suspensión, emulsión, gránulo y capsula, éste se administra peroralmente. Además, en el caso de un inyectable, éste se administra intravenosamente tal cual o mezclado con un revitalizador general tal como glucosa y aminoácidos, y, si fuera necesario, se administra exclusivamente intramuscularmente, intracutáneamente, subcutáneamente o intraperitonealmente. En el caso de los supositorios, estos se administran en el recto.

- 30 La dosis de una preparación farmacéutica de acuerdo con la presente invención se selecciona apropiadamente dependiendo del régimen de dosificación (indicaciones de uso), la edad, el género y otras condiciones del paciente, y la gravedad de la enfermedad, etc.; sin embargo, la dosis de un compuesto ingrediente activo puede ajustarse generalmente y preferiblemente de aproximadamente 0,1 a 10 mg/peso (kg) por día. Es deseable que un compuesto ingrediente activo esté contenido en el intervalo de aproximadamente de 1 a 200 mg por unidad de dosificación de una preparación.

40 **[Ventajas de la Invención]**

Un compuesto de acuerdo con la presente invención tiene un efecto agonístico parcial sobre el receptor D₂, un efecto antagonístico del receptor 5-HT_{2A} y un efecto inhibidor de la absorción de serotonina.

- 45 El efecto agonístico parcial de receptor D₂ hace referencia a una acción que desacelera la neurotransmisión dopaminérgica (DA) cuando ésta aumenta, mientras que acelera la neurotransmisión dopaminérgica (DA) cuando ésta disminuye. De esta manera, el agonista parcial del receptor D₂ actúa como un estabilizador del sistema de dopamina, que estabiliza la neurotransmisión DA en un estado normal. En virtud de este efecto, el compuesto de la presente invención produce un excelente efecto de mejora clínica sobre los síntomas causados por la neurotransmisión anómala de DA (aceleración o desaceleración) sin desarrollar efectos secundarios. En cuanto al
- 50 excelente efecto de mejora clínica, se puede hacer mención a, los efectos mejoradores de los síntomas positivos y negativos, del deterioro cognitivo y de los síntomas depresivos (véanse Michio Toru, Psychiatry, Vol. 46, páginas 855-864 (2004); Tetsuro Kikuchi y Hirose Takeshi, Brain Science, vol. 25, páginas 579-583 (2004); y Harrison, T. S. y Perry, C.M.: Drugs 64: 1715-1736, 2004).

- 55 El efecto antagonístico del receptor 5-HT_{2A} hace referencia a una acción que reduce los efectos secundarios extrapiramidales y desarrolla una respuesta clínica superior, y más específicamente trabaja eficazmente en la mejora de los síntomas negativos, el deterioro cognitivo, los síntomas de depresión, el insomnio (Véanse Jun Ishigooka y Ken Inada: Rinsho-Seishin-Yakuri (Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology), Vol. 4, págs. 1653-1664 (2001), Mitsukuni Murasaki: Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology, Vol. 1, págs. 5-22 (1998), y Meltzer, H.Y. et al, Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry 27: 1159-1172, 2003).
- 60 El efecto inhibidor de la absorción de serotonina es eficaz, por ejemplo, para mejorar los síntomas depresivos (Véase Mitsukuni Murasaki: Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology, vol. 1, págs. 5-22 (1998)).

El compuesto de la presente invención es excelente en estos tres efectos o notablemente excelente en uno o dos de estos efectos.

5 Además, algunos de los compuestos de acuerdo con presente invención tienen un efecto antagónico del receptor α_1 además de los efectos anteriormente mencionados. El efecto antagónico del receptor α_1 es eficaz para mejorar los síntomas positivos de la esquizofrenia (véase Svensson, T.H.: Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry 27: 1145-1158, 2003).

10 Por lo tanto, un compuesto de la presente invención tiene un amplio espectro de tratamiento para la esquizofrenia y otros trastornos del sistema nervioso central y posee una respuesta clínica superior.

Por lo tanto, un compuestos de la presente invención es extremadamente eficaz para mejorar diferentes clases de trastornos del sistema nervioso central tales como esquizofrenia; esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; 15 trastornos emocionales; trastornos psicóticos; trastornos del estado de ánimo; trastorno bipolar (por ejemplo, trastorno bipolar de tipo I y trastorno bipolar de tipo II); depresión; depresión endógena; depresión mayor; melancolía y depresión refractaria; trastorno distímico; trastorno ciclotímico; trastorno de ansiedad (por ejemplo, ataque de pánico, trastorno por pánico, agorafobia, fobia social, trastorno obsesivo-compulsivo, trastorno por estrés post-traumático, trastorno de ansiedad generalizado, trastorno de estrés agudo, etc.); trastorno somatomorfo (por ejemplo, histeria, trastorno de somatización, trastorno de conversión, trastorno por dolor, hipocondriasis, etc.); 20 trastorno facticio; trastorno disociativo; trastorno sexual (por ejemplo, disfunción sexual, trastorno del deseo sexual, trastorno de la excitación sexual, disfunción eréctil, etc.); trastorno de la conducta alimentaria (por ejemplo, anorexia nerviosa, bulimia nerviosa, etc.); trastorno del sueño; trastorno del adaptación; trastorno relacionado con sustancias (por ejemplo, abuso de alcohol, intoxicación alcohólica, adicción a fármacos, intoxicación con estimulantes, narcotismo, etc.); anhedonia (por ejemplo, anhedonia iatrogénica, anhedonia de causa psíquica o mental, anhedonia asociada a depresión, y anhedonia asociada a esquizofrenia, etc.); delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo asociado a la enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson, y otras enfermedades neurodegenerativas; 25 deterioro cognitivo causado por enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de la esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; vómito; mareo por movimiento; obesidad; migraña; dolor; retraso mental; trastorno de autismo (autismo); síndrome de Tourette; trastornos de tics; trastorno por déficit de atención con hiperactividad; trastorno de la conducta; y síndrome de Down.

Además, un compuesto de la presente invención tiene pocos o efectos secundarios y tiene una seguridad y 35 tolerabilidad excelentes.

Los compuestos de partida utilizados en cada una de las fórmulas de reacción anteriores puede ser una sal adecuada, el compuesto objeto obtenido mediante cada una de las reacciones puede formar una sal adecuada. Tales sales adecuadas incluyen las sales preferibles del compuesto (1) ilustradas más abajo.

40 Las sales preferibles del compuesto (1) son sales farmacológicamente aceptables y sus ejemplos incluyen sales metálicas tales como sales de metales alcalinos (por ejemplo, sal de sodio, sal de potasio, etc.), sales de metales alcalinotérreos (por ejemplo, sal de calcio, sal de magnesio, etc.), sales de bases inorgánicas tales como sal de amonio, carbonatos de metales alcalinos (por ejemplo, carbonato de litio, carbonato de potasio, carbonato de sodio, 45 carbonato de cesio, etc.), hidrogenocarbonatos de metales alcalinos (por ejemplo, hidrogenocarbonato de litio, hidrogenocarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, etc.), hidróxidos de metales alcalinos (por ejemplo, hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio, etc.); por ejemplo, sales de bases orgánicas tales como trialkil(inferior)aminas (por ejemplo, trimetilamina, trietilamina, N-etildisopropilamina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilanilina, N-alkil(inferior)-morfolina (por ejemplo, N-metilmorfolina), 1,5-diazabicyclo[4,3,0]noneno-5 (DBN), 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undeceno-7 (DBU), 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano (DABCO); sales de ácidos orgánicos tales como hidrocloreuro, hidrobromuro, hidroyoduro, sulfato, nitrato, fosfato; sales de ácidos orgánicos tales como formiato, acetato, propionato, oxalato, malonato, succinato, fumarato, maleato, lactato, malato, citrato, tartrato, carbonato, picrato, metanosulfonato, etanosulfonato, p-toluenosulfonato, glutamato.

55 Además, los compuestos en la forma en la cual se añadió el solvato (por ejemplo, hidrato, etanolato, etc.) a los compuestos de partida y el compuesto objeto mostrado en cada una de las fórmulas de reacción están incluidos en cada una de las fórmulas generales. En cuanto al solvato preferible, se puede mencionar el hidrato.

60 Cada uno de los compuestos objeto obtenidos mediante cada una de las fórmulas generales se puede aislar y purificar de la mezcla de reacción, por ejemplo, sometiendo la mezcla de reacción a una operación de aislamiento tal como filtración, concentración y extracción después de enfriar para separar un producto de reacción bruto seguido de una operación de purificación convencional tal como cromatografía en columna o recristalización.

El compuesto representado por la fórmula general (1) de la presente invención naturalmente abarca isómeros tales como isómeros geométricos, estereoisómeros y enantiómeros.

El compuesto de la fórmula general (1) y una de sus sales se pueden utilizar en una forma común de preparación farmacéutica. La preparación farmacéutica se prepara usando usualmente un diluyente o excipiente utilizado tal como una carga, agente expansor, aglutinante, humectante, agente disgregante, tensioactivo y lubricante. En cuanto a esta preparación farmacéutica, se pueden seleccionar varias formas dependiendo del propósito de tratamiento, y los ejemplos típicos incluyen un comprimido, píldora, polvo, disolución, suspensión, emulsión, gránulo, cápsula, supositorio, e inyectable (solución, suspensión).

Para el moldeo en forma de comprimido, se pueden utilizar generalmente varias sustancias bien conocidas convencionalmente como portador en la técnica. Como ejemplos, se pueden utilizar, por ejemplo, un excipiente tal como lactosa, sacarosa, cloruro de sodio, glucosa, urea, almidón, carbonato de calcio, caolín, celulosa cristalina, silicato; un aglutinante tal como agua, etanol, propanol, jarabe simple, disolución de glucosa, almidón líquido, disolución de gelatina, carboximetilcelulosa, goma laca, metilcelulosa, fosfato de potasio, polivinilpirrolidona; un agente disgregante tal como almidón seco, alginato de sodio, polvo de agar, polvo de laminaria, hidrogenocarbonato sódico, carbonato de calcio, ésteres de ácidos grasos y polioxietilen- sorbitán, laurilsulfato de sodio, monoglicérido de ácido esteárico, almidón, lactosa; un agente para prevenir la disgregación, estearina, manteca de cacao, aceite hidrogenado; un sorbefaciente tal como una base de amonio cuaternario, laurilsulfato de sodio; un agente humectante tal como glicerina, almidón; un agente absorbente tal como almidón, lactosa, caolín, bentonita, sílice coloidal; un lubricante tal como talco purificado, estearato, polvo de borato, polietilenglicol. Además, el comprimido puede ser un comprimido proporcionado con un revestimiento convencional según se requiera, por ejemplo, un comprimido revestido de azúcar, un comprimido encapsulado con gelatina, un comprimido con revestimiento entérico, un comprimido con revestimiento pelicular o un comprimido bicapa, o un comprimido multicapa.

Para el moldeo en forma de píldora, se pueden utilizar generalmente diversas sustancias bien conocidas convencionalmente como portador en la técnica. Como ejemplos se pueden utilizar, por ejemplo, un excipiente tal como glucosa, lactosa, almidón, manteca de cacao, aceite vegetal hidrogenado, caolín, talco; un aglutinante tal como goma arábiga en polvo, tragacanto en polvo, gelatina, etanol; un agente disgregante tal como laminaria, agar.

Para el moldeo en forma de supositorio, se pueden utilizar generalmente diferentes sustancias bien conocidas convencionalmente como portador. Sus ejemplos incluyen polietilenglicol, manteca de cacao, alcoholes superiores, ésteres de alcoholes superiores, gelatina, glicéridos semisintéticos, por ejemplo.

Una cápsula se prepara usualmente de acuerdo con un método convencional mezclando compuestos ingrediente activo con diversos portadores ilustrados antes y cargándolos en una cápsula de gelatina dura, una cápsula blanda o similares.

Cuando se preparan en forma de un líquido inyectable, es preferible que la disolución, la emulsión y la suspensión estén esterilizadas y sean isotónicas con la sangre y para formarlas de esos modos, se puede utilizar cualquiera de los diluyentes utilizados convencionalmente en la técnica, y, por ejemplo, se puede utilizar agua, alcohol etílico, macrogol, propilenglicol, alcohol isoestearílico etoxilado, alcohol isoestearílico polioxilado, éster de ácido graso y polioxietilensorbitán, etc.

La preparación farmacéutica puede contener una sal común, glucosa o glicerina en una cantidad suficiente para preparar una disolución isotónica en este caso, y también se puede añadir un estabilizador, tampón, agente analgésico convencional. Puede estar contenido adicionalmente según se requiera un pigmento, conservante, sustancia aromática, saborizante, edulcorante y otros agentes farmacéuticos.

La cantidad de un compuesto de fórmula general (1) o una de sus sales que va a estar contenida en la preparación farmacéutica de la presente invención no está particularmente limitada pero usualmente es adecuada de aproximadamente 1 a 70% en peso en composición de la preparación y preferiblemente de aproximadamente 1 a 30% en peso.

No existe una limitación concreta en el modo de administración de la preparación farmacéutica de la presente invención y se puede administrar mediante un método de acuerdo con la forma específica de la preparación, la edad, el sexo y las otras condiciones del paciente, la gravedad de la enfermedad, etc. Por ejemplo, en el caso de los comprimidos, las píldoras, las soluciones, las suspensiones, las emulsiones, los gránulos y las cápsulas, estos se administran oralmente. En el caso de los inyectables, estos se administran intravenosamente solos o en una mezcla con un fluido de reposición convencional tal como glucosa y aminoácidos, si fuera necesario, y la preparación sola también se puede administrar intramuscularmente, intracutáneamente, subcutáneamente o interperitonealmente. Se administran en el recto en el caso de los supositorios.

La dosis aplicada de la preparación farmacéutica de la presente invención se selecciona apropiadamente de

acuerdo con el régimen de dosificación, la edad, el sexo y las otras condiciones del paciente, la gravedad de la enfermedad, etc., pero es adecuado que la cantidad del compuesto ingrediente activo sea usualmente de aproximadamente 0,1 a 10 mg por 1 kg de peso corporal por día. Además, es deseable que el compuesto ingrediente activo esté contenido en la preparación de una forma unitaria de dosificación en el intervalo de aproximadamente 1 a 200 mg.

El compuesto de la presente invención tiene un efecto agonístico parcial del receptor D₂, un efecto antagónico del receptor 5-HT_{2A} y un efecto inhibidor de la absorción de serotonina (o efecto inhibidor de la absorción de serotonina).

El efecto agonístico parcial del receptor D₂ suprime la neurotransmisión dopaminérgica (DA) cuando aumenta, y acelera la neurotransmisión DA cuando disminuye y de este modo tiene la función de estabilizar la neurotransmisión DA a un estado normal (estabilizador del sistema de dopamina). De acuerdo con esta función, se desarrolla un efecto de mejoría clínica excelente en las afecciones basadas en la neurotransmisión DA anormal (aumento y disminución), por ejemplo, efecto mejorador sobre los síntomas positivos y negativos, efecto mejorador sobre el deterioro cognitivo, efecto mejorador sobre los síntomas depresivos, etc. sin desarrollar efectos secundarios (Véanse Michio Toru: *Seishin-Igaku (Psychiatry)*, Vol. 46, págs. 855-864 (2004), Tetsuro Kikuchi y Tsuyoshi Hirose: *Nou-no-Kagaku (Brain Science)*, Vol. 25, págs. 579-583 (2003) y Harrison, T.S. y Perry, C.M.: *Drugs* 64: 1715-1736, 2004).

El efecto antagónico del receptor 5-HT_{2A} reduce los efectos secundarios extrapiramidales, desarrolla efectos clínicos superiores, y es eficaz para la mejora de los síntomas negativos, la mejora del deterioro cognitivo, la mejora de la condición de depresión, la mejora del insomnio, por ejemplo (Véanse Jun Ishigooka y Ken Inada: *Rinsho-Seishin-Yakuri (Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology)*, Vol. 4, págs. 1653-1664 (2001), Mitsukuni Murasaki: *Rinsho-Seishin-Yakuri (Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology)*, Vol. 1, págs. 5-22 (1998), Puller, I.A. et al., *Eur. J. Pharmacol.*, 407:39-46, 2000, y Meltzer, H.Y. et al, *Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry* 27: 1159-1172, 2003).

El efecto inhibidor de la absorción de serotonina (o efecto inhibidor de la reabsorción de serotonina) es eficaz para mejorar los síntomas depresivos, por ejemplo (Véase Mitsukuni Murasaki: *Rinsho-Seishin-Yakuri (Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology)*, Vol. 1, págs. 5-22 (1998)).

Los compuestos de la presente invención son excelentes en estos tres efectos, o notablemente excelentes en uno o dos de estos efectos.

Además, algunos de los compuestos de la presente invención tienen un efecto antagónico del receptor α_1 además de los efectos anteriormente descritos. El efecto antagónico del receptor α_1 es eficaz para mejorar los síntomas positivos de la esquizofrenia (Véase Svensson, T.H.: *Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry* 27: 1145-1158, 2003).

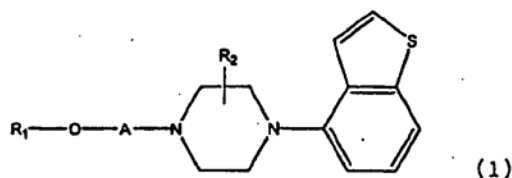
Por lo tanto, los compuestos de la presente invención tienen un amplio espectro de tratamiento para, y excelente efecto clínico sobre, la esquizofrenia y otros trastornos del sistema nervioso central.

Por lo tanto, los compuestos de la presente invención son extremadamente eficaces para el tratamiento o la prevención de trastornos del sistema nervioso central incluyendo el grupo que consiste en esquizofrenia; esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; trastornos emocionales; trastornos psicóticos; trastornos del estado de ánimo; trastorno bipolar (por ejemplo, trastorno bipolar de tipo I y trastorno bipolar de tipo II); depresión; depresión endógena; depresión mayor; melancolía y depresión refractaria; trastorno distímico; trastorno ciclotímico; trastorno de ansiedad (por ejemplo, ataque de pánico, trastorno por pánico, agorafobia, fobia social, trastorno obsesivo-compulsivo, trastorno por estrés post-traumático, trastorno de ansiedad generalizado, trastorno de estrés agudo, etc.); trastorno somatomorfo (por ejemplo, histeria, trastorno de somatización, trastorno de conversión, trastorno por dolor, hipocondriasis, etc.); trastorno facticio; trastorno disociativo; trastorno sexual (por ejemplo, disfunción sexual, trastorno del deseo sexual, trastorno de la excitación sexual, disfunción eréctil, etc.); trastorno de la conducta alimentaria (por ejemplo, anorexia nerviosa, bulimia nerviosa, etc.); trastorno del sueño; trastorno de adaptación; trastorno relacionado con sustancias (por ejemplo, abuso de alcohol, intoxicación alcohólica, adicción a fármacos, intoxicación con estimulantes, narcotismo, etc.); anhedonia (por ejemplo, anhedonia iatrogénica, anhedonia de causa psíquica o mental, anhedonia asociada a depresión, anhedonia asociada a esquizofrenia, etc.); delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo asociado a la enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson, y otras enfermedades neurodegenerativas; deterioro cognitivo causado por enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de la esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; vómito; mareo por movimiento; obesidad; migraña; dolor; retraso mental; trastorno de autismo (autismo); síndrome de Tourette; trastornos de tics; trastorno por déficit de atención con hiperactividad; trastorno de la conducta; y síndrome de Down.

Además, los compuestos de la presente invención tienen pocos o ningún efecto secundario y tienen una seguridad y tolerabilidad excelentes.

Un ejemplo preferible de un compuesto (1) deseado es el siguiente:

[Fórmula 1]



donde R^2 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior;
 A representa un grupo alquileo inferior o un grupo alquenileo inferior (preferiblemente un grupo alquileo inferior);
 y
 R^1 representa

(II) un grupo aromático seleccionado entre un grupo fenilo, un grupo naftilo, un grupo dihidroindenilo y un grupo tetrahidronaftilo (más preferiblemente un grupo fenilo);

donde, en el grupo aromático representado por R^1 , de 1 a 5 (más preferiblemente de 1 a 3) grupos seleccionados del grupo que consiste en los grupos (1) a (66) de más abajo puede estar presente como sustituyente:

- (1) un grupo alquilo inferior,
- (2) un grupo alquenilo inferior,
- (3) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- (4) un grupo alcoxi inferior,
- (5) un grupo fenoxi,
- (6) un grupo alquil(inferior)tio,
- (7) un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno,
- (8) un grupo hidroxilo,
- (9) un grupo fenilalcoxi inferior,
- (10) un grupo hidroxialquilo inferior,
- (11) un grupo alcoxi(inferior)alquilo inferior,
- (12) un átomo de halógeno,
- (13) un grupo ciano,
- (14) a fenilo grupo arilo,
- (15) un grupo amino,
- (16) un grupo amino,
- (17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alquil(inferior)sulfonilo, un grupo carbamoilo, un grupo alquil(inferior)carbamoilo, un grupo aminoalcanilo inferior, un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior y un grupo alcoxi(inferior)carbonilaminoalcanilo inferior como sustituyente o sustituyentes (más preferiblemente un grupo N-alquil(inferior)amino, un grupo N,N-dialquil(inferior)amino, un grupo N-alcanilo(inferior)amino, un grupo N-alcoxi(inferior)carbonilamino, un grupo N-alquil(inferior)sulfonilamino, un grupo N-alquil(inferior)-N-alcanilo(inferior)amino, un grupo N-alquil(inferior)-N-alcoxi(inferior)carbonilamino, un grupo N-[carbamoil]amino, un grupo N-[N-alquil(inferior)carbamoil]amino, un grupo N-[N,N-dialquil(inferior)carbamoil]amino, un grupo N-[aminoalcanilo(inferior)]amino, un grupo N-[[N-alcanilo(inferior)amino]alcanilo(inferior)]amino, o un grupo N-[[N-alcoxi(inferior)carbonilamino]alcanilo(inferior)]amino),
- (18) un grupo alcanilo inferior,
- (19) un grupo fenilsulfonilo que puede tener un grupo alquilo inferior en el grupo fenilo (más preferiblemente un grupo alquil(inferior)-fenilsulfonilo),
- (20) un grupo carboxi,
- (21) un grupo alcoxi(inferior)carbonilo,
- (22) un grupo carboxialquilo inferior,
- (23) un grupo alcoxi(inferior)carbonilalquilo inferior,
- (24) un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior,
- (25) un grupo carboxialquenilo inferior,
- (26) un grupo alcovicarbonilalquenilo inferior,
- (27) un grupo carbamoilalquenilo inferior que puede tener como sustituyente o sustituyentes de 1 a 2 grupos

seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno (más preferiblemente un grupo carbamoilalquenilo inferior, un grupo N-alquil(inferior)carbamoilalquenilo inferior, un grupo N,N-dialquil(inferior)carbamoilalquenilo inferior o un N-[alquil inferior sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno]carbamoilalquenilo inferior),

(28) un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en los grupos (i) a (lxxviii) de más abajo como sustituyente o sustituyentes:

(i) un grupo alquilo inferior,

(ii) un grupo alcoxi inferior,

(iii) un grupo hidroxialquilo inferior,

(iv) un grupo alcoxi(inferior)alquilo inferior,

(v) un grupo fenoxialquilo inferior,

(vi) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,

(vii) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo carbamoilo (más preferiblemente un grupo N,N-dialquil(inferior)aminoalquilo inferior, un grupo N-alcanilo(inferior)-aminoalquilo inferior, un grupo N-alquil(inferior)-N-alcanilo(inferior)-aminoalquilo inferior, un grupo N-alquil(inferior)-N-benzoilaminoalquilo inferior, o un grupo N-carbamoilaminoalquilo inferior)

(viii) un grupo cicloalquilo C₃-C₈ que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente de 1 a 2 grupos, y más preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo fenilalcoxi inferior como sustituyente,

(ix) un grupo alquilo inferior sustituido con cicloalquilo C₃-C₈,

(x) un grupo alquenilo inferior

(xi) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo que puede tener un solo grupo alquilo inferior y un grupo fenilo que puede tener un solo grupo alcoxi inferior como sustituyente o sustituyentes (más preferiblemente un grupo carbamoilalquilo inferior, un grupo dicarbamoilalquilo inferior, un grupo N-alquil(inferior)carbamoilalquilo inferior, un grupo N,N-dialquil(inferior)-carbamoilalquilo inferior, un grupo N-[alquil(inferior)alquil(inferior)fenil]-carbamoilalquilo inferior, o un grupo N-[alcoxi(inferior)fenil]carbamoilalquilo inferior),

(xii) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos alcoxi(inferior)carbonilo,

(xiii) un grupo furilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo furilo),

(xiv) un grupo tetrahidrofurilalquilo inferior,

(xv) un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior,

(xvi) un grupo tetrahidropiranilalquilo inferior,

(xvii) un grupo pirrolilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo pirrolilo),

(xviii) un grupo dihidropirazolilalquilo inferior que puede tener un solo grupo oxo,

(xix) un grupo pirazolilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo pirazolilo),

(xx) un grupo imidazolilalquilo inferior,

(xxi) un grupo piridilalquilo inferior,

(xxii) un grupo pirazinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo pirazinilo),

(xxiii) un grupo pirrolidinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo pirrolidinilo),

(xxiv) un grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo piperidilo),

(xxv) un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo piperazinilo),

(xxvi) un grupo morfolinilalquilo inferior,

(xxvii) un grupo tienilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupo alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo tienilo),

(xxviii) un grupo tiazolilalquilo inferior,

(xxix) un grupo dihidrobenzofurilalquilo inferior,

(xxx) un grupo benzopiranilalquilo inferior (que puede tener un solo grupo oxo como sustituyente en el grupo benzopiranilo),

(xxxi) un grupo benzimidazolilalquilo inferior,

(xxxii) un grupo indolilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alcoxi(inferior)carbonilo en el grupo alquilo inferior),

- (xxxiii) un grupo imidazolilalquilo inferior que tiene de 1 a 3 sustituyentes (preferiblemente 1 sustituyente) seleccionado del grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo en el grupo alquilo inferior,
- 5 (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquil(inferior)tioalquilo inferior como sustituyente o sustituyentes,
- (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior y un grupo benzoilo como sustituyente,
- 10 (xxxvi) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior y un grupo benzoilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un átomo de halógeno en el grupo fenilo,
- 15 (xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (xxxviii) un grupo hexahidroazepinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo y un grupo furilo como sustituyente,
- 20 (xl) un grupo tiazolilo,
- (xli) un grupo tiadiazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior,
- (xlii) un grupo isoxazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior,
- (xliii) un grupo indazolilo,
- (xliv) un grupo indolilo,
- 25 (xlv) un grupo tetrahydrobenzotiazolilo,
- (xlvi) un grupo tetrahydroquinolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno y un grupo oxo como sustituyente,
- (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior,
- 30 (xlviii) un grupo benzodioxolilalquilo inferior,
- (xlix) un grupo fenilo o un grupo naftilo que puede tener de 1 a 3 grupos como sustituyente o sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en
- 35 un átomo de halógeno; un grupo alquilo inferior; un grupo alcoxi inferior; un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno; un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno; un grupo alquenilo inferior; un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior, un grupo alquil(inferior)sulfonilo, un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo sulfamoilo; un grupo alquil(inferior)tio; un grupo alcanilo inferior; un grupo alcoxi(inferior)carbonilo; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo inferior; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo fenilo; un grupo fenilalcoxi inferior; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxialquilo inferior; un grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo fenilo; un
- 40 grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior; un grupo dihidrofurilo que puede tener un solo grupo oxo; un grupo tiazolidinilalquilo inferior que puede tener dos grupos oxo; un grupo imidazolilalcanoilo inferior y un grupo piperidinilcarbonilo,
- (l) un grupo cianoalquilo inferior,
- 45 (li) un grupo dihidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo oxo,
- (lii) un grupo alquil(inferior)amino sustituido con halógeno,
- (liii) un grupo alquil(inferior)tioalquilo inferior,
- 50 (liv) un grupo amidino que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior,
- (lv) un grupo amidinoalquilo inferior,
- (lvi) un grupo alquilen(inferior)oxialquilo inferior,
- (lvii) un grupo fenilamino que puede tener de 1 a 3 sustituyentes (más preferiblemente 1 sustituyente) seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno y un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno en el grupo
- 55 fenilo,
- (lviii) un grupo fenilalquenilo inferior,
- (lix) un grupo piridilamino que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior (más preferiblemente un grupo N-alquil(inferior)-N-[alquil(inferior)piridil]amino),
- 60 (lx) un grupo fenilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi inferior, un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como sustituyente en el grupo fenilo y/o el grupo alquilo inferior),
- (lxi) un grupo alquinilo inferior,

- (lxii) un grupo fenoxialquilo inferior (que puede tener como sustituyente o sustituyentes en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior, un grupo N-alcoxi(inferior)-N-alquil(inferior)carbamoilo y un grupo oxopirrolidinilo),
- (lxiii) un grupo isoxazolilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (lxiv) un grupo dihidroindenilo,
- (lxv) un grupo fenilalcoxi(inferior)alquilo inferior,
- (lxvi) un grupo tetrahidropiranilo,
- (lxvii) un grupo azetidinilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior y un grupo benzoilo,
- (lxviii) un grupo azetidinilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior y un grupo benzoilo,
- (lxix) un grupo tetrazolilo,
- (lxx) un grupo indolinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (lxxi) un grupo triazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquil(inferior)tio,
- (lxxii) un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos carbamoilo,
- (lxxiii) un grupo oxazolilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos alquilo inferior,
- (lxxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos alquilo inferior,
- (lxxv) un grupo benzimidazolilo,
- (lxxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos alcoxi(inferior)carbonilo, y
- (lxxviii) un grupo oxazolilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior
- (29) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior, un grupo fenilo, un grupo fenilalquilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo alquilo sustituido con amino (que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 2) grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo amino) en el grupo amino,
- (30) un grupo alquilo inferior sustituido con un solo grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- (31) un grupo tiocarbamoilo que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 1) grupo alquilo inferior,
- (32) un grupo sulfamoilo,
- (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo (más preferiblemente un grupo oxazolidinilo sustituido con un solo grupo oxo),
- (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior,
- (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (36) un grupo imidazolilo,
- (37) un grupo triazolilo,
- (38) un grupo isoxazolilo,
- (39) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2, y aun más preferiblemente 1) sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alquil(inferior)fenilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior (más preferiblemente un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2, y aun más preferiblemente 1) sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alquil(inferior)fenilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo N-alquil(inferior)amino, un grupo N,N-dialquil(inferior)amino, un grupo N-alcanilo(inferior)amino, un grupo N-alquil(inferior)-N-alcoxi(inferior)carbonilamino, un grupo N-alquil(inferior)-N-alcanilo(inferior)amino, y un grupo N-alcanilo(inferior)aminoalcanilo(inferior)amino),
- (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo carboxialquilo inferior, un grupo alquil(inferior)carbamoilalquilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi inferior, un grupo carboxi, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo amino (en el que pueden estar presentes 1 o 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo benzoilo), un grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo benzoilo), un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior), un grupo 1,4-dioxa-8-

azaespiro[4,5]decilo, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que puede estar presente un solo grupo alquilo inferior como sustituyente), un grupo piridilo, un grupo piridiloxi, un grupo piridilalcoxi inferior, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un solo grupo oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo fenilalcoxi inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno en el grupo fenilo), un grupo fenilo (en los cuales pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 3 grupos (preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxi inferior y un grupo hidroxilo), un grupo feniloxi (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos (preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), un grupo fenilalquilo inferior (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), y un grupo benzoilo (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxi inferior),

(41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos como sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo carbamilo, un grupo hidroxilo, un grupo amino (que puede tener en el grupo amino de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior y un grupo benzoilo), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo piperidilalquilo inferior, un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener un solo grupo alquilo inferior como sustituyente en el grupo piperazinilo), un grupo aminoalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo amino), feniloxi grupo (que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos alcoxi inferior sustituidos con halógeno en el grupo fenilo), un grupo fenoxialquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos alcoxi inferior sustituidos con halógeno en el grupo fenilo) y un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un grupo oxo),

(42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos), como sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo alcanilo inferior, un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo aminoalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo amino), un grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo piperidilo), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior, un grupo tetrahydrofuralalquilo inferior, un grupo piridilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 1) grupos fenilo como sustituyente o sustituyentes en el grupo alquilo inferior), un grupo imidazolilalquilo inferior, un grupo furilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilcarbonilalquilo inferior, un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como sustituyentes o sustituyentes, un grupo piridilo (que puede tener en el grupo piridilo de 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciano y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como sustituyente), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo fenilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo benzoilo, un grupo furilcarbonilo, a fenilo grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo oxo,

(43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,

(44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes (más preferiblemente 1 sustituyente) seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo piridilo,

(45) un grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior,

(46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo,

(47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo piperidilalquilo inferior y un grupo fenilo,

(48) un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos fenilo que pueden tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo ciano,

(49) un grupo azabicyclo[3,2,2]nonilcarbonilo,

(50) un grupo 8-azabicyclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos feniloxi sustituidos con halógeno o insustituidos,

(51) un grupo indolinilcarbonilo,

(52) un grupo tetrahydroquinolilcarbonilo,

(53) un grupo tetrahydropirido[3,4-b]indolil-carbonilo,

(54) un grupo morfolinilalquilo inferior,

(55) un grupo piperazinilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos alquilo

inferior en el grupo piperazinilo,

(56) un grupo morfolinilcarbonilalquilo inferior,

(57) un grupo piperazinilcarbonilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos alquilo inferior en el grupo piperazinilo,

(58) un grupo oxo,

(59) un grupo aminoalcoxi inferior (que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 2) grupos alquilo inferior en el grupo amino),

(60) un grupo alcoxi(inferior)alcoxi inferior,

(61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo (más preferiblemente, un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo oxo, un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo alquilo inferior, un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo alcanilo inferior, un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo oxo y un solo grupo alcanilo inferior, y un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo oxo y un solo grupo alcoxi(inferior)carbonilo),

(62) un grupo morfolinilo,

(63) un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanil-carbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo fenilo,

(64) un grupo tetrahidropiranilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos piridilo,

(65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener un grupo tioxo, y

(66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decanilo.

En la fórmula general (1), R¹ es preferiblemente un grupo fenilo. El anillo del grupo fenilo está sustituido preferiblemente con 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en:

(1) un grupo alquilo inferior,

(4) un grupo alcoxi inferior,

(10) un grupo hidroxialquilo inferior,

(17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, a un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alquil(inferior)sulfonilo, un grupo carbamoilo, un grupo alquil(inferior)carbamoilo, un grupo aminoalcanilo inferior, un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior y un grupo alcoxi(inferior)carbonilaminoalcanilo inferior como sustituyente o sustituyentes,

(21) un grupo alcoxi(inferior)carbonilo,

(28) un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en los grupos (i), (ii), (iv), (xii) y (xxi) de más abajo:

(i) un grupo alquilo inferior,

(ii) un grupo alcoxi inferior,

(iv) un grupo alcoxi(inferior)alquilo inferior,

(xii) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos alquil(inferior)carbonilo,

(xxi) un grupo piridilalquilo inferior,

(29) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior, un grupo fenilo, un grupo fenilalquilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo alquilo sustituido con amino (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo amino) en el grupo amino,

(30) un grupo alquilo inferior sustituido con un solo grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,

(33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,

(34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior,

(35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,

(36) un grupo imidazolilo,

(39) un grupo piperidilo que puede tener un solo sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alquil(inferior)fenilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxil, un grupo amino, un grupo N-alquil(inferior)amino, un grupo N,N-di-alquil(inferior)amino, un grupo N-alcanilo(inferior)amino, un grupo N-alquil(inferior)-N-alcoxi(inferior)carbonilamino, un grupo N-alquil(inferior)-N-alcanilo(inferior)amino, y un grupo N-alcanilo(inferior)aminoalcanilo(inferior)amino,

(61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, y

(62) un grupo morfolinilo.

EJEMPLO

A continuación, la presente invención se aclarará adicionalmente con referencia a los Ejemplos de Referencia, los Ejemplos y los Ejemplos Experimentales Farmacológicos y los Ejemplos de Preparación.

Ejemplo de Referencia 1**Síntesis de hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina**

Una mezcla que consiste en 14,4 g de 4-bromobenzo[b]tiofeno, 29,8 g de piperazina anhidra, 9,3 g de t-butoxido de sodio, 0,65 g de (R)-(+)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo (BINAP), 0,63 g de tris(dibencilidenoacetona)dipaladio (0) y 250 ml de tolueno se sometió a reflujo calentando durante una hora en una atmósfera de nitrógeno. Se vertió agua en la disolución de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo, se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. El disolvente se evaporó a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano:metanol:agua amoniacal al 25% = 100:10:1), para obtener 9,5 g de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina en forma de un aceite de color amarillo.

A continuación, se añadieron 3,7 ml de ácido clorhídrico concentrado a una disolución metanólica de 9,5 g de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina, y el disolvente se evaporó a presión reducida. Se añadió acetato de etilo al residuo obtenido y los cristales precipitados se obtuvieron mediante filtración. La recristalización se realizó en metanol para obtener hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina en forma de cristales como agujas incoloras.

Punto de fusión 276-280°C

RMN ^1H (DMSO- d_6) δ ppm: 3,25-3,35 (8H, m), 6,94 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,30 (1H, dd, J = 7,8 Hz, J = 7,8 Hz), 7,51 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,68 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,73 (1H, d, J = 5,5 Hz), 9,35 (2H, s ancho).

Ejemplo de Referencia 2**Síntesis de 4-benzo[b]tiofen-4-il-3-metilpiperazin-1-carboxilato de terc-butilo**

El compuesto del título se obtuvo utilizando 3-metilpiperazin-1-carboxilato de terc-butilo y 4-bromobenzo[b]tiofeno de la misma manera que en el Ejemplo de Referencia 1.

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,85-1,95 (3H, m), 1,50 (9H, s), 2,8-2,9 (1H, m), 3,15-3,35 (2H, m), 3,4-3,5 (1H, m), 3,5-3,65 (1H, m), 3,65-3,7 (1H, m), 3,7-3,9 (1H, m), 6,98 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,29 (1H, dd, J = 8 Hz, J = 9 Hz), 7,38 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,61 (1H, d, J = 9 Hz).

Ejemplo de Referencia 3**Síntesis de dihidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-2-metilpiperazina**

Se añadió ácido trifluoroacético (6 ml) a una disolución de 1,22 g (3,7 mmoles) de 4-benzo[b]tiofen-4-il-3-metilpiperazin-1-carboxilato de terc-butilo en una disolución en diclorometano (12 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida, y se añadió una disolución acuosa de carbonato de potasio al 5% al residuo y la mezcla resultante se extrajo con diclorometano. La disolución de extracción con diclorometano se secó sobre sulfato de magnesio y después de eso se concentró a presión reducida. Al residuo obtenido, se le añadieron ácido clorhídrico concentrado (0,6 ml) y metanol (10 ml) y la mezcla resultante se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se sometió a recristalización en acetonitrilo para obtener dihidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-2-metilpiperazina (0,98 g) en forma de polvo de color pardo claro. RMN ^1H (DMSO- d_6) δ ppm: 0,92 (3H, d, J = 6,5 Hz), 2,8-3,6 (6H, m), 3,6-4,0 (1H, m), 5,3-6,8 (1H, m), 7,20 (1H, ancho), 7,38 (1H, dd, J = 8 Hz, J = 8 Hz), 7,5-8,0 (3H, m), 9,4-10,1 (2H, m).

Ejemplo de Referencia 4**Síntesis de dihidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-3-metilpiperazina**

El compuesto del título se obtuvo utilizando 2-metilpiperazina y 4-bromobenzo[b]tiofeno de la misma manera que en el Ejemplo de Referencia 1.

RMN ^1H (DMSO- d_6) δ ppm: 1,34 (3H, d, J = 6,5 Hz), 2,85-2,95 (1H, m), 3,05-3,15 (1H, m), 3,2-3,6 (6H, m), 6,97 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,31 (1H, dd, J = 8 Hz, J = 8 Hz), 7,54 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,69 (1H, d, J = 8 Hz), 7,75 (1H, d, J = 5,5 Hz), 9,2-9,3 (1H, m), 9,64 (1H, ancho).

Ejemplo de Referencia 5**Síntesis de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propionato de etilo**

Se añadieron 5,05 g (19,8 mmoles) de hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina a una disolución acuosa de hidróxido de sodio, y la mezcla se extrajo con diclorometano. La disolución de extracción se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se disolvió en 50 ml de etanol y a esto se añadió acrilato de etilo (2,44 ml, 21,8 mmoles), y a continuación la mezcla de reacción se sometió a reflujo calentando durante 4 horas. La disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se concentró a presión reducida. Se añadió éter diisopropílico al residuo y la materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración, se lavó con éter diisopropílico, y se secó para obtener 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propionato de etilo (5,26 g) en forma de polvo de color blanco.

RMN H1 (CDCl₃) δ ppm: 1,28 (3H, t, J = 7,0 Hz), 2,50-2,63 (2H, m), 2,67-2,87 (6H, m), 3,11-3,24 (4H, m), 4,17 (2H, c, J = 7,0 Hz), 6,89 (1H, d, J = 7,8 Hz), 7,27 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,37-7,42 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 7,8 Hz).

Ejemplo de Referencia 6

Síntesis de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propan-1-ol

Se añadió hidruro de litio y aluminio (1,18 g, 24,8 mmoles) a una disolución de 5,26 g (16,5 mmoles) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propionato de etilo en una disolución en tetrahidrofurano (THF) (55 ml) enfriando con hielo, y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas. A la disolución de reacción, se le añadieron agua (1,2 ml), una disolución acuosa de hidróxido de sodio al 15% (1,2 ml), y agua (3,6 ml) por este orden y la mezcla se agitó a temperatura ambiente. La materia insoluble se eliminó mediante filtración, y el producto filtrado se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 3:2 → acetato de etilo) y se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propan-1-ol (0,23 g) en forma de polvo de color blanco.

RMN H1 (CDCl₃) δ ppm: 1,75-1,85 (2H, m), 2,74 (2H, t, J = 5,8 Hz), 2,75-2,85 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 3,85 (2H, t, J = 5,3 Hz), 5,19 (1H, s ancho), 6,88 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,27 (1H, dd, J = 7,9 Hz, J = 7,8 Hz), 7,39 (2H, s), 7,56 (1H, d, J = 8,0 Hz).

Ejemplo de Referencia 7

Síntesis de acetato de 4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butilo

Se suspendieron 1,0 g (3,9 mmoles) de hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina en 20 ml de dimetilformamida (DMF), y a esto se añadieron carbonato de potasio (1,3 g, 9,4 mmoles) y acetato de 4-bromobutilo (0,7 ml, 4,8 mmoles). La mezcla de reacción se agitó a 80°C durante 6 horas, se enfrió a temperatura ambiente, y a esto se añadió agua, y se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sodio, y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano:metanol = 30:1), y se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener acetato de 4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butilo (0,72 g) en forma de aceite de color amarillo claro.

RMN H1 (CDCl₃) δ ppm: 1,60-1,73 (4H, m), 2,07 (3H, s), 2,47 (2H, t, J = 7,2 Hz), 2,60-2,72 (4H, m), 3,17-3,22 (4H, m), 4,11 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,27 (1H, dd, J = 7,6 Hz, J = 8,0 Hz), 7,37-7,42 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz).

Ejemplo de Referencia 8

Síntesis de 4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butan-1-ol

Se añadió carbonato de potasio (3,87 g, 28 mmoles) a una disolución de 7,76 g (23,3 mmoles) de acetato de 4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butilo en una disolución metanólica al 90% (150 ml). La mezcla disolvente se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con diclorometano. La disolución de extracción se secó sobre sulfato de sodio y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 2:1 → 1:1), y se concentró a presión reducida para obtener 4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butan-1-ol (6,65 g) en forma de un aceite incoloro.

RMN H1 (CDCl₃) δ ppm: 1,60-1,74 (4H, m), 2,50-2,55 (2H, m), 2,70-2,80 (4H, m), 3,20-3,30 (4H, m), 3,60-3,63 (2H, m), 6,2 (1H, s ancho), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,27 (1H, dd, J = 7,6 Hz, J = 8,0 Hz), 7,39 (1H, s), 7,56 (1H, d, J = 8,0 Hz).

Ejemplo de Referencia 9

Síntesis de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-(3-cloropropil)piperazina

Se suspendieron 3,56 g (12,9 mmoles) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propan-1-ol en 30 ml de diclorometano, y a esto se añadieron tetracloruro de carbono (30 ml) y trifetilfosfina (4,06 g, 15,5 mmoles). La mezcla se sometió a reflujo calentando durante 3 horas. La disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente,

después se añadieron a esto metanol y diclorometano para homogeneizar la mezcla. Se añadió gel de sílice (30 g) a la disolución, y el disolvente se evaporó a presión reducida. El residuo obtenido se cargó en una columna de gel de sílice (300 g) y se extrajo con una mezcla disolvente de n-hexano:acetato de etilo = 2:1. La disolución de extracción se concentró a presión reducida para obtener 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-(3-cloropropil)piperazina (2,36 g) en forma de un aceite incoloro.

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,95-2,10 (2H, m), 2,60 (2H, t, $J = 7,2$ Hz), 2,65-2,75 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 3,65 (2H, t, $J = 6,6$ Hz), 6,89 (1H, dd, $J = 7,6$ Hz, $J = 0,7$ Hz), 7,27 (1H, dd, $J = 7,9$ Hz, $J = 7,8$ Hz), 7,38 (1H, d, $J = 5,6$ Hz), 7,41 (1H, d, $J = 5,7$ Hz), 7,55 (1H, d, $J = 8,0$ Hz).

Ejemplo de Referencia 10

Síntesis de 4-hidroxitiofeno-2-carboxilato de metilo

Se añadió gota a gota cloruro de tionilo (1,6 ml) a una disolución metanólica (20 ml) de ácido 4-hidroxitiofeno-2-carboxílico (1,1 g, 7,6 mmoles) enfriando con hielo. La mezcla disolvente se sometió a reflujo calentando durante 5 horas. La disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, se vertió en agua helada y se extrajo con acetato de etilo. La disolución de extracción con acetato de etilo se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 4:1) y se concentró/secó a presión reducida para obtener 4-hidroxitiofeno-2-carboxilato de metilo (0,7 g) en forma de polvo de color blanco. RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 3,90 (3H, s), 5,50-6,60 (1H, ancho), 6,64 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 7,43 (1H, d, $J = 1,8$ Hz).

Ejemplo de Referencia 11

Síntesis de 6-hidroxipirimidin-4-carboxilato de etilo

El compuesto del título se obtuvo utilizando ácido 6-hidroxipirimidin-4-carboxílico de la misma manera que en el Ejemplo de Referencia 10.

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,29 (3H, t, $J = 7,0$ Hz), 4,29 (2H, c, $J = 7,0$ Hz), 6,87 (1H, d, $J = 1,0$ Hz), 8,27 (1H, d, $J = 1,0$ Hz), 10,54 (1H, ancho).

Ejemplo de Referencia 12

Síntesis de 5-hidroxi-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo

Una disolución en éter dietílico (35 ml) de acetilendicarboxilato de dimetilo (5,0 g, 35 mmoles) se enfrió con un medio de congelación (sal y hielo). A esta disolución, se le añadió gota a gota una disolución en éter dietílico (15 ml) de metilhidrazina (0,63 ml, 35 mmoles) mientras se mantenía la temperatura a 0°C o menos. Una vez completada la adición gota a gota, la disolución se agitó a 0°C durante una hora. La materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración y se lavó con éter dietílico. La torta del filtro se calentó a 130°C durante 30 minutos y se enfrió a temperatura ambiente. Se añadió metanol a la torta, que se concentró a presión reducida. Se añadió acetato de etilo al residuo obtenido y el residuo se concentró a presión reducida. Se añadió acetato de etilo al residuo y la materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración, se lavó con acetato de etilo, y se secó para obtener 5-hidroxi-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (3,26 g) en forma de polvo de color amarillo claro.

RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 3,58 (3H, s), 3,73 (3H, s), 5,77 (1H, s), 11,41 (1H, ancho).

Ejemplo de Referencia 13

Síntesis de 6-cloro-N-(2,2,2-trifluoroetil)nicotinamida

Se añadieron trietilamina (1,03 ml, 7,4 mmoles) y cloroformiato de isobutilo (0,76 ml, 5,5 mmoles) a una disolución en acetonitrilo (12 ml) de ácido 6-cloronicotínico (0,58 g, 3,6 mmoles) enfriando con hielo y la mezcla se agitó a 0°C durante 30 minutos. A la mezcla disolvente, se le añadió 2,2,2-trifluoroetilamina (0,88 ml, 11,2 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 10 minutos. Se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo. La disolución de extracción con acetato de etilo se secó sobre sulfato de magnesio, y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 5:1 $\rightarrow$ 1:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y se añadieron éter diisopropílico y n-hexano. La materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración y se secó para obtener 6-cloro-N-(2,2,2-trifluoroetil)nicotinamida (0,58 g) en forma de polvo de color amarillo claro.

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 4,15 (2H, cd, $J = 6,5$ Hz, 9,0 Hz), 6,35 (1H, ancho), 7,46 (1H, dd, $J = 0,7$ Hz, $J = 8,5$ Hz), 8,11 (1H, dd, $J = 2,5$ Hz, $J = 8,5$ Hz), 8,77 (1H, dd, $J = 0,7$ Hz, $J = 2,5$ Hz).

Ejemplo de Referencia 14

Síntesis de N-(2,2,2-trifluoroetil)-4-cloropiridin-2-carboxamida

Se añadieron 1-hidroxibenzotriazol (0,53 g, 3,5 mmoles), hidrocloreuro de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (WSC) (0,67 g, 3,5 mmoles) y 2,2,2-trifluoroetilamina (0,51 ml, 6,35 mmoles) a una disolución en diclorometano (5 ml) de ácido 4-cloropiridin-2-carboxílico (0,5 g, 3,17 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una hora. Se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo. La disolución de extracción con acetato de etilo se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 11:1 → 5:1). El producto purificado se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener N-(2,2,2-trifluoroetil)-4-cloropiridin-2-carboxamida (435 mg) en forma de polvo de color blanco. RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 4,13 (2H, cd, J = 6,8 Hz, 9,0 Hz), 7,49 (1H, dd, J = 2,1 Hz, J = 5,3 Hz), 8,22 (1H, dd, J = 0,4 Hz, J = 2,1 Hz), 8,30 (1H, ancho), 8,49 (1H, dd, J = 0,4 Hz, J = 5,3 Hz).

Ejemplo de Referencia 15**Síntesis de 2-clorotiazol-4-carboxamida**

Se añadieron 1-hidroxibenzotriazol (0,56 g, 3,7 mmoles), hidrocloreuro de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (WSC) (0,7 g, 3,7 mmoles) y agua amoniacal (28%, 0,5 ml) a una disolución en diclorometano (10 ml) de ácido 2-clorotiazol-4-carboxílico (0,5 g, 3,06 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 46 horas. Se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo. La disolución de extracción con acetato de etilo se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 3:5 → acetato de etilo). El producto purificado se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener 2-clorotiazol-4-carboxamida (475 mg) en forma de polvo de color blanco. RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 5,70 (1H, ancho), 7,01 (1H, ancho), 8,06 (1H, s).

Ejemplo de Referencia 16**Síntesis de N-metil-2-clorotiazol-5-carboxamida**

El compuesto del título se obtuvo utilizando ácido 2-clorotiazol-5-carboxílico de la misma manera que en el Ejemplo de Referencia 13. RMN ^2H (CDCl_3) δ ppm: 3,00 (3H, d, J = 4,9 Hz), 5,92 (1H, ancho), 7,84 (1H, ancho).

Ejemplo de Referencia 17**Síntesis de 6-metoxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona**

Se añadió paladio/carbono al 5% (1,5 g) a una disolución etanólica (250 ml) de 2-(4-metoxi-2-nitrofenoxi)-2-metilpropionato de etilo (14,6 g, 51,6 mmoles) para realizar la reducción catalítica a temperatura ambiente. El catalizador se eliminó mediante filtración y el producto filtrado se concentró a presión reducida. Se añadió agua al residuo obtenido, que después se extrajo con acetato de etilo. La disolución de extracción se secó sobre sulfato de magnesio, y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 9:1). El producto purificado se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener 6-metoxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona (7,0 g) en forma de polvo de color blanco. RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,53 (6H, s), 3,78 (3H, s), 6,40 (1H, d, J = 2,8 Hz), 6,52 (1H, dd, J = 2,8 Hz, J = 8,8 Hz), 6,88 (1H, d, J = 8,7 Hz), 8,66 (1H, s ancho).

Ejemplo de Referencia 18**Síntesis de 6-hidroxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona**

Una disolución en diclorometano (36 ml) de tribromuro de boro 2M se añadió gota a gota a una disolución en diclorometano de 6-metoxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona (5,0 g, 26 mmoles) enfriando con hielo y la mezcla se agitó durante la noche. Se añadió agua a la disolución de reacción para descomponer los reactivos presentes en exceso. La disolución de reacción se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 2:1). El producto purificado se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener 6-hidroxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona (4,02 g) en forma de polvo de color blanco. RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1,34 (6H, s), 6,25-6,40 (2H, m), 6,70 (1H, d, J = 8,5 Hz), 9,09 (1H, s), 10,41 (1H, s ancho).

Ejemplo de Referencia 19

Síntesis de 6-hidroxi-2-metil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona

El compuesto del título se obtuvo utilizando 6-metoxi-2-metil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona de la misma manera que en el Ejemplo de Referencia 18.

Polvo de color blanco

RMN ^1H (DMSO- d_6) δ ppm: 1,34 (3H, d, J = 6,8 Hz), 9,46 (1H, c, J = 6,8 Hz), 6,23-6,27 (1H, m), 6,33 (1H, d, J = 2,7 Hz), 6,70 (1H, d, J = 8,6 Hz), 9,11 (1H, s), 10,44 (1H, s ancho).

Ejemplo de Referencia 20**Síntesis de 4-(4-metoxifenil)-1-(tolueno-4-sulfonil)piperidina**

Se añadió cloruro de p-toluenosulfonilo (4,39 g, 23 mmoles) a una disolución en piridina (30 ml) de 4-(4-metoxifenil)piperidina (4,0 g, 21 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Se añadió agua a la mezcla disolvente, que después se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con ácido clorhídrico y agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 1:1). El producto purificado se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener 4-(4-metoxifenil)-1-(tolueno-4-sulfonil)piperidina (4,8 g) en forma de polvo de color blanco. RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,60-1,90 (4H, m), 2,30-2,40 (3H, m), 2,46 (3H, s), 3,78 (3H, s), 3,90-3,95 (2H, m), 6,84 (2H, dd, J = 1,9, J = 6,8 Hz), 7,07 (2H, dd, J = 1,9, J = 6,8 Hz), 7,35 (2H, d, J = 8,2 Hz), 7,68 (2H, d, J = 8,2 Hz).

Ejemplo de Referencia 21**Síntesis de 4-(4-hidroxifenil)-1-(tolueno-4-sulfonil)piperidina**

El compuesto del título se obtuvo utilizando 4-(4-metoxifenil)-1-(tolueno-4-sulfonil)piperidina de la misma manera que en el Ejemplo de Referencia 18.

Polvo de color pardo

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,60-1,90 (4H, m), 2,30-2,50 (3H, m), 2,45 (3H, s), 3,90-3,95 (2H, m), 6,67 (1H, s ancho), 6,80 (2H, dd, J = 1,9, J = 6,8 Hz), 7,02 (2H, dd, J = 1,8, J = 6,9 Hz), 7,35 (2H, d, J = 8,1 Hz), 7,68 (2H, d, J = 8,1 Hz).

Ejemplo de Referencia 22**Síntesis de 4-bromo-2-hidroximetil-6-metoxifenol**

Se añadió borohidruro de sodio (0,28 g, 6,9 mmoles) a una disolución en THF (30 ml) de 5-bromo-2-hidroxi-3-metoxibenzaldehído (3,2 g 13,8 mmoles) enfriando con hielo y la mezcla se agitó a 0°C durante 2 horas. Se añadió ácido acético a la disolución de reacción para ajustar el pH a 3, se añadió ácido clorhídrico al 10% a la mezcla de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo. La sustancia extraída se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 5:1 $\rightarrow$ 1:1) y se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener 4-bromo-2-hidroximetil-6-metoxifenol (3,23 g) en forma de aceite de color amarillo claro.

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 3,88 (3H, s), 4,71 (2H, s), 6,94 (1H, d, J = 2,0 Hz), 7,03 (1H, d, J = 2,0 Hz).

Ejemplo de Referencia 23**Síntesis de 5-bromo-3-metoxi-2-metoximetoxibenzaldehído**

Se añadieron etilidipropilamina (3,01 ml, 17,1 mmoles) y cloruro de metoximetilo (1,5 ml, 15,7 mmoles) a una disolución en diclorometano (30 ml) de 5-bromo-2-hidroxi-3-metoxibenzaldehído (3,3 g, 14,3 mmoles) enfriando con hielo, y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. La disolución de reacción se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio, y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 3:1 $\rightarrow$ 11:9). El producto purificado se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener 5-bromo-3-metoxi-2-metoximetoxibenzaldehído (4,2 g) en forma de un sólido de color amarillo claro.

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 3,56 (3H, s), 3,89 (3H, s), 5,21 (2H, s), 7,23 (1H, d, J = 2,5 Hz), 7,56 (1H, d, J = 2,5 Hz), 10,39 (1H, s).

Ejemplo de Referencia 24**Síntesis de 3-metoxi-2-metoximetoxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzalaldehído**

Se añadieron 2-oxazolidinona (0,38 g, 4,36 mmoles), dipaladio-tris(dibencilidenacetona) (0,17 g, 0,18 mmoles), 9,9-dimetil-4,5-bis(difenilfosfino)xanteno (XANTPHOS) (0,32 g, 0,55 mmoles) y carbonato de cesio (1,66 g, 5,1 mmoles) a una disolución en dioxano (20 ml) de 5-bromo-3-metoxi-2-metoximetoxibenzaldehído (1,0 g, 3,6 mmoles) y la mezcla se agitó a 100°C durante 24 horas en atmósfera de argón. La disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente y a esto se añadió acetato de etilo. La mezcla se filtró con cerite. El producto filtrado se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 4:1 → 1:1). El producto purificado se concentró a presión reducida. Se añadieron acetato de etilo y éter diisopropílico al residuo. La materia insoluble purificada de este modo se obtuvo mediante filtración y se secó para obtener 3-metoxi-2-metoximetoxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzalaldehído (0,5 g) en forma de polvo de color blanco.

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 3,57 (3H, s), 3,93 (3H, s), 4,06-4,12 (2H, m), 4,48-4,54 (2H, m), 5,21 (2H, s), 6,96 (1H, d, J = 2,5 Hz), 8,18 (1H, d, J = 2,5 Hz), 10,45 (1H, s).

Ejemplo de Referencia 25

Síntesis de 3-(3-metoxi-4-metoximetoxi-5-metilfenil)oxazolidin-2-ona

Se disolvió 3-metoxi-2-metoximetoxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzalaldehído (0,5 g, 1,79 mmoles) en una mezcla disolvente de ácido acético (5 ml) y etanol (5 ml) y a esto se añadió paladio sobre carbono al 10% (0,05 g) para realizar la reducción catalítica a 1 atm a 50°C durante 4 horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se filtró con cerite. El producto filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se disolvió en ácido acético (10 ml) y a esto se añadió paladio sobre carbono al 10% (0,05 g) para realizar la reducción catalítica a 1 atm a 50°C durante 6 horas. El disolvente se eliminó a presión reducida para obtener 3-(3-metoxi-4-metoximetoxi-5-metilfenil)oxazolidin-2-ona en forma de un producto bruto, que se sometió a la siguiente reacción tal cual.

RMN ^1H (CECl_3) δ ppm: 2,32 (3H, s), 3,56 (3H, s), 3,85 (3H, s), 3,98-4,06 (2H, m), 4,43-4,50 (2H, m), 5,05 (2H, s), 6,61 (1H, d, J = 2,3 Hz), 7,36 (1H, d, J = 2,3 Hz).

Ejemplo de Referencia 26

Síntesis de 3-(4-hidroxi-3-metoxi-5-metilfenil)oxazolidin-2-ona

Se añadió ácido clorhídrico al 10% (5 ml) a una disolución metanólica (5 ml) de 3-(3-metoxi-4-metoximetoxi-5-metilfenil)oxazolidin-2-ona (0,48 g, 1,79 mmoles) y la mezcla se agitó a 50°C durante 10 minutos. Se añadió agua a la disolución de reacción, que se extrajo con acetato de etilo. La sustancia extraída se secó sobre sulfato de magnesio, y después de eso se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener 3-(4-hidroxi-3-metoxi-5-metilfenil)oxazolidin-2-ona (434 mg) en forma de polvo de color amarillo claro.

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 2,26 (3H, s), 3,90 (3H, s), 4,02 (2H, dd, J = 7,0 Hz, J = 8,5 Hz), 4,46 (2H, dd, J = 7,0 Hz, J = 8,5 Hz), 5,55 (1H, ancho), 6,56 (1H, d, J = 2,5 Hz), 7,31 (1H, d, J = 2,5 Hz).

Ejemplo de Referencia 27

Síntesis de 1-(8-metoxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,3]dioxin-6-il)pirrolidin-2-ona

El compuesto del título se obtuvo utilizando 6-bromo-8-metoxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,3]dioxin y 2-pirrolidona de la misma manera que en el Ejemplo de Referencia 25.

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,59 (6H, s), 2,09-2,21 (2H, m), 2,60 (2H, t, J = 8,3 Hz), 3,82 (2H, t, J = 7,0 Hz), 3,88 (3H, s), 4,83 (2H, s), 6,67 (1H, d, J = 2,5 Hz), 7,24 (1H, d, J = 2,5 Hz).

Ejemplo de Referencia 28

Síntesis de 1-(4-hidroxi-3-hidroximetil-5-metoxifenil)pirrolidin-2-ona

Se añadió ácido clorhídrico al 10% (4 ml) a una disolución en THF (7 ml) de 1-(8-metoxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,3]dioxin-6-il)pirrolidin-2-ona (0,36 g, 1,3 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 17 horas. Se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con diclorometano. La sustancia extraída se secó sobre sulfato de magnesio, se concentró a presión reducida y se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano : metanol: = 300: 1 → 30:1). El producto purificado se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener 1-(4-hidroxi-3-hidroximetil-5-metoxifenil)pirrolidin-2-ona (0,31 g) en forma de polvo de color pardo claro.

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 2,05-2,28 (3H, m), 2,26 (2H, t, J = 7,5 Hz), 3,84 (2H, t, J = 7,0 Hz), 3,91 (3H, s), 4,74 (2H, s), 5,90 (1H, ancho), 6,78 (1H, d, J = 2,5 Hz), 7,52 (1H, d, J = 2,5 Hz).

Ejemplo de Referencia 29

Síntesis de 3-metoxi-2-metoximetoxi-5-(2-oxopirrolidin-1-il)benzalaldehído

El compuesto del título se obtuvo utilizando 5-bromo-3-metoxi-2-metoximetoxibenzaldehído y 2-pirrolidona de la misma manera que en el Ejemplo de Referencia 25. RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 2,11-2,24 (2H, m), 2,63 (2H, t, J = 8,3 Hz), 3,56 (3H, s), 3,89 (2H, t, J = 7,0 Hz), 3,92 (3H, s), 5,21 (2H, s), 7,08 (1H, d, J = 2,5 Hz), 8,28 (1H, d, J = 2,5 Hz), 10,46 (1H, s).

Ejemplo de Referencia 30

Síntesis de 1-(4-hidroxi-3-metoxi-5-metilfenil)pirrolidin-2-ona

Se disolvió 3-metoxi-2-metoximetoxi-5-(2-oxopirrolidin-1-il)benzaldehído (0,72 g, 2,56 mmoles) en una mezcla disolvente de ácido acético (5 ml) y etanol (7 ml) y a esto se añadió paladio sobre carbono al 10% (70 mg) para realizar la reducción catalítica a 50°C durante 10 horas. La disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se filtró con cerite. La torta del filtro se concentró a presión reducida. El residuo obtenido de este modo se disolvió en diclorometano (15 ml) y a esto se añadieron ácido trifluoroacético (2,0 ml, 25,6 mmoles) y trietilsilano (2,0 ml, 12,8 mmoles) enfriando con hielo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla se concentró a presión reducida y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 5:1 $\rightarrow$ acetato de etilo). El producto purificado se concentró a presión reducida para obtener 1-(4-hidroxi-3-metoxi-5-metilfenil)pirrolidin-2-ona (0,41 g) en forma de aceite de color amarillo claro.

RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 2,17-2,25 (5H, m), 2,72 (2H, t, J = 8,3 Hz), 3,88 (2H, t, J = 7,0 Hz), 3,89 (3H, s), 6,66 (1H, d, J = 2,5 Hz), 7,15 (1H, d, J = 2,5 Hz).

Ejemplo de Referencia 31

Síntesis de 3,4-diacetoxi-5-metilbenzaldehído

Se añadió anhídrido acético (1,2 ml, 12 mmoles) a una disolución en piridina (4 ml) de 3,4-dihidroxi-5-metilbenzaldehído (0,72 g, 4,7 mmoles) y la mezcla se agitó a 0°C durante una hora. Se añadió ácido clorhídrico al 10% a la disolución de reacción, que se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con una disolución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 5:1 $\rightarrow$ 3:1). El producto purificado se concentró a presión reducida para obtener 3,4-diacetoxi-5-metilbenzaldehído (0,98 g) en forma de aceite de color amarillo claro.

RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 2,29 (3H, s), 2,32 (3H, s), 2,35 (3H, s), 7,58 (1H, d, J = 1,6 Hz), 7,67 (1H, d, J = 1,6 Hz), 9,93 (1H, s).

Ejemplo de Referencia 32

Síntesis de 7-hidroxi-1,4-dihidrobenczo[d][1,3]oxazin-2-ona

El compuesto del título se obtuvo utilizando 7-metoximetoxi-1,4-dihidrobenczo[d][1,3]oxazin-2-ona de la misma manera que en el Ejemplo de Referencia 26.

Polvo de color blanco

RMN H^1 ($DMSO-d_6$) δ ppm: 5,14 (2H, s), 6,35 (1H, d, J = 2,2 Hz), 6,39 (1H, dd, J = 8,1, J = 2,2 Hz), 6,97 (1H, d, J = 8,1 Hz), 9,98 (1H, s ancho).

Ejemplo de Referencia 33

Síntesis de 7-metoxi-3,4-dihidro-1H-quinazolin-2-ona

Se añadieron 2-aminometil-5-metoxianilina (1,2 g, 7,9 mmoles) y carbonildiimidazol (1,53 g, 9,5 mmoles) a THF (100 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. La materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración, se lavó con diclorometano y agua, se secó para obtener 7-metoxi-3,4-dihidro-1H-quinazolin-2-ona (1,11 g) en forma de polvo de color blanco.

RMN H^1 ($DMSO-d_6$) δ ppm: 3,68 (3H, s), 4,23 (2H, s), 6,35 (1H, d, J = 2,5 Hz), 6,42 (1H, dd, J = 8,3 Hz, J = 2,5 Hz), 6,96 (1H, d, J = 8,3 Hz), 8,90 (1H, s ancho).

Ejemplo de Referencia 34

Síntesis de 7-hidroxi-3,4-dihidro-1H-quinazolin-2-ona

El compuesto del título se obtuvo utilizando 7-metoxi-3,4-dihidro-1H-quinazolin-2-ona de la misma manera que en el Ejemplo de Referencia 18.

Polvo de color pardo claro

RMN ^1H (DMSO- d_6) δ ppm: 4,18 (2H, s ancho), 6,75-6,85 (1H, m), 7,01 (1H, dd, $J = 2,0$ Hz, $J = 9,0$ Hz), 8,07 (1H, d, $J = 9,0$ Hz), 8,87 (1H, s ancho), 9,48 (1H, s ancho), 13,21 (1H, s ancho).

Ejemplo de Referencia 35

Síntesis de 5-(3-cloropropoxi)-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo

Se añadieron carbonato de cesio (2,08 g, 6,4 mmoles) y 1-bromo-3-cloropropano (1,6 ml) a una disolución en DMF (5 ml) de 5-hidroxi-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (0,83 g, 5,3 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 21 horas. Se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. La disolución de reacción se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 100:1 $\rightarrow$ 4:1). El producto purificado se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener 5-(3-cloropropoxi)-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (1,17 g) en forma de un sólido de color blanco.

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 2,21-2,32 (2H, m), 3,72 (2H, t, $J = 6,3$ Hz), 3,72 (2H, s), 3,91 (3H, s), 4,24 (2H, t, $J = 5,8$ Hz), 6,10 (1H, s).

Ejemplo de Referencia 36

Síntesis de 7-(3-cloropropoxi)-2H-1,4-benzoxazin-3(4H)-ona

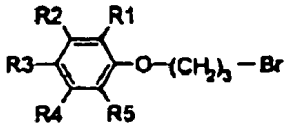
El compuesto del título se obtuvo utilizando 7-hidroxi-2H-1,4-benzoxazin-3(4H)-ona y 1-bromo-3-cloropropano de la misma manera que en el Ejemplo de Referencia 35.

Cristales en forma de agujas de color pardo claro (etanol-n-hexano)

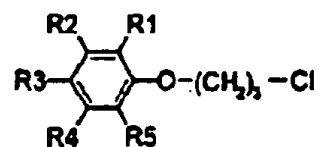
Punto de fusión: 119-120°C

Los compuestos enumerados en las siguientes Tablas 1 a 12 se produjeron utilizando sustancias de partida apropiadas de la misma manera que en los Ejemplos de Referencia de 1 a 36.

[Tabla 1]

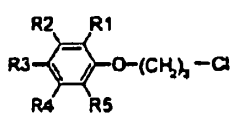
						
Ejemplo de Referencia	R1	R2	R3	R4	R5	RMN
37	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	-H	RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,25 (3H, t, $J = 7,5$ Hz), 2,29-2,39 (2H, m), 3,43-3,54 (2H, m), 3,61 (2H, t, $J = 6,3$ Hz), 4,15 (2H, t, $J = 5,8$ Hz), 5,99 (1H, ancho), 6,89-6,95 (2H, m), 7,70-7,75 (2H, m)
38	-H	-H	-CONHC ₃ H ₇	-H	-H	RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 0,99 (3H, t, $J = 7,5$ Hz), 1,57-1,68 (2H, m), 2,23-2,36 (2H, m), 3,37-3,45 (2H, m), 3,61 (2H, t, $J = 6,3$ Hz), 3,75 (2H, t, $J = 6,3$ Hz), 4,12-4,18 (2H, m), 6,02 (1H, ancho), 6,71-6,95 (2H, m), 7,71-7,75 (2H, m)

[Tabla 2]

						
Ejemplo de Referencia	R1	R2	R3	R4	R5	RMN

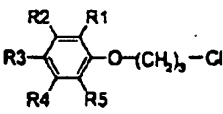
39	-H	-H	-NO ₂	-H	-F	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,20-2,45 (2H, m), 3,70-3,80 (2H, m), 4,30-4,35 (2H, m), 7,07 (1H, dd, J = 8,2, 8,9 Hz), 8,00 (1H, dd, J = 2,7, 10,7 Hz), 8,07 (1H, dd, J = 0,9, 9,0 Hz).
40	-H	-H	-NH ₂	-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,14-2,24 (2H, m), 3,26 (2H, ancho), 3,73 (2H, t, J = 8,3 Hz), 4,04 (2H, t, J = 5,8 Hz), 8,81-6,87 (2H, m), 6,72-6,78 (2H, m)
41	-H	-H	NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,15-2,25 (2H, m), 3,74 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,76 (3H, s), 4,09 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,42 (1H, ancho), 6,85 (2H, dd, J = 25, 8,8 Hz), 7,21-7,33 (2H, m)
42	-H	-H	CH ₂ CON (C ₂ H ₅) ₂	-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,07-1,14 (6H, m), 2,17-2,30 (2H, m), 3,26-3,42 (4H, m), 3,63 (2H, s), 3,74 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,09 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,83-6,88 (2H, m), 7,14-7,19 (2H, m)
43	-H	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,28-2,37 (2H, m), 3,74 (2H, t, J = 8,5 Hz), 3,77 (3H, s), 4,11 (2H, t, J = 6,0 Hz), 6,50-6,67 (2H, m), 6,83 (1H, dd, J = 1,5 Hz, 7,6 Hz), 7,16-7,22 (2H, m)
44	-H	-H	-NHCO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,37 (3H, t, J = 7,4 Hz), 2,15-2,30 (2H, m), 3,07 (2H, c, J = 7,4 Hz), 3,75 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,10 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,41 (1H, s ancho), 6,88 (2H, td, J = 8,9, 3,4 Hz), 7,19 (2H, td, J = 6,9, 3,4 Hz),
45	-H	-H	-NH ₂	-H	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,15-2,30 (2H, m), 3,20-3,70 (2H, ancho), 3,75,3,95 (2H, m), 3,83 (3H, s), 4,07 (2H, t, J = 3 Hz), 6,24 (1H, dd, J = 26, 8,4 Hz), 6,33 (1H, d, J = 2,7 Hz), 6,77 (1H, d, J = 8,4 Hz).
46	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,20-2,30 (2H, m), 3,77 (3H, s), 3,86 (3H, s), 4,13 (2H, t, J = 6,0 Hz), 6,55 (1H, s ancho), 6,73 (1H, dd, J = 2,4, 8,6 Hz), 6,84 (1H, d, J = 8,6 Hz), 7,20 (1H, s ancho).
47	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,23 (3H, t, J = 7,3 Hz), 2,20-2,30 (2H, m), 3,40-3,50 (2H, m), 3,74 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,14 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,13 (1H, s ancho), 6,85-6,95 (2H, m), 7,70-7,75 (2H, m).
48	-H	-H	-NHCON (CH ₃) ₂	-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,15-2,25 (2H, m), 3,02 (6H, s), 3,74 (2H, t, J = 6,4 Hz), 4,08 (2H, t, J = 5,9 Hz), 6,20 (1H, s ancho), 6,84 (2H, dd, J = 2,0, 8,8 Hz), 7,26 (2H, dd, J = 21, 6,8 Hz).
49	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-Cl	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,39 (3H, t J = 7,0 Hz), 2,27-2,37 (2H, m), 3,81 (2H, t J = 6,8 Hz), 4,25 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,36 (2H, c, J = 7,0 Hz), 6,86 (1H, d, J = 8,5 Hz), 7,93 (1H, dd, J = 2,0 Hz, 8,5 Hz), 8,06 (1H, d, J = 2,0 Hz)

[Tabla 3]

						
Ejemplo de Referencia	R1	R2	R3	R4	R5	RMN
50	-H	H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-Cl	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,26 (3H, t, J = 7,0 Hz), 2,23-2,33 (2H, m), 3,52 (2H, s), 3,80 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,15 (2H, c, J = 7,0 Hz), 6,90 (1H, d, J = 8,3 Hz), 7,13 (1H, dd, J = 2,0 Hz, 8,3 Hz), 7,30 (1H, d, J = 2,0 Hz)

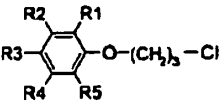
51	-H	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,19-2,29 (2H, m), 2,76 (3H, d, J = 4,8 Hz), 3,52 (2H, s), 3,76 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,12 (2H, t, J = 5,8 Hz), 5,35 (1H, ancho), 6,86-6,92 (2H, m), 7,13-7,18 (2H, m)
52	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ NHCH ₃	-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,18-2,27 (2H, m), 2,43 (2H, s), 2,72-2,83 (4H, m), 3,71 (3H, s), 3,75 (4H, t, J = 6,3 Hz), 4,09 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,83-6,86 (2H, m), 7,10-7,14 (2H, m)
53	-H	-H	- (CH ₂) ₂ N(CH ₃)CO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,42 (9H,s), 2,17-2,27 (2H, m), 2,67-2,86 (6H, m), 3,35-3,41 (2H, m), 3,74 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,09 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,83 (2H, d, J = 8,5 Hz), 7,00-7,16 (2H, m)
54	-H	-H	-NH ₂	-H	-F	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,15-2,26 (2H, m), 3,54 (2H, s ancho), 3,76 (2H, t, J = 6,4 Hz), 4,05-4,15 (2H, m), 6,35-6,40 (1H, m), 8,48 (1H, dd, J = 0,9, 12,6 Hz), 8,82 (1H, dd, J = 8,5, 8,5 Hz).
55	-H	-H	NHCO ₂ CH ₃	-H	-F	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,20-2,30 (2H, m), 3,77 (2H, t, J = 6,5 Hz), 3,77 (3H, s), 4,10-4,20 (2H, m), 6,57 (1H, s ancho), 6,85-7,00 (2H, m), 7,25-7,30 (1H, m).
56	-H		-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-F	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,26 (3H, t, J = 7,0 Hz), 2,21-2,30 (2H, m), 3,53-3,62 (2H, s), 3,77 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,11-4,20 (4H, m), 8,89-7,06 (3H, m)
57	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-Br	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,39 (3H, t, J = 7,0 Hz), 2,27-2,37 (2H, m), 3,82 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,24 (2H, t, J = 5,8 Hz), 4,35 (2H, q, J = 7,0 Hz), 6,92 (1H, d, J = 8,5 Hz), 7,98 (1H, dd, J = 2,0H, 8,5 Hz), 8,23 (1H, d, J = 2,0 Hz)
58	-H	-H	-CHO	- OCH ₃	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,23-2,34 (2H, m), 3,76 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,91 (3H, s), 4,20 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,46 (1H, d, J = 2,0 Hz), 6,56 (1H, dd, J = 2,0 Hz, 6,3 Hz), 7,81 (1H, d, J = 8,3 Hz), 10,29 (1H, s)
59	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-NO ₂	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,41 (3H, t, J = 7,0 Hz), 2,26-2,40 (2H, m), 3,81 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,32-4,44 (4H, m), 7,15 (1H, d, J = 8,8 Hz), 8,22 (1H, dd, J = 2,0 Hz, 8,8 Hz), 8,52 (1H, d, J = 2,0 Hz)

[Tabla 4]

						
Ejemplo de Referencia	R1	R2	R3	R4	R5	RMN
60	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	- NO ₂	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,26 (3H, t, J = 7,3 Hz), 2,25-2,35 (2H, m), 3,45-3,55 (2H, m), 3,80 (2H, t, J = 1 Hz), 4,30-4,35 (2H, m), 6,34 (1H, s ancho), 7,15 (1H, d=8,8 Hz), 8,04 (1H, dd, J = 2,3, 8,8 Hz), 8,25 (1H, d, J = 2,3 Hz).
61	-H	-H	-CONH ₂	-OCH ₃	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,21-2,35 (2H, m), 3,75 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,95 (3H, s), 4,18 (2H, t, J = 8,8 Hz), 5,67 (1H, ancho), 6,51 (1H, d, J = 25 Hz), 6,61 (1H, dd, J = 2,5 Hz, 8,8 Hz), 7,59 (1H, ancho), 8,18 (1H, d, J = 8,8 Hz)
62	-H	-H	-CONHCH ₃	-OCH ₃	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,20-2,30 (2H, m), 2,99 (3H, d, J = 5,0 Hz), 3,75 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,94 (3H, s), 4,17 (2H, t, J = 6,0 Hz), 6,49 (1H, d, J = 2,5 Hz), 6,60 (1H, dd,

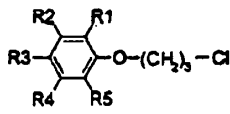
						J = 2,5 Hz, 8,8 Hz). 7,70 (1H, ancho 8,19 (1H, d, J = 8,8 Hz)
63	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-OCH ₃	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm 1,23 (3H, t, J = 7,3 Hz), 2,20-2,30 (2H, m), 3,43-3,54 (2H, m), 3,75 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,94 (3H, s), 4,17 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,49 (1H, d, J = 2,5 Hz), 6,60 (1H, dd, J = 2,5 Hz, 8,8 Hz), 7,70 (1H, ancho), 8,18 (1H, d, J = 8,8 Hz)
64	-H	-H	-CONHCH ₂ CF ₃	-OCH ₃	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,21-2,31 (2H, m), 3,75 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,98 (3H, s), 4,07-4,21 (4H, m), 6,51 (1H, d, J = 5 Hz), 6,62 (1H, dd, J = 2,5 Hz, 8,8 Hz), 8,09 (1H, ancho), 8,18 (1H, d, J = 8,8 Hz)
65	-H	-H	-CH=CHCO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,33 (3H, t, J = 7,0 Hz), 2,20-2,30 (2H, m), 3,73 (2H, t, J = 6,3 Hz), d, 15 (2H, t, J = 5,8 Hz), 4,25 (2H, c, J = 7,0 Hz), 8,31 (1H, d, J = 18,0 Hz), 8,88-8,93 (2H, m), 7,44-7,50 (2H, m), 7,64 (1H, d, J = 16,0 Hz)
68	-F	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,40 (3H, t, J = 7,0 Hz), 2,25-2,34 (2H, m), 3,78 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,25 (2H, J = 5,8 Hz), 4,37 (2H, c, J = 7,0 Hz), 7,08-7,15 (1H, m), 7,62-7,70 (2H, m)
67	-H	-H	-CO ₂ H	-CH ₃	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 221-231 (2H, m), 2,64 (3H, s), 3,75 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,18 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,77-8,81 (2H, m), 8,06 (1H, d, J = 9,5 Hz), 11,00 (1H, ancho)
68	-Cl	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,40 (3H, t, J = 7,0 Hz), 2,25-2,37 (2H, m), 3,82 (2H, t, J = 6,3 Hz), 1,25 (2H, t, J = 5,8 Hz), 4,38 (2H, c, J = 7,0 Hz), 7,42 (1H, d, J = 8,5 Hz), 7,56, 7,62 (2H, m).
69	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₆	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,39 (3H, t, J = 7,0 Hz), 2,24-2,34 (2H, m), 2,26 (3H, s), 3,78 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,19 (2H, t, J = 5,8 Hz), 4,37 (2H, c, J = 7,0 Hz), 7,19 (1H, d, J = 7,8 Hz), 7,49 (1H, d, J = 1,5 Hz), 7,57 (1H, dd, J = 1,5 Hz, 7,8 Hz)

[Tabla 5]

						
Ejemplo de Referencia	R1	R2	R3	R4	R5	RMN
70	-H	-H	-CONH ₂	-CH ₃	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,16-2,29 (2H, m), 2,51 (3H, s), 3,75 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,14 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,53 (2H, ancho), 6,71 (2H, m), 7,45 (1H, d, J = 8,3 Hz)
71	-H	-H	-CONRCH ₃	-CH ₃	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,18-2,28 (2H, m), 2,45 (3H, s), 2,98 (3H, d, J = 4,8 Hz), 3,74 (2H, t, J = 8,3 Hz), 4,12 (2H, t, J = 5,8 Hz), 5,72 (1H, ancho), 8,88-8,75 (2H, m), 7,32 (1H, d, J = 8,3 Hz)
72	-H	-H	-CONHC ₂ H ₃	-CH ₃	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,24 (3H, t, J = 7,3 Hz), 2,19-2,28 (2H, m), 2,45 (3H, s), 3,41-3,52 (2H, m), 3,74 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,12 (2H, t, J = 6,0 Hz), 5,88 (1H, ancho), 8,84-8,75 (2H, m), 7,32 (1H, d, J = 8,3 Hz)
73	-CH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₃	-H	CH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,38 (3H, t, J = 7,0 Hz), 2,21-2,28 (2H, m), 2,31 (6H, s), 3,84 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,93 (2H, t, J = 5,8 Hz), 4,35 (2H, t, J = 7,0 Hz), 7,72 (2H,

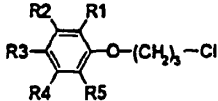
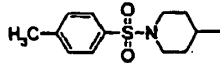
						s)
74	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,39(3H, t, J = 7,1 Hz), 2,26-2,38 (2H, m), 3,78(2H, t, J = 8,3 Hz), 3,81(3H, s), 4,22(2H, t, J = 5,8 Hz), 4,36(2H, c, J = 7,1 Hz), 8,89(1H, d, J = 8,3 Hz), 7,58(1H, d, J = 2,0 Hz), 7,70 (1H, d, J = 8,3 Hz)
75	-OCH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm 1,40(3H, t, J = 7,0 Hz), 2,13-2,23 (2H, m), 3,85(2H, t, J = 8,3 Hz), 3,90(6H, s), 4,17(2H, t, J = 5,8 Hz), 4,38(2H, c, J = 7,0 Hz), 7,30(2H, s)
76	-CH ₃	-H	-CHO	-H	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,17-2,28 (2H, m), 2,34(3H, s), 3,83(2H, t, J = 6,3 Hz), 3,91(3H, s), 4,18(2H, t, J = 5,8 Hz), 7,31(1H, s), 9,86(1H, s)
77	-CH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,18-2,28 (2H, m), 2,32(6H, s), 3,83(2H, t, J = 3 Hz), 3,90(3H, s), 4,16(2H, t, J = 5,8 Hz), 7,50(1H, d, J = 2,0 Hz), 7,80(1H, d, J = 20 Hz)
78	-CH ₃	-H	-CONH ₂	-H	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 217-2,27 (2H, m), 2,30(3H, s), 3,83(2H, t, J = 3 Hz), 3,89(3H, s), 4,12(2H, t, J = 5,8 Hz), 5,24-8,28(2H, ancho), 7,15(1H, d, J = 20 Hz), 7,32 (1H, d, J = 2,0 Hz)
79	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm 2,17-236 (2H, m), 2,29(3H, s), 3,00(3H, d, J = 5,0 Hz), 3,83(2H, t, J = 8,3 Hz), 3,88(3H, s), 4,10(2H, t, J = 5,8 Hz), 8,06(1H, ancho), 7,08(1H, d, J = 1,9Mz), 7,28 (1H, d, J = 1,8 Hz)

[Tabla 6]

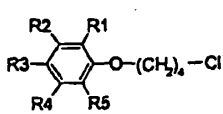
						
Ejemplo de Referencia	R1	R2	R3	R4	R5	RMN
80	-CH ₃	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm 1,26 (3H,t, J = 7,3 Hz), 2-17-2,28 (2H, m), 2,30 (3H, s), 3,43-3,54 (2H, m), 3,83 (2H, t J = 6,3 Hz), 3,89 (3H, s), 4,10 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,02 (1H, ancho), 7,07 (1H, d, J = 20 Hz), 7,28 (1H, d, J = 2,0 Hz)
81	-CH ₃	-H	-NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm 1,51 (9H,s), 214-2,28 (2H, m), 2,23 (3H, s), 3,82 (2H, t, J = 6,3Mz), 3,83 (3H, s), 3,98 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,34 (1H, ancho), 6,59 (1H, d, J = 2,5 Hz), 7,01 (1H, d, J = 2,5 Hz)
82	-CH ₃	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,17-2,29 (2H, m), 2,30 (3H, s), 3,83 (2H, t, J = 8,3 Hz), 3,88 (6H, s), 4,13 (2H, t, J = 5,8 Hz), 7,44 (1H, d, J = 2,0 Hz), 7,51 (1H, d, J = 20 Hz)
83	-CH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,15-2,30 (2H, m), s), 3,89 (3H, s), 4,13 (2H, t, J = ,9 Hz), 7,43 (1H, d, J = 1,8 Hz), 7,50 (1H, d, J = 1,4 Hz).
84	-CH ₃	-H	-NH ₂	41	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,14-2,22 (2H, m), 2,19 (3H, 9), 3,47 (2H, ancho), 3,82 (2H, t, 1=5,3 Hz), 3,95 (2H, t, J = 4,8 Hz), 6,09-6,13 (2H,m)
85	-CH ₃	-H	-HCOCH ₃	-H	-OCH ₂	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm:2,11-2,28 (2H,m), 2,15 (3H, s), 2,24 (3H, s), 3,82 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,83 (3H, s), 4,01 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,66 (1H, d, J = 2,1 Hz), 7,02 (1H, ancho), 7,23 (1H, d, J = 2,1 Hz)

86	-CH ₃	-H	-CHO	-H	- OCOCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,17-2,27 (2H,m), 2,37 (6H, s), 3,79 (2H, t, J = 5,6 Hz), 4,11 (2H, t, J = 5,8 Hz), 7,46 (1H, d, J = 2,0 Hz), 7,62 (1H, d, J = 20 Hz), 9,88 (1H, s)
87	CH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	- OCOCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,16-2,26(2H,m), 2,35(3H, s), 2,38(3H, s), 3,79(2H, t, J = 6,3 Hz), 4,09(2H, t, J = 5,8 Hz), 7,67(1H, d, J = 2,0 Hz), 7,84(1H, d, J = 2,0 Hz)
88	-OH	-H	-CONHCH ₃	-H	-CH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm :221-2,35(2H,m), 2,32(3H, s), 2,99(3H, d, J = 4,9 Hz), 3,85(2H, t, J = 6,3 Hz), 4,05(2H, t, J = 5,8 Hz), 5,90(1H, ancho), 6,02(1H, ancho), 7,15(1H, d, J = 1,8 Hz), 7,20(1H, d, J = 2,0 Hz)
89	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-OC ₂ H ₅	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,46(3H, t, J = 7,0 Hz), 2,17-2,27 (2H, m), 2,28(3H, s), 2,99(3H, d, J = 5,0 Hz), 3,83(2H, t, J = 6,3 Hz). 4,08-4,15(4H, m 6,04(1H, ancho), 7,07(1H, d, J = 1,8 Hz), 7,25 (1H, d, J = 1,8 Hz)
90	-H	-H	-CO ₂ H	- OCH ₃	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,22-232 (2H, m), 3,75(2H, t, J = 6,3 Hz), 4,05(3H, s), 4,21(2H, t, J = 5,8 Hz), 6,55(1H, d, J = 2-5 Hz). 8,86(1H, d, J = 8,8 Hz), 8,14(1H, d, J = 8,8 Hz), 10,43(1H, ancho)

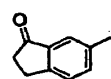
[Tabla 7]

						
Ejemplo de Referencia	R1	R2	R3	R4	R5	RMN
91	-H	-H		-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm 22-2,3 (2H, m), 3,77 (2H, 1 J = 6,3 Hz), 4,16 (2H, t, J = 5,8 Hz), 7,00 (2H, dd, J = 2,2, 6,7 Hz), 7,15-7,25 (2H, m 7,25-7,35 (2H, m), 7,78 (1H,s).
92	-H	-H		-H	-H	H-RMN (CDCl ₃) δ ppm: 2-26 (2H, t, J = 6,1 Hz), 3,75 (2H, t, J = 8,3 Hz 4,15 (2H,t, J = 5,7 Hz), 7,00 (1H, dd, J = 2,1, 6,9 Hz), 7,56 (1H, dd, J = 2,2, 7,1 Hz), 8,07 (1H, s), 8,45 (1H, s).
93	-H	-H		-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,70,1,90 (4H, m), 2,10-2,40 (3H, m), 2,45 (3H, s), 3,553,75 (2H, m), 3,90-3,95 (2H, m), 4,05-4,15 (2H, m), 6,84 (2H, dd, J = 1,9, 6,8 Hz), 7,06 (2H, dd, J = 1,8, 6,9 Hz), 7,34 (2H, d, J = 8,0 Hz), 7,68 (2H, d, J = 8,2 Hz).
94	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,16-2,25 (2H,m), 2-28 (3H, s), 3,83 (2H, t, J = 8,3 Hz), 3,8H (3H, s), 3,99-4,06 (4H, m 4,46 (2H, dd, J = 6,3 Hz, 8,8 Hz), 6,81 (1H, d, J = 25 Hz), 7,33 (1H, d, J = 2,5 Hz)
95	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ OH	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,08-228 (2H, m), 2,61 (2H, t, J = 7,8 Hz), 3,7+3,87 (4H, m), 3,88 (3H, s), 4,13 (2H, t, J = 5,5 Hz), 4,71 (2H, d, t=5,8 Hz), 6,85 (1H, d, J = 2,5 Hz), 7,59 (1H, d, J = 2,5 Hz)
96	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,05-2-25 (4H, m), 2,27 (3H, s), 2,60 (2H, t, J = 8,3 Hz), 3,79-3,89 (42H. m), 3,86 (3H, s), 6,71 (1H, d, J = 2,5 Hz), 7,37 (1H, d, J = 2,5 Hz)

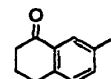
[Tabla 8]

							
Ejemplo de Referencia	de	R1	R2	R3	R4	R5	RMN
97		-H	-H	-H	-NO ₂	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm 1,93-211 (4H, m), 3,59-3,70 (2H, m), 4,00-4,13 (2H, m), 7,20-7,24 (1H, m), 7,43 (1H, t, J = 8,0 Hz), 7,72 (1H, t, J=2,3 Hz), 7,80-7,84 (1H, m)
98		-H	-H	-H	-CN	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm 1,96-200 (4H, m), 3,60-3,65 (2H, m), 3,99-4,14 (2H, m), 7,10-7,14 (2H, m), 7,22-7,28 (1H, m), 7,34-7,40 (1H, m)

[Tabla 9]

R1-O-(CH ₂) ₃ -Cl		
Ejemplo de Referencia	R1	RMN
99		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,20-2,30 (2H, m), 2,70-2,75 (2H, m), 3,07 (2H, t, J = 5,8 Hz), 3,74 (2H, t, J = 6,4 Hz), 7,15,7,20 (2H, m), 7,37 (1H, d, J = 8,2 Hz).

5 [Tabla 10]

R1-O-(CH ₂) ₃ -Cl		
Ejemplo de Referencia	R1	RMN
100		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,12 (2H, tt, J = 8,3, 6,3 Hz), 2,24 (2H, tt, J = 6,1, 6,1 Hz), 2,62 (2H, t, J = 6,5 Hz), 2,90 (2H, t, J = 6,1 Hz), 3,74 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,15 (2H, t, J = 5,8 Hz), 7,05 (1H, dd, J = 8,4, 2,8 Hz), 7,17 (1H, d, J = 8,4 Hz), 7,52 (1H, d, J = 28 Hz).

Ejemplo 1 (Referencia)**Síntesis de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo**

10 Se añadieron 5-(3-cloropropoxi)-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (1,17 g, 5,0 mmoles), hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina (1,35 g, 5,3 mmoles), carbonato de potasio (1,74, 12,6 mmoles) e Yoduro de sodio (0,75 g, 5,0 mmoles) a DMF (12 ml), y la mezcla se agitó a 80°C durante 3 horas. La disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente y a esto se añadió agua, y a continuación, se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica

15 se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. La disolución de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 7:3 → diclorometano : metanol = 100:3). El producto purificado se concentró a presión reducida para obtener una sustancia oleosa de color amarillo claro (1,97 g). La sustancia oleosa se dejó estar a temperatura ambiente para obtener una sustancia sólida, que se lavó con éter diisopropílico y se secó para obtener 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (1,49 g)

20 Punto de fusión: 109,0-110,5°C
MS 414 (M⁺)

Ejemplo 2 (Referencia)**Síntesis de ácido 5-[3-(9-benzo[b]tiofen-9-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico**

25 Se añadió una disolución acuosa 6N de hidróxido de sodio (2 ml) a una disolución etanólica (10 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (1,62 g, 3,9 mmoles) y la mezcla

se agitó a temperatura ambiente durante 4 días. A continuación, se añadió ácido clorhídrico 6N (2 ml) a la disolución de reacción enfriando con hielo y la mezcla disolvente se agitó. Se añadió diclorometano a la disolución de reacción y el precipitado se obtuvo mediante filtración. El producto filtrado se separó y la fase orgánica se concentró a presión reducida. La torta del filtro y el residuo se combinaron, se lavaron con agua y se secaron para obtener ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico (1,53 g) en forma de polvo de color blanco. Punto de fusión: 119,5-118,0°C

Ejemplo 3 (Referencia)

Síntesis de hidrocloreto de N-metil-5-[3-(9-benzo[b]tiofen-9-il-piperazin-1-il)]propoxi-1-metil-1H-pirazol-3-carboxamida

Una disolución en DMF de ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico (0,3 g, 0,75 mmoles) se enfrió sobre hielo y a esto se añadieron trietilamina (0,73 ml, 5,2 mmoles), hidrocloreto de metilamina (0,3 g, 4,5 mmoles) y fosforocianidato de dietilo (DEPC) (0,25 ml, 1,4 mmoles), y a continuación, la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 24 horas. A la disolución de reacción, se le añadieron trietilamina (0,73 ml, 5,2 mmoles), hidrocloreto de metilamina (0,3 g, 4,5 mmoles) y DEPC (0,25 ml, 1,4 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 días. Se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo. La sustancia extraída se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. La disolución se concentró a presión reducida y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 5:1 → acetato de metilo). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en acetato de etilo y a esto se añadió una disolución de ácido clorhídrico 4N/acetato de etilo. La materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración y se secó para obtener hidrocloreto de N-metil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-9-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxamida (0,24 g) en forma de polvo de color blanco. Punto de fusión: 228,0-232,5°C (descomp.).

Ejemplo 4 (Referencia)

Síntesis de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxamida

El compuesto del título se obtuvo utilizando ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico y cloruro de amonio de la misma manera que en el Ejemplo 3. Polvo de color blanco (acetato de etilo-éter diisopropílico). Punto de fusión: 186,5-188,5°C

Ejemplo 5

Síntesis de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5,N-dimetilbenzamida

El compuesto del título se obtuvo utilizando 4-(3-cloropropoxi)-3-metoxi-5,N-dimetilbenzamida e hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina de la misma manera que en el Ejemplo 1. Polvo de color blanco (acetato de etilo-metanol). Punto de fusión: 141,5-142,5°C

Ejemplo 6 (Referencia)

Síntesis de hidrocloreto de N-metil-2-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]tiazol-4-carboxamida

Se añadió hidruro de sodio (55%, oleoso, 90 mg, 2,2 mmoles) a una disolución en DMF (2 ml) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propanol (0,2 g, 0,7 mmoles) y N-metil-2-clorotiazol-4-carboxamida (0,26 g, 1,45 mmoles) enfriando con hielo y la disolución se agitó a 80°C durante 1,5 horas. Después la disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente y a esto se añadió agua, se extrajo con acetato de etilo. La disolución de extracción con acetato de etilo se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano: acetato de etilo = 5:1 → acetato de etilo). Después de concentrar el producto purificado a presión reducida, el residuo se disolvió en acetato de etilo. Se añadió una disolución de ácido clorhídrico 4N/acetato de etilo a la disolución y la materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración y se secó para obtener hidrocloreto de N-metil-2-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]tiazol-4-carboxamida (0,24 g) en forma de polvo de color amarillo claro. Punto de fusión: 199,5-202,5°C

Ejemplo 7

Síntesis de éster terc-butílico de ácido {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-

metilfenil}-carbámico

El compuesto del título se obtuvo utilizando éster terc-butilico de ácido [4-(3-cloropropoxi)-3-metoxi-5-metilfenil]-carbámico e hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina de la misma manera que en

Ejemplo 8**Síntesis de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilanilina**

Se añadió ácido clorhídrico 6N (3 ml) a una disolución metanólica (10 ml) de éster terc-butilico de ácido {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}-carbámico (2,18 g, 4,3 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Después de agitar a 60°C durante 15 minutos, la mezcla se enfrió a temperatura ambiente y a esto se añadió una disolución acuosa 6N de hidróxido de sodio para neutralizarla. Se añadió diclorometano a la mezcla de reacción, y la sustancia se extrajo con diclorometano, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 3:2 → acetato de etilo). El producto purificado se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilanilina (1,26 g) en forma de un sólido de color amarillo claro.

Punto de fusión: 155,0-158,0°C

MS 411 (M⁺)

Ejemplo 9**Síntesis de hidrocloreto de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}formamida**

Se añadió 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilanilina (0,9 g, 2,2 mmoles) a formiato de etilo (10 ml) y se sometió a reflujo calentando durante 33 horas. Después de enfriar la disolución de reacción a temperatura ambiente, se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 5:1 → acetato de etilo). El producto purificado se concentró a presión reducida y se añadió una disolución de ácido clorhídrico 4N/acetato de etilo a una disolución en acetato de etilo del residuo. La materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración para obtener hidrocloreto de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}formamida (0,3 g) en forma de polvo de color blanco.

Punto de fusión: 247,5-253,0°C (descomp.)

Ejemplo 10**Síntesis de hidrocloreto de N-metil-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilanilina**

Se añadió una disolución acuosa 6N de hidrocloreto de sodio a hidrocloreto de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}formamida (0,23 g, 0,48 mmoles) y la mezcla disolvente se extrajo con diclorometano. La disolución de extracción con diclorometano se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se disolvió en una disolución en tetrahidrofurano (THF) (5 ml) y a esto se añadió hidruro de litio y aluminio (30 mg, 0,71 mmoles) enfriando con hielo y se sometió a reflujo calentando durante 15 minutos. La disolución de reacción se enfrió sobre hielo, y se añadieron agua (0,03 ml), una disolución acuosa de hidróxido de sodio al 15% (0,03 ml), y agua (0,09 ml) a la mezcla de reacción por este orden y se agitó. La materia insoluble se eliminó mediante filtración, y el producto filtrado se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 5:1 → 3:1) y se concentró a presión reducida. Se añadió una disolución de ácido clorhídrico 4N/acetato de etilo a una disolución en acetato de etilo del residuo, y la materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración para obtener hidrocloreto de N-metil-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilanilina (63 mg) en forma de polvo de color blanco.

Punto de fusión: 239,5-294,0°C (descomp.)

Ejemplo 11**Síntesis de hidrocloreto 3-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}oxazolidin-2-ona**

El compuesto del título se obtuvo utilizando hidrocloreto de 3-{4-(3-cloropropoxi)-3-metoxi-5-metilfenil}oxazolidin-2-ona y 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina de la misma manera que en el Ejemplo 1,

Polvo de color blanco (etanol)

Punto de fusión: 2,47,5-251,0°C (descomp.)

Ejemplo 12**Síntesis de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}acetamida**

El compuesto del título se obtuvo utilizando N-[4-(3-cloropropoxi)-3-metoxi-5-metilfenil]acetamida e hidrocloreto 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina de la misma manera que en el Ejemplo 1.
 Polvo de color blanco (acetato de etilo-éter diisopropílico)
 Punto de fusión: 121,5-122,0°C

Ejemplo 13**Síntesis de hidrocloreto de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}-N-metilacetamida**

Se añadió hidruro de sodio (55%, oleoso, 0,06 g, 1,3 mmoles) a una disolución en DMF (5 ml) de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}acetamida (0,45 g, 0,99 mmoles) enfriando con hielo y la mezcla se agitó a 0°C durante 15 minutos. Se añadió yoduro de metilo (0,07 ml, 1,1 mmoles) a la disolución de reacción y la disolución se agitó a 0°C durante una hora. Adicionalmente, se añadieron hidruro de sodio (55% oleoso, 0,06 g, 1,3 mmoles) e Yoduro de metilo (0,07 ml, 1,1 mmoles) a la disolución de reacción y la mezcla disolvente se agitó a 0°C durante 2 horas. Se añadió agua a la disolución de reacción y se realizó la extracción con acetato de etilo. La sustancia extraída se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio. La disolución de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 5:1 → acetato de etilo). Después de concentrar el producto purificado a presión reducida, se añadió una disolución de ácido clorhídrico 4N/acetato de a una disolución en acetato de etilo del residuo. La materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración para obtener hidrocloreto de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}-N-metilacetamida (325 mg).
 Punto de fusión: 230,0-234,0°C (descomp.)

Ejemplo 14**Síntesis de hidrocloreto de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-N,N-dimetil-3-metoxi-5-metilnilina**

Se añadieron formalina (37%, 0,29 ml, 3,9 mmoles) y cianoborohidruro de sodio (0,21 g, 3,1 mmoles) a una disolución metanólica (6 ml) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilnilina (0,32 g, 0,78 mmoles) enfriando con hielo y la mezcla se agitó a 0°C durante 15 minutos. A la disolución de reacción, se le añadió ácido acético (0,18 ml, 3,1 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una hora. Se añadió una disolución acuosa de carbonato de potasio a la disolución de reacción enfriando con hielo, y la extracción se realizó con acetato de etilo. La sustancia extraída se secó sobre sulfato de magnesio. La disolución de reacción se concentró a presión reducida, y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano:etilo acetato de = 11:1 → 3:1). El producto purificado se concentró a presión reducida. Se añadió una disolución de ácido clorhídrico 4N y acetato de etilo a una disolución en acetato de etilo del residuo y la materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración para obtener hidrocloreto de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-N,N-dimetil-3-metoxi-5-metilnilina (137 mg) en forma de polvo de color blanco.
 Punto de fusión: 234,5-240,5°C (descomp.)

Ejemplo 15**Síntesis de hidrocloreto de {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}carbamato de metilo**

El compuesto del título se obtuvo utilizando 4-(3-cloropropoxi)-3-metoxi-5-metilfenil}carbamato de metilo e hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina de la misma manera que en el Ejemplo 1.
 Polvo de color blanco (acetato de etilo)
 Punto de fusión: 230,0-235,5°C

Ejemplo 16**Síntesis de hidrocloreto de N-metil-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}carbamato de metilo**

El compuesto del título se obtuvo utilizando hidrocloreto de {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}carbamato de metilo e Yoduro de metilo de la misma manera que en el Ejemplo 14.

Polvo de color blanco (acetato de etilo)
Punto de fusión: 228,0-233,5°C

Ejemplo 17 (Referencia)

Síntesis de hidroclicloruro de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxazina

Se suspendió hidruro de litio y aluminio (86 mg, 2,3 mmoles) en THF (20 ml). A esta disolución, se le añadió gota a gota una disolución en THF (10 ml) de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxazin-3-ona (0,8 g, 1,9 mmoles) en atmósfera de argón. Una vez completada la adición gota a gota, la mezcla disolvente se sometió a reflujo calentando durante una hora. Se añadieron agua (0,1 ml), una disolución acuosa de hidróxido de sodio al 15% (0,1 ml), y agua (0,3 ml) a la mezcla de reacción enfriando con hielo y se agitó. La materia insoluble se eliminó mediante filtración con cerite, y el producto filtrado se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano : metanol = 1:0 → 20:1) y se concentró a presión reducida. El residuo se disolvió en acetato de etilo (10 ml) y a esto se añadió una disolución (0,34 ml) de ácido clorhídrico 1N/etanol y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. La materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración, se lavó con acetato de etilo, y se secó para obtener hidroclicloruro de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxazina (0,11 g) en forma de un sólido de color blanco. Punto de fusión 207,9-208,8°C

Ejemplo 18

Síntesis de hidroclicloruro de 7-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-4-metil-3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxazina (Referencia)

Se añadieron formalina (37%, 0,22 ml, 2,7 mmoles) y MP-cianoborohidruro (2,41 mmol/g, 1,12 g, 2,7 mmoles) a una disolución metanólica (15 ml) de 7-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxazina (0,30 g, 0,67 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. La materia insoluble se eliminó mediante filtración y el producto filtrado se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano metanol = 1:0 → 50:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en acetato de etilo (15 ml) y a esto se añadió una disolución (0,64 ml) de ácido clorhídrico 1N/etanol. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. La materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración, se lavó con acetato de etilo, y se secó para obtener 7-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-4-metil-3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxazina hidroclicloruro (0,23 g) un sólido de color pardo claro. Punto de fusión; 248,1-249,6°C

Ejemplo 19 (Referencia)

Síntesis de hidroclicloruro de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metil-1,2,3,9-tetrahidroquinazolin-4-ol e hidroclicloruro de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinazolina

Una disolución en THF (20 ml) de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metilquinazolina (0,25 g, 0,58 mmoles) se enfrió sobre hielo. A esta disolución, se le añadió gota a gota una disolución en THF (5 ml) de hidruro de litio y aluminio (26 mg, 0,69 mmoles) en atmósfera de argón. Una vez completada la adición gota a gota, la disolución se agitó a temperatura ambiente durante 20 minutos y se sometió a reflujo calentando durante una hora. Se añadieron agua (0,03 ml), una disolución acuosa de hidróxido de sodio al 15% (0,03 ml), y agua (0,1 ml) a la disolución de reacción enfriando con hielo y se agitó. La materia insoluble se eliminó mediante filtración con cerite, y el producto filtrado se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano : metanol = 1:0 → 25:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en acetato de etilo (5 ml). A esto, se le añadió una disolución (0,189 ml) de ácido clorhídrico 1N/etanol y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. La materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración, se lavó con acetato de etilo, y se secó para obtener hidroclicloruro de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinazolin-4-ol (87 mg) en forma de un sólido de color blanco. MS: 438 (M⁺).

Una disolución de elución de diclorometano/metanol (10:1) se hizo pasar a través de a columna de la cromatografía en columna de gel de sílice. El producto eluido obtenido se concentró a presión reducida y a continuación el residuo se disolvió en acetato de etilo (5 ml). A esto, se le añadió una disolución (0,226 ml) de ácido clorhídrico 1N/etanol y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. La materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración, se lavó con acetato de etilo, y se secó para obtener hidroclicloruro de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-

il)propoxi]-3-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinazolina (49 mg) en forma de un sólido de color blanco.
Punto de fusión: 203,1-204,4°C

Ejemplo 20 Referencia

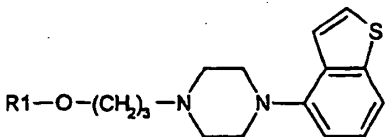
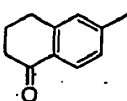
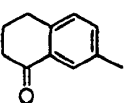
Síntesis de hidrocloreto de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-2,3-dihidro-1H-indol

Se añadió trietilsilano (1,14 ml, 7,14 mmoles) a una disolución en ácido trifluoroacético (5 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1H-indol (228 mg, 0,71 mmoles) y la mezcla se agitó a 50°C durante 2 horas. La mezcla se concentró a presión reducida. El residuo se disolvió en diclorometano, se neutralizó con una disolución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio y se separó. La fase orgánica se lavó con una disolución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio, agua y una disolución salina saturada por este orden y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 5: 1 → 1:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se añadió a acetato de etilo (5 ml) y a esto se añadió una disolución de ácido clorhídrico 1N/etanol (0,10 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. La materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración, se lavó con acetato de etilo, y se secó para obtener hidrocloreto de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-2,3-dihidro-1H-indol (32 mg) en forma de un sólido de color blanco.
Punto de fusión: 222,4-223,9°C

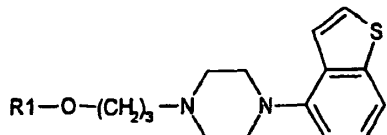
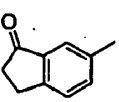
Los compuestos enumerados en las siguientes Tablas 13 a se produjeron utilizando sustancias de partida apropiadas de la misma manera que en los Ejemplos de Referencia de 1 a 36 o los Ejemplos de 1 a 20 y 1051 a 1067.

En las siguientes Tablas, se prepararon realmente los compuestos con propiedades físicas, tales como la forma cristalina, el p.f. (punto de fusión), la sal, el RMN ^1H y el EM (espectro de masas).

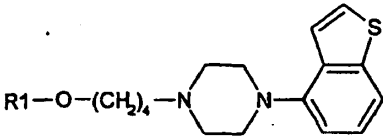
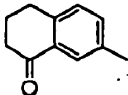
[Tabla 12]

				
Ejemplo	R1	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
21		Sólido de color blanco (Etanol/ acetato de etilo)	251:1-253,6	Hidrocloreto
22		Sólido de color blanco (Acetato de etilo)	249,8-2523	Hidrocloreto

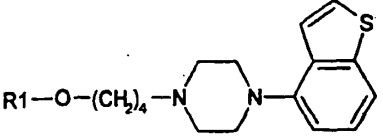
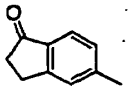
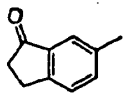
[Tabla 13]

			
Ejemplo	R1	RMN	Sal
23		RMN ^1H (DMSO- d_6) δ ppm 220-2,30 (2H, m), 2,64 (2H, t, J = 5,8 Hz), 3,01 (2H, t, J = 5,5 Hz), 3,20-3,40 (6H, m), 3,53 (2H, d, J = 123 Hz), 3,64 (2H, d, J = 11,2 Hz), 4,15 (2H, t, J = 6,0 Hz), 6,95 (1H, d, J = 7,7 Hz), 7,13 (1H, d, J = 2,4 Hz), 7,25-7,35 (2H, m), 7,45-7,55 (2H, m), 7,69 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,75 (1H, d, J = 5,8 Hz), 11,12 (1H, s ancho).	Hidrocloreto

[Tabla 14]

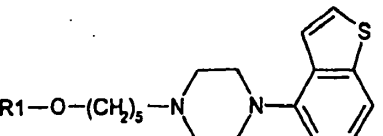
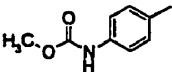
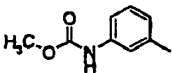
				
Ejemplo	R1	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
24		Sólido de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	2420-244,9	Hidrocloruro

[Tabla 15]

				
Ejemplo	R1	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
25		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter)	198-201	Hidrocloruro
26		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter)	206-209	Hidrocloruro

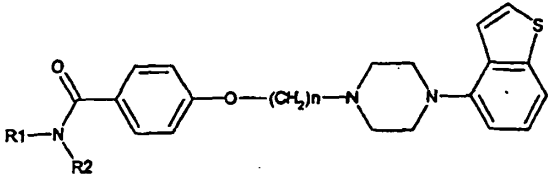
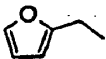
5

[Tabla 16]

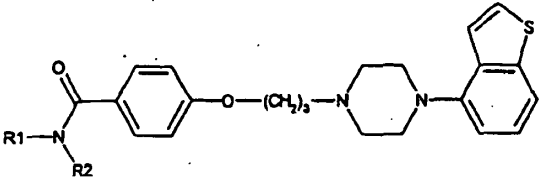
				
Ejemplo	R1	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
27		Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	112,5-114,5	-
28		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	208,0-211,5	Hidrocloruro

10

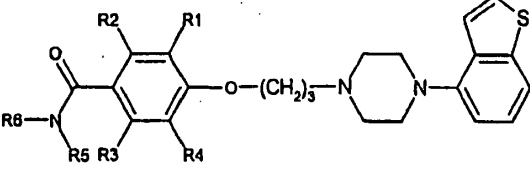
[Tabla 17]

						
Ejemplo	R1	R2	n	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
29	-H	-C ₂ H ₅	3	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	218,5-222,0 (descomp.)	Hidrocloruro
30	-H	-C ₃ H ₇	3	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	127,0-128,5	-
31	-H	-CH ₃	3	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	151,0-154,5	-
32	-CH ₃	-CH ₃	3	Polvo de color blanco (Acetato de etilo).	206,5-211,5	Hidrocloruro
33	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	3	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	205,5-209,0	Hidrocloruro
34	-H	-CH ₂ CF ₃	3	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	217,0 (descomp.)	Hidrocloruro
35	-H	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	3	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	229,5-232,5	Dihidrocloruro
36	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	3	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	218,5-221,0	Hidrocloruro
37	-H	-ciclo-C ₃ H ₅	3	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	185,5-167,0	-
38	-H	-OH(CH ₃),	3	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	131,5-1325	-
39	-H	-H	3	Polvo de color blanco (Diclorometano)	186,0-191,0	-
40	-H	-(CH ₂) ₅ OH	3	Sólido de color blanco (Etanol)	202-203	Hidrocloruro
41	-H		3	Sólido de color pardo claro (Etanol)	215-216	Hidrocloruro
42	-H	-C ₂ H ₅	4	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	198,0-199,5	Hidrocloruro
43	-H	-CH ₂ CF ₃	4	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	194,5-196,0	Hidrocloruro
44	-H	-H	4	Polvo de color blanco (2-propanol)	150,0-151,5	-
45	-H	-CH ₃	4	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	154,0-156,0	-
46	-CH ₃	-CH ₃	4	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	226,0 (descomp.)	Hidrocloruro

[Tabla 18]

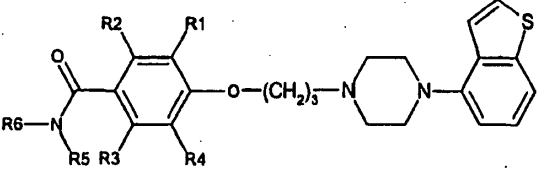
				
Ejemplo	R1	R2	RMN	Sal
47	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	RMN H ¹ (DMSO-d ₆ ppm 2,1-22 (2H, m), 3,1-3,8 (14H, m), 4,17 (2H, t, J = 5,7 Hz), 4,6-4,8 (1H, ancho), 6,9-7,1 (3H, m), 7,33 (1H, dd, J = 7,9, 8,1 Hz), 7,51 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,72 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,78 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,86 (2H, d, J = 8,8 Hz), 8,2-8,3 (1H, ancho), 10,2-10,4 (1H, ancho).	Hidrocloruro

[Tabla 19]

									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
48	-H	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	199,0-204,0	Hidrocloruro
49	-OCH ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	162,0-163,0	-
50	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	154,0-155,5	-
51	-Cl	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	145,0-148,0	-
52	-H	-H	-H	-Cl	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	213,0 (descomp.)	Hidrocloruro
53	-H	-H	-H	-Cl	-C ₂ H ₅	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	211,0 (descomp.)	Hidrocloruro
54	-Cl	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	128,5-131,0	-
55	-F	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	153,5-156,0	-

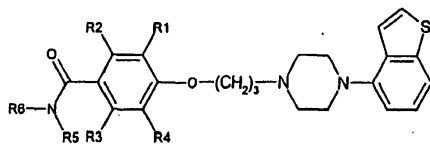
5

[Tabla 20]

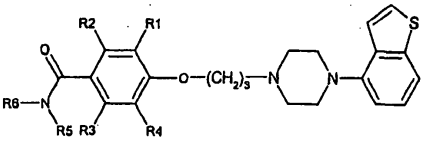
									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
56	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	232,0 (descomp.)	Hidrocloruro
57	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	198,0-202,0	Hidrocloruro

						CH ₃	de etilo)		
58	-H	-H	-H	-F	-C ₂ H ₅	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	210,5-213,0	Hidrocloreuro
59	-F	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	178,5-179,5	-
60	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (2-propanol)	178,5-180,0	-
61	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (2-propanol)	156,5-158,0	-
62	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	220,0-222,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
63	-CH ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₆	-H	Polvo de color blanco (2-propanol)	140,5-143,0	-
64	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color blanco (2-propanol)	154,5-157,0	-
65	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (2-propanol)	162,0-163,5	-

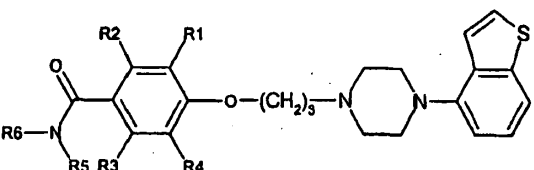
[Tabla 21]

									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
66	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (2-propanol)	180,5-182,0	-
67	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color amarillo claro (2-propenal)	144,5-148,0	-
68	-Cl	-H	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	Polvo de color blanco	120-122	-
69	-H	-H	-H	-F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	215,0-217,0	Hidrocloreuro
70	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	Polvo de color blanco (Etanol/hexano)	120,0-121,0	-
71	-H	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	194-188	Hidrocloreuro
72	-Br	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	152,5-154,0	-
73	-Br	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	148,0-150,0	-
74	-H	-H	-H	-Br	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	225,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
75	-H	-H	-H	-Br	-C ₂ H ₅	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	214,5-220,5 (descomp.)	Hidrocloreuro

[Tabla 22]

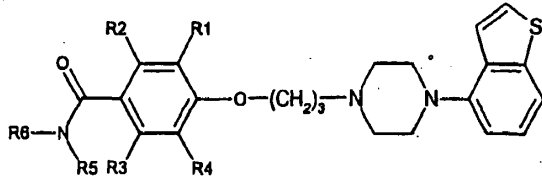
									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
76	-H	-H	-H	-Br	CH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	230,0-234,5	Hidrocloreuro
77	-CN	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	182,0-185,0	-
78	-CN	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (2- propanol)	177,5-181,5	-
79	-H	-H	-H	-CN	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	213,5-214,0	Hidrocloreuro
80	-CN	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	Polvo de color blanco (2- propanol)	182,5-188,0	-
81	-H	-H	-H	-CN	CH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	217,0-222,0	Hidrocloreuro
82	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (2- propanol al 95%)	133,5-135,5	-
83	-H	-Cl	-H	-H	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (2- propanol al 95%)	137,0-138,0	-
84	-H	-H	-Cl	-H	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	236,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
85	-H	-H	-Cl	-H	-C ₂ H ₅	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	223,0-224,0	Hidrocloreuro

[Tabla 23]

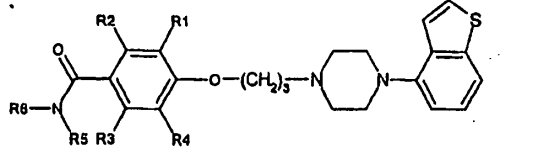
									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
86	-H	-H	-Cl	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	210,5-218,0	Hidrocloreuro
87	-H	-H	-CF ₃	-H	-C ₂ H ₅	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	212,0-219,5	Hidrocloreuro
88	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Diclorometano/éter isopropílico)	138,5-141,0	Hidrocloreuro
89	-H	-H	-CF ₃	-H	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	214,0-218,5	Hidrocloreuro
90	-H	-H	-CF ₃	-H	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco	252,5 (descomp.)	Hidrocloreuro

							(Acetato de etilo)		
91	-H	-H	-CF ₃	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	218,0-218,5	Hidrocloreuro
92	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (2-propanol)	173,5-178,5	-

[Tabla 24]

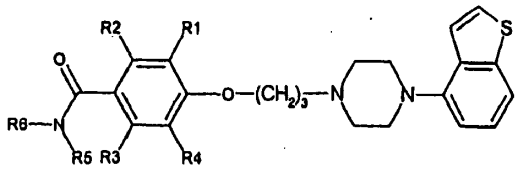
									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	RMN	Sal	
93	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-C ₂ H ₈	-H	RMN ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 1,20-1,30 (3H, m), 2,10-2,20 (2H, m), 2,69 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,70-2,75 (4H, m), 285 (6H, s), 3,20-3,25 (4H, m), 3,45-3,55 (2H, m), 4,10-4,20 (2H, m), 6,00 (1H, s ancho), 6,85-6,95 (2H, m), 7,25-7,30 (3H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,56 (1H, d, J = 8,1 Hz).	-	
94	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	RMN ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 1,20-1,30 (3H, m), 2,05-2,15 (2H, m), 2,25 (3H, s), 2,65 (2H, t, J = 7,1 Hz), 2,70-2,80 (4H, m), 3,20-3,25 (4H, m), 3,40-3,55 (2H, m), 4,21 (2H, t J = 6,4 Hz), 6,22 (1H, s ancho), 6,81 (1H, d, J = 7,7 Hz), 6,98 (1H, d, J = 8,6 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,56 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,71 (1H, d, J = 8,5 Hz), 7,82 (1H, s ancho), 8,70 (1H, s).	-	

[Tabla 25]

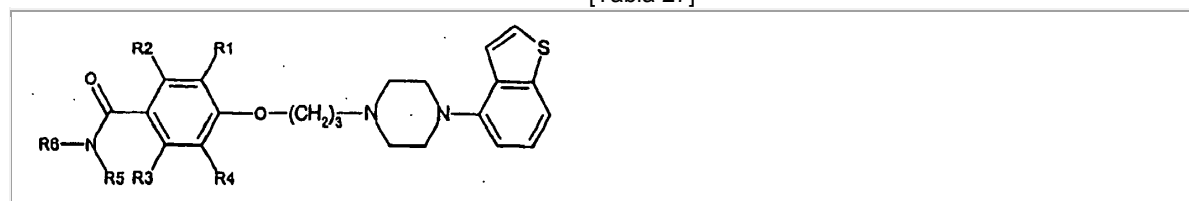
									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
95	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (2-propanol)	221,5-223,0	Hidrocloreuro
96	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	207,5-215,0	Hidrocloreuro
97	-H	-H	-OCH ₃	-H	-C ₂ H ₆	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	187,0-202,0	Hidrocloreuro
98	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	219,0-227,0	Hidrocloreuro
99	-NO ₂	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	157,5-181,0	-
100	-NO ₂	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	157,5-161,5	-
101	-H	-H	-H	-NO ₂	-CH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	217,5-219,5 (descomp.)	Hidrocloreuro
102	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (2-	163,5-185,5	-

							propanol al 95%)		
103	-NH ₂	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	172,5-173,0	-
104	-CF ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (2-propanol al 95%)	158,5-162,0	-
105	-CF ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	Polvo de color blanco (2-propanol al 95%)	146,5-148,5	-

[Tabla 26]

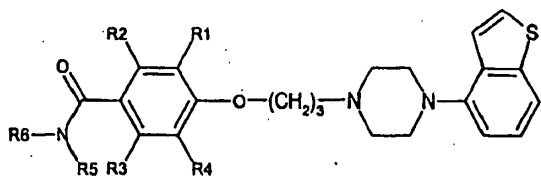
									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Forma cristalina de (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	de Sal
106	-CF ₃	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color blanco (2-propanol al 95%)	144,5-150,0	-
107	-NH ₂	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	124,0-125,5	-
108	-N(CH ₂) ₂	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	143,0-145,0	-
109	-H	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	219,0-223,0	Hidrocloreuro
110	-NH ₂	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	125,0-128,0	-
111	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/Isopropilo éter)	147,5-148,5	-
112	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (2-propanol al 95%)	150,5-152,5	-
113	-H	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (2-propanol al 95%)	138,0-139,0	-
114	-H	-CH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₈	-H	Polvo de color blanco (2-propanol al 95%)	137,5-139,0	-
115	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	Polvo de color blanco (2-propanol al 95%)	187,0-188,0	-

[Tabla 27]



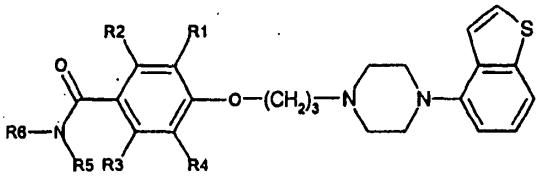
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
116	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (2- propanol al 95%)	1525-154,5	-
117	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-C ₂ H ₃	-H	Polvo de color blanco (2- propanol al 95%)	184,0-185,5	-
118	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	147,5-148,0	-
119	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	233,0-237,5 (descomp.)	Hidrocloreuro
120	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-C ₂ H ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	145,5-147,5	-
121	-OC ₂ H ₃	-H	-H	-CH ₃	-CH ₂	-H	Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	186,5-188,0	Hidrocloreuro
122	-CH ₂ CH=CH ₂	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	(Acetato de etilo/éter isopropílico)	128,0-130,0	-
123	-C ₃ H ₇	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	(Acetato de etilo/éter isopropílico)	137,5-140,0	-
124	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₂ CH=CH ₂	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	180,5-188,0	Hidrocloreuro
125	-OCH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₇	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	188,5-192,0	Hidrocloreuro

[Tabla 28]

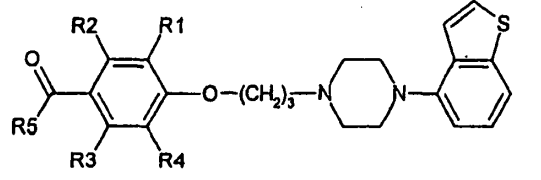
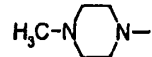
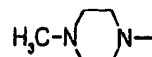
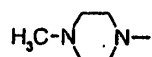


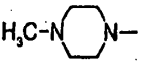
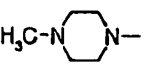
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
126	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	158,0-157,0	-
127	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/metanol)	141,5-142,5	-
128	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	-C ₂ H ₅	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	220,5-224,5	Hidrocloreuro
129	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-OCH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	223,0-227,5	Hidrocloreuro

[Tabla 29]

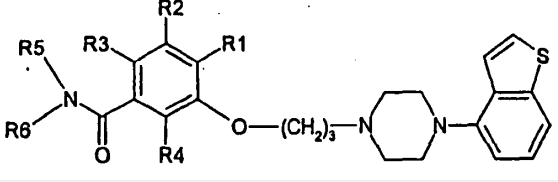
								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	RMN	Sal
130	-H	-H	-H	-NO ₂	-C ₂ H ₅	-H	RMN ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 1,28 (3H, t, J = 7,3 Hz), 2,05-2,15 (2H, m), 2,68 (2H, t, J = 7,0 Hz), 2,73 (4H, s ancho), 3,19 (4H, s ancho), 3,45-3,55 (2H, m), 4,29 (2H, t, J = 6,2 Hz), 6,14 (1H, s ancho), 6,90 (1H, d, J = 7,8 Hz), 7,18 (1H, d, J = 8,8 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,1 Hz), 8,04 (1H, dd, J = 2,3, 8,8 Hz), 8,23 (1H, d, J = 2,2 Hz).	-

[Tabla 30]

								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
131	-H	-H	-H	-H		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	234,5-238,0	Hidrocloruro
132	-H	-H	-H	-H		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	244,0 (descomp.)	Dihidrocloruro
133	-H	-H	-H	Cl		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	218,5-222,0	Hidrocloruro
134	-H	-H	-H	-Cl		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	255,0 (descomp.)	Dihidrocloruro
135	-H	-H	-H	-F		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	224,5-227,5 (descomp.)	Hidrocloruro
136	-H	-H	-H	-F		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	255,0 (descomp.)	Dihidrocloruro
137	-H	-H	-H	-CH ₃		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	236,0 (descomp.)	Hidrocloruro
138	-H	-H	-H	-CH ₃		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	255,5 (descomp.)	Dihidrocloruro

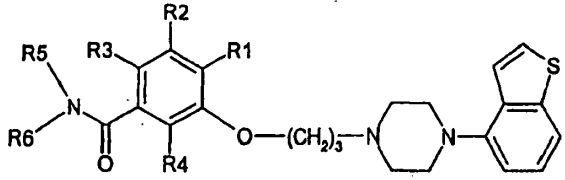
								
139	-H	-H	-H	⁻ OCH ₃		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	228,0-228,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
140	-H	-H	-H	⁻ OCH ₃		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	232,0 (descomp.)	Dihidrocloreuro

[Tabla 31]

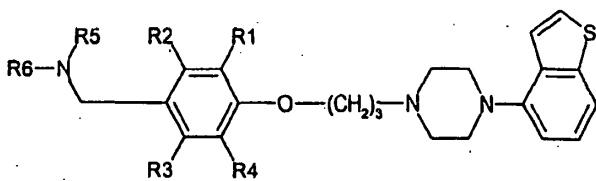
									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
141	-H	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	158,0-160,0	-
142	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	183,0-188,0	Hidrocloreuro
143	-H	-H	-H	-H	⁻ CH ₃	-CH ₃	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	158,0-181,5	Hidrocloreuro
144	-H	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	168,5-173,0	Hidrocloreuro
145	-H	-H	-H	-H	-H	⁻ CH ₂ CF ₃	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	187,5-189,0	Hidrocloreuro
146	-F	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	156,5-159,0	-
147	-F	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	214,5-218,0	Hidrocloreuro
148	-F	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	211,0-218,0	Hidrocloreuro
149	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	139,0-140,5	-
150	-Cl	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	218,6-222,5	Hidrocloreuro
151	-Cl	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	247,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
152	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	128,5-130,0	-
153	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	148,5-151,0	-
154	-CH ₃	-N	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	133,0-134,5	-
155	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato)	155,5-160,0	-

							de etilo)		
156	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	163,5-165,0	Hidrocloruro

[Tabla 32]

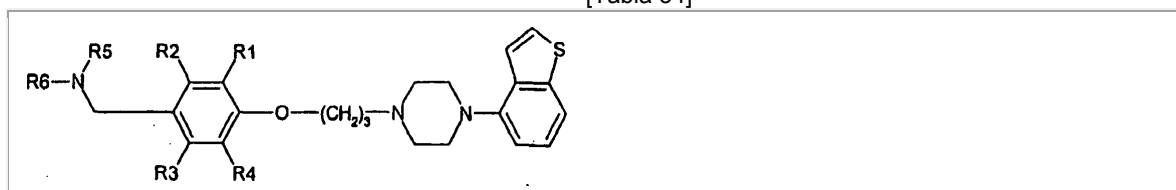
									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
157	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	187,0-188,5	Hidrocloruro
158	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	132,0-134,0	-
159	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	201,0-208,0	Hidrocloruro
160	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	158,0-158,5	-

[Tabla 33]

									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
161	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	228,0-241,0 (descomp.)	Dihidrocloruro
162	-H	-H	-H	-H	-C ₃ H ₇	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	232,0-236,0 (descomp.)	Dihidrocloruro
163	-H	-H	-H	-H	-C ₃ H ₇	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	210,0-222,0 (descomp.)	Dihidrocloruro
164	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	235,5 (descomp.)	Dihidrocloruro
165	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	257,5 (descomp.)	Dihidrocloruro
166	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	232,0 (descomp.)	Dihidrocloruro
167	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color	238,5-240,5	Dihidrocloruro

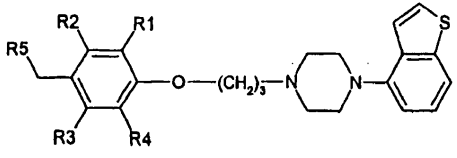
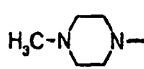
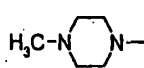
							blanco (Acetato de etilo)	(descomp.)	
168	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	209,5 (descomp.)	Trihidrocloruro
169	-H	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	245,5 (descomp.)	Dihidrocloruro
170	-H	-H	-H	-H	-CHO	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	207,6-213,0	Hidrocloruro
171	-H	-H	-H	-H	-COCH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	188,5-201,0	Hidrocloruro
172	-H	-H	-H	-H	-COC ₂ H ₅	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	194,5-198,0	Hidrocloruro
173	-H	-H	-H	-H	-COC ₆ H ₅	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	192,5-195,5	Hidrocloruro
174	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	236,5 (descomp.)	Dihidrocloruro
175	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	191,0-193,5	Dihidrocloruro
176	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	101,0-103,0	-
177	-H	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	207,5-214,5	Trihidrocloruro
178	-H	-H	-H	-Cl	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	259,0 (descomp.)	Dihidrocloruro
179	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	247,0 (descomp.)	Dihidrocloruro
180	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	237,0 (descomp.)	Dihidrocloruro
181	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-CONCH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	198,0-199,0	Hidrocloruro

[Tabla 34]

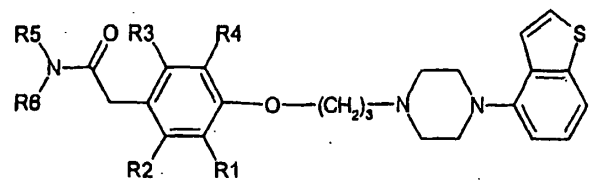


Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R8	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)		Punto de fusión (°C)	Sal
182	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-C ₂ H ₅	Polvo de color	blanco	258,5 (descomp.)	Dihidrocloruro
183	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	Polvo de color	blanco	254,5 (descomp.)	Dihidrocloruro
184	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color	blanco	277,5 (descomp.)	Dihidrocloruro
185	-H	-H	-H	-CH ₃	-COCH ₃	-CH ₃	Polvo de color	blanco	230,0-232,0 (descomp.)	Hidrocloruro
186	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Polvo de color	blanco	239,5 (descomp.)	Dihidrocloruro
187	-H	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-COCH ₃	Polvo de color	blanco	208,0-211,5	Hidrocloruro

[Tabla 36]

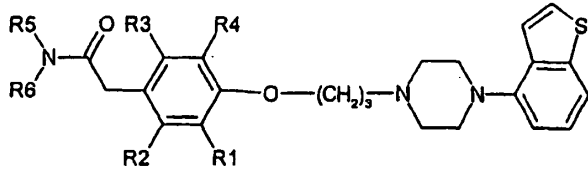
										
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de Recristalización)		Punto de fusión (°C)	Sal	
188	-H	-H	-H	-H		Polvo de color	blanco	243,5 (descomp.)	Dihidrocloruro	
189	-H	-H	-H	-H		Polvo de color	blanco	261,5 (descomp.)	Dihidrocloruro	
190	-H	-H	-H	-Cl		Polvo de color	blanco	249,0 (descomp.)	Dihidrocloruro	
191	-H	-H	-H	-Cl		Polvo de color	blanco	253,5 (descomp.)	Trihidrocloruro	
192	-H	-H	-H	-F		Polvo de color	blanco	252,0 (descomp.)	Dihidrocloruro	
193	-H	-H	-H	-CH ₃		Polvo de color	blanco	242,0 (descomp.)	Dihidrocloruro	

[Tabla 37]

										
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)		Punto de fusión (°C)	Sal

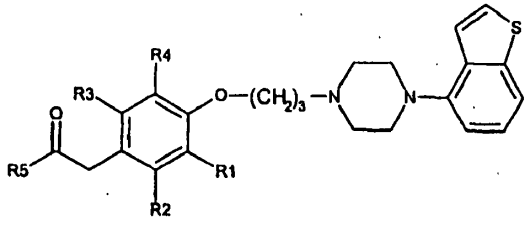
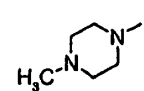
194	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₃	-C ₂ H ₈	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	179,0-183,5	Hidrocioruro
195	-H	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/agua)	150,0-154,5	-
196	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	198,0-207,0	Hidrocioruro
197	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	128,0-129,5	-
198	-H	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	1125-113,5	-
199	-H	-H	-H	-H		-CH ₂ CF ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	126,0-127,0	-
200	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (2-propanol)	161,5-166,0	-
201	-H	-H	-H	-Cl	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	194,5-197,0	Hidrocioruro
202	-H	-H	-H	-Cl	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	197,5-201,0	Hidrocioruro
203	-H	-H	-H	-Cl	-H	-C ₂ H ₅	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	227,5 (descomp.)	Hidrocioruro
204	-H	-H	-H	-Cl	-H	-CH ₂ CF ₃	(Acetato de etilo)	204,0-208,0	Hidrocioruro
205	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	129,0-130,0	-
206	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	176,0-178,5	Hidrocioruro
207	-H	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	188,5-192,0	Hidrocioruro
208	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-C ₃ H ₅	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	178,0-184,0	Hidrocioruro
209	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₂ CF ₃	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	187,5-192,0	Hidrocioruro

[Tabla 38]

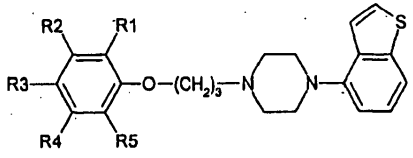
									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
210	-F	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (2-propanol)	148,5-150,0	-
211	-H	-H	-H	-F	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	191,0-193,0	Hidrocioruro

212	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	192,5-197,0	Hidrocloruro
213	-H	-H	-H	-F	-H	-C ₂ H ₅	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	218:0-220,5	Hidrocloruro
214	-H	-H	-H	-F	-H	-CH ₂ CF ₃	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	197,0-202,0	Hidrocloruro
215	-H	-H	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	149,5-150,5	-

[Tabla 39]

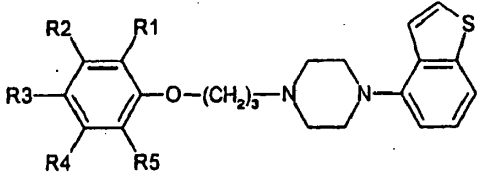
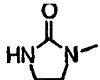
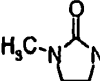
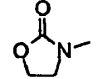
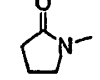
									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal	
216	-H	-H	-H	-H		Polvo de color blanco (Acetato de etilo /éter isopropílico)	130,5-131,5	-	
217	-H	-H	-H	-H		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	227,5 (descomp.)	Dihidrocloruro	

[Tabla 40]

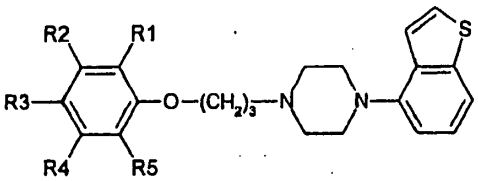
									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal	
218	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	Polvo de color blanco (Etanol)	283,0-285,0	Hidrocloruro	
219	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	149,5-150,5,	-	
220	-H	-H	-NHCO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	Polvo de color amarillo claro (Etanol/acetato de etilo)	174-176	Dihidrocloruro	
221	-H	-H	-NHC ₂ H ₅	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	225 (descomp.)	Hidrocloruro	

222	-H	-H	$\text{N}(\text{CH}_3)\text{CO}_2\text{CH}_3$	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	196,0-2020	Hidrocloreuro
223	-H	-H	$\text{N}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$	-H	-H	Polvo de color blanco (Etanol)	246-247	Hidrocloreuro
224	-H	-H	NH_2	-H	-H	Polvo de color blanco (Agua que contiene Etanol)	266-271(descomp.)	Hidrocloreuro
225	-H	-H	NHCH_2	-H	-H	Polvo de color blanco (Etanol)	264-266	Dihidrocloreuro
226	-H	-H	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	-H	-H	Polvo de color blanco (Etanol)	269-270	Dihidrocloreuro
227	$-\text{CH}_3$	-H	NH_2	-H	$-\text{OCH}_3$	Sólido de color amarillo claro (Acetato de etilo)	155,0-158,0	-
228	$-\text{OCH}_3$	-H	$\text{NHCON}(\text{CH}_3)_2$	-H	$-\text{CH}_3$	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	208,0-210,0	Hidrocloreuro
229	$-\text{OCH}_3$	-H	NHCHO	-H	$-\text{CH}_3$	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	247,5-253,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
230	$-\text{OCH}_3$	-H	NHCO_2CH_3	-H	$-\text{CH}_3$	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	230,0-235,5	Hidrocloreuro

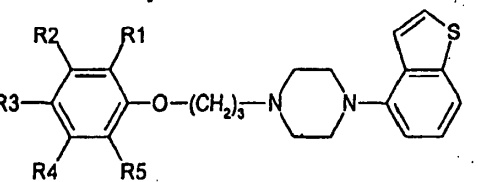
[Tabla 41]

								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión(°C)	Sal
231	-H	-H		-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/2-propanol)	154,5-158,5	-
232	-H	-H		-H	-H	Polvo de color blanco (2-propanol)	141,0-144,5	-
233	$-\text{OCH}_3$	-H		-H	$-\text{CH}_3$	Polvo de color blanco (Etanol)	247,5-251,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
234	$-\text{CH}_2\text{OH}$	-H		-H	$-\text{OCH}_3$	Polvo de color blanco (Etanol)	144,0-145,0	Hidrocloreuro

[Tabla 42]

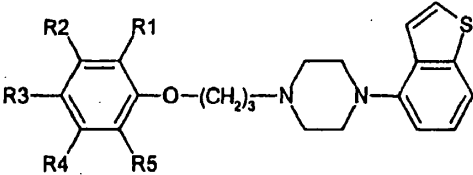
							
Ej.	R1	R2	R3	R4	R5	RMN	Sal
235	-H	R2-H	-NHCH(CH ₃) ₂	-H	-H	RMN H ¹ (DMSO-d ₆) δ ppm: 1,24 (6H, d, J = 6,5 Hz), 2,2-2,4 (2H, m), 3,15-3,8 (12H, m), 4,15 (2H, t, J = 6 Hz), 6,99 (1H, d J = 7,5 Hz), 7,11 (2H, d, J = 9 Hz), 7,33 (1H, dd, J = 8, 8 Hz), 7,4-7,55 (3H, m), 7,71 (1H, d, J = 8 Hz), 7,78 (1H, d, J = 5,5 Hz), 10,87 (3H, ancho).	Trihidrocloruro
236	-OCH ₃	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,00-2,15 (2H, m), 2,60-2,70 (2H, m), 2,73 (4H, s ancho), 3,20 (4H, s ancho), 3,77 (3H, s), 3,88 (3H, s), 4,10 (2H, t, J = 6,6 Hz), 6,52 (1H, s ancho), 8,74 (1H, dd, J = 2,5, 8,6 Hz), 6,87 (1H, d, J = 8,6 Hz), 8,90 (1H, d, J = 7,7 Hz), 7,19 (1H, s ancho), 7,28 (1H, dd, J = 7,8, 7,8 Hz), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 7,8 Hz).	-
237	-H	-H	-NHCON(CH ₃) ₂	-H	-H	RMN H ¹ (DMSO-d ₈) δ ppm: 2,20-2,30 (2H, m), 2,91 (6H, s), 3,20-3,40 (6H, m), 3,55 (2H, d, J = 12,4 Hz), 3,65 (2H, d, J = 11,4 Hz), 4,05 (2H, t, J = 6,0 Hz), 6,86 (2H, d, J = 9,0 Hz), 6,98 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,30-7,40 (3H, m), 7,50 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,71 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,78 (1H, d, J = 5,5 Hz), 8,18 (1H, s ancho), 11,05 (1H, s ancho).	Dihidrocloruro
238	-F	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	RMN H ¹ (DMSO-d ₈) δ ppm: 2,24 (2H, s ancho), 3,10-3,25 (2H, m), 3,30-3,50 (4H, m), 3,50-3,60 (2H, m), 3,66 (3H, s), 3,85-3,70 (2H, m), 4,13 (2H, t, J = 5,9 Hz), 6,98 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,10-7,20 (2H, m), 7,32 (1H, dd, J = 7,9, 7,8 Hz), 7,40 (1H, d, J = 13,3 Hz), 7,50 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,71 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,77 (1H, d, J = 5,5 Hz), 9,69 (1H, s ancho), 10,58 (1H, s ancho).	Hidrocloruro

[Tabla 43]

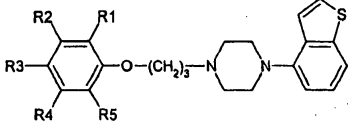
							
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	RMN	Sal
239	-H	-H	-NHCONH ₂	-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,95-2,10 (2H, m), 2,64 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,70-2,75 (4H, m), 3,15-3,20 (4H, m), 4,03 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,83 (2H, s ancho), 6,83 (1H, s ancho), 8,85-6,95 (3H, m), 7,20 (2H, d, J = 8,6 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,1 Hz).	-
240	-H	-H	-NHCON(C ₂ H ₅) ₂	-H	-H	RMN H ¹ (DMSO-d ₈) δ ppm: 1,06 (6H, t, J = 7,0 Hz), 2,15-2,30 (2H, m), 3,20-3,45 (10H, m), 3,54 (2H, d, J = 12 Hz), 3,64 (2H, d, J = 12 Hz), 4,03 (2H, t, J = 5,9 Hz), 6,84 (2H, d, J = 8,9 Hz), 6,97 (1H, d, J = 7,7 Hz), 7,25-7,40 (3H, m), 7,49 (1H, d, J = 5,6 Hz), 7,70 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,78 (1H, d, J = 5,6 Hz), 8,01 (1H, s), 10,95 (1H, s).	Dihidrocloruro
241	-H	-H		-H	-H	RMN H ¹ (DMSO-d ₈) δ ppm: 2,05-2,10 (2H, m), 2,67 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,78 (4H, s ancho), 3,22 (4H, s	-

						ancho), 4,11 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,91 (1H, d, J = 7,8 Hz), 7,01 (2H, d, J = 8,9 Hz), 7,20 (2H, d, J = 9,0 Hz), 7,25-7,35 (3H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,58 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,77 (1H, s).	
242	-H	-H		-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,05-2,15 (2H, m), 2,67 (2H, t, J = 7,2 Hz), 2,75 (4H, s ancho), 3,21 (4H, s ancho), 4,12 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,91 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,00-7,05 (2H, m), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,50-7,60 (3H, m), 8,08 (1H, s), 8,45 (1H, s).	-

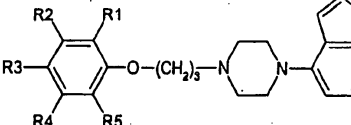
[Tabla 44]

								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión(°C)	Sal
243	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	224,0-232,0 (descomp.)	Dihidro- cloruro
244	-H	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	178,0-181,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
245	-H	-H	-CN	-H	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	105,5-107,0	-
246	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-H	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	263,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
247	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	242,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
248	-H	-H	-Br	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	118,0-120,0	-
249	-OCH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-H	Polvo de color blanco (Agua)	121,0-124,5	-
250	-Cl	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	Polvo de color amarillo claro (Etanol/éter isopropílico)	122,0-123,5	-
251	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	213,5-221,5 (descomp.)	Hidrocloreuro
252	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-F	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	231,5-233,5	Hidrocloreuro

[Tabla 45]

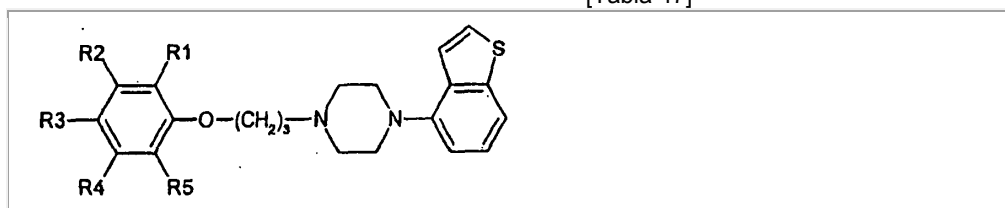
								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión(°C)	Sal
253	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-Cl	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	273,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
254	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-H	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	217,0-222,0	Hidrocloreuro
255	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-F	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	287,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
256	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ NHCH ₃	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	258,0 (descomp.)	Dihidrocloreuro
257	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	236,5 (descomp.)	Dihidrocloreuro
258	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)COCH ₃	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	215,0-217,0	Hidrocloreuro
259	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)COC ₂ H ₅	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	211,0-217,0	Hidrocloreuro
260	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)COC ₅ H ₅	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	210,5-212,0	Hidrocloreuro
261	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ C ₆ H ₆	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	196,0-202,0 (descomp.)	Dihidrocloreuro
262	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ NHC ₂ H ₅	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	230,0 (descomp.)	Dihidrocloreuro

[Tabla 46]

								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión(°C)	Sal
263	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	223,0 (descomp.)	Dihidrocloreuro
264	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-Cl	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	225,0-228,5	Hidrocloreuro
265	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-Cl	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	208,0-209,5	Hidrocloreuro
266	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-OCH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	205,5-213,5	Hidrocloreuro

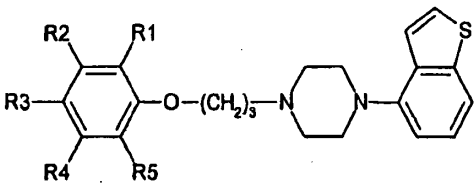
267	-CH ₃	-H	-CN	-H	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	105,5-106,0	-
268	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-OCH ₃	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	198,5-201,0	Hidrocloreuro
269	-H	-H	-SO ₂ NH ₂	-H	-H	Polvo de color blanco (Etanol)	199,0-203,0	-
270	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	280,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
271	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-F	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	220,5-224,0	Hidrocloreuro
272	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-F	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	181,5-184,5	Hidrocloreuro

[Tabla 47]

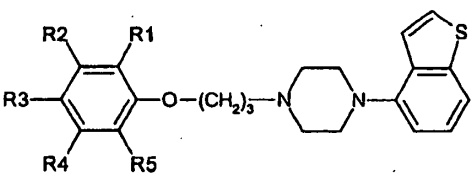


Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión(°C)	Sal
273	-H	-H	-CN	-OCH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	238,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
274	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-Br	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	237,5-242,5 (descomp.)	Hidrocloreuro
275	-H	-CN	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	217,5-221,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
276	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-Br	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	271,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
277	-H	-H	-H	-CO ₂ H	-H	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	242,5-244,5	Hidrocloreuro
278	-H	-H	-H	-H	-CN	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	221,5-226,0	Hidrocloreuro
279	-CN	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	128,5-130,0	-
280	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-CN	Polvo de color blanco (Diclorometano/agua)	271,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
281	-CONHC ₂ H ₅	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	220,0-227,5	Hidrocloreuro
282	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-CF ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	224,5-232,0	Hidrocloreuro

[Tabla 48]

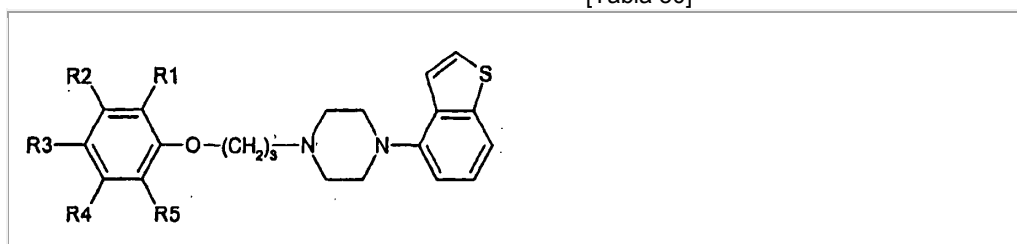
								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión(°C)	Sal
283	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-Cl	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	218,5-218,0	Hidrocloruro
284	-H	-H	-CO ₂ H	-Cl	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	259,0 (descomp.)	Hidrocloruro
285	-H	-OCH ₃	-CHO	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/2-propanol)	118,0-119,5	-
286	-H	-H	-CO ₂ H	-CF ₃	-H	Polvo de color blanco (Agua)	240,0 (descomp.)	Hidrocloruro
287	-H	-H	-CN	-CH ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	230,0-237,0	Hidrocloruro
288	-NO ₂	-H	-CO ₂ C ₂ H ₃	-H	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	113,0-114,0	-
289	-H	-H	-CHO	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	102,5-105,5	-
290	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-NO ₂	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	259,0 (descomp.)	Dihidrocloruro
291	-H	-H	-CH=CHCO ₂ H	-H	-H	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/agua)	265,0 (descomp.)	Hidrocloruro
292	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₆	-H	-CF ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	211,5-221,0	Hidrocloruro

[Tabla 49]

								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión(°C)	Sal
293	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-CF ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	269,0 (descomp.)	Hidrocloruro
294	-H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₆	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	206,0-208,0	Hidrocloruro
295	-H	-H	-CH=CHCONH ₂	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	210,5-215,0	-

296	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-H	-H	Polvo de color pardo claro (Acetato de etilo)	255,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
297	-H	-H	-CH=CHCONHCH ₃	-H	-H	Polvo de color blanco (2-propanol al 95%)	165,5-169,0	-
298	-H	-H	-CH=CHCON(CH ₃) ₂	-H	-H	Polvo de color blanco (2-propanol al 95%)	130,5-131,5	-
299	-H	-H	-CH=CHCONHC ₂ H ₅	-H	-H	Polvo de color blanco (2-propanol al 95%)	158,0-159,0	-
300	-H	-H	-CH=CHCONHCH ₂ CF ₃	-H	-H	Polvo de color blanco (2-propanol al 95%)	177,5-180,0	-
301	-H	-H	-(CH ₂) ₂ CO=C ₂ H ₅	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	235,0-237,5	Hidrocloreuro
302	-F	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	218,5-224,0	Hidrocloreuro

[Tabla 50]



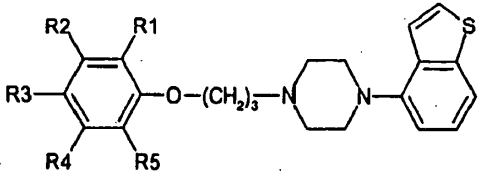
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión(°C)	Sal
303	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ CO ₂ H	-H	-H	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	240,0 (descomp.)	Hidro-cloruro
304	-F	-H	-H	-CO ₂ H	-H	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	260,0 (descomp.)	Hidro-cloruro
305	-Cl	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	241,0-245,0	Hidro-cloruro
306	-Cl	-H	-H	-CO ₂ H	-H	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	268,0 (descomp.)	Hidro-cloruro
307	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	238,0-242,0 (descomp.)	Hidro-cloruro
308	-CH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (éter isopropílico)	106,0-108,0	-

309	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ H	-H	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	256,5 (descomp.)	Hidrocloruro
310	-CH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Agua)	252,5 (descomp.)	Hidrocloruro
311	⁻ OCH ₃	⁻ OCH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	225,0-234,0	Hidrocloruro
312	-H	-H	⁻ C(CH ₃) ₂ CO ₂ CH ₃	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	222,0-226,5	Hidrocloruro

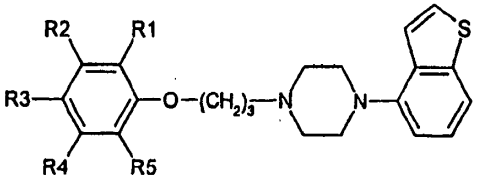
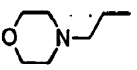
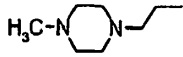
[Tabla 51]

Ej.	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión(°C)	Sal
313	⁻ OCH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	208,0-213,5	Hidrocloruro
314	-H	-H	-C(CH ₃) ₂ CO ₂ H	-H	-H	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/ácido acético)	257,5 (descomp.)	Hidrocloruro
315	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ CONH ₂	-H	-H	Polvo de color amarillo claro (2-propanol al 95%)	167,5-170,0	-
316	-H	-H	⁻ CH ₂ CH ₂ CONHC H ₃	-H	-H	Polvo de color blanco (2-propanol al 95%)	128,0-132,0	-
317	⁻ OCH ₃	-H	-H	-CO ₂ H	-H	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/agua)	250,0 (descomp.) -	Hidrocloruro
318	-H	-H	⁻ CH ₂ CH ₂ CONHC ₂ H ₅	-H	-H	Polvo de color blanco (2-propanol al 95%)	130,5-132,0	Hidrocloruro
319	-H	⁻ CH ₂ CONH ₂	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	132,5-134,0	Hidrocloruro
320	-H	-H	-H	⁻ CH ₂ CONHC H ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	173,5-175,0	Hidrocloruro
321	⁻ OCH ₃	-OCH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	Polvo de color blanco (Agua)	154,0-155,5	Hidrocloruro
322	⁻ OCH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-OCH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	239,0-242,0 (descomp.)	Hidrocloruro

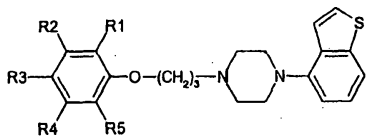
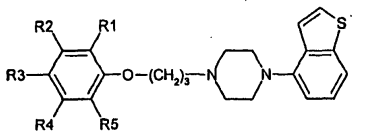
[Tabla 52]

								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión(°C)	Sal
323	-OCH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-OCH ₃	Polvo de color blanco (Agua)	191,0-196,0	-
324	-H	-H	-CSNHC ₂ H ₅	-H	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/THF)	193,0-196,5	Dihidrocloruro
325	-OCH ₃	-H	-COCH ₃	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	243,0 (descomp.)	Hidrocloruro
326	-CH ₂ CH=CH ₂	-H	-CO ₂ H	-H	-OCH ₃	Polvo de color blanco (Agua)	97,0-102,0	-
327	-C ₆ H ₅	-H	-CO ₂ H	-H	-OCH ₃	Polvo de color blanco (Agua)	145,5-150,5	-

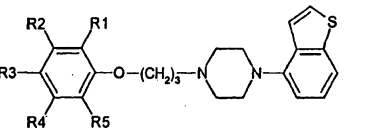
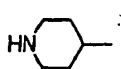
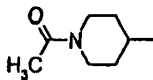
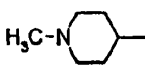
[Tabla 53]

								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión(°C)	Sal
328	-H	-H		-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	112,5-113,5	-
329	-H	-H		-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	112,0-113,0	-

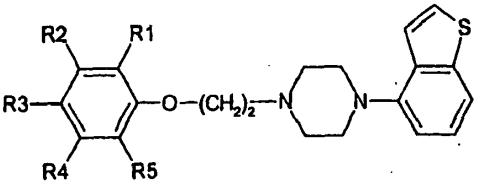
[Tabla 54]

								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	RMN	Sal	
330	-H	-H	-F	-H	-H	RMN H ¹ (DMSO-d ₆) δ ppm: 2,15-2,30 (2H, m), 3,10-3,25 (2H, m), 3,25-3,60 (4H, m), 3,55-3,75 (4H, m), 4,10 (2H, t, J = 6,0 Hz), 8,90-7,10 (4H, m), 7,25-7,40 (3H, m), 7,51 (1H, d, J = 5,6 Hz), 7,72 (1H, d, J = 8,3 Hz), 7,78 (1H, d, J = 5,5 Hz), 10,12 (1H, s ancho).	Hidrocloruro	
331	-H	-H	-H	-H	-H		Hidrocloruro	
								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
332	-H	-H	-H	-H	-NHCOCH ₃	Cristales en forma de agujas incoloras (Etanol)	243,7 - 244,8	-

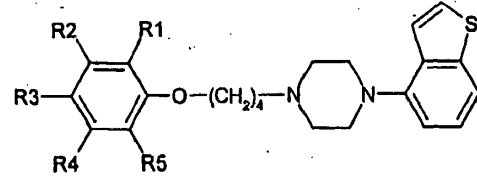
[Tabla 55]

								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	RMN	Sal	
333	-H	-H	-COCH ₃	-H	-OCH ₃	RMN ¹ H (DMSO-d ₆) δ ppm : 220-2,40 (2H, m), 2,53 (3H, s), 3,20-3,70 (10H, m), 3,83 (3H, s), 4,19 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,96 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,10 (1H, d, J = 8,5 Hz), 7,31 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,45-7,50 (2H, m), 7,62 (1H, dd, J = 2,0, 8,4 Hz), 7,69 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,76 (1H, d, J = 5,5 Hz), 11,14 (1H, s ancho).	Hidrocloruro	
334	-OCH ₃	-H	-H	-H	-OCH ₃		Hidrocloruro	
335	-H	-H		-H	-H	RMN ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 1,95-2,10 (6H, m), 2,60-2,75 (7H, m), 2,96 (2H, t, J = 11,3 Hz), 3,21 (4H, s ancho), 3,55 (2H, d, J = 12,4 Hz), 4,08 (2H, t, J = 8,2 Hz), 6,80-6,95 (3H, m), 7,17 (2H, d, J = 8,5 Hz), 7,25-7,35 (1H, m), 7,40 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,43 (1H, d, J = 5,6 Hz), 7,57 (1H, d, J = 8,1 Hz).	-	
336	-H	-H		-H	-H	RMN ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 1,55-1,65 (2H, m), 1,80-1,95 (2H, m), 2,00-2,10 (2H, m), 2,13 (3H, s), 2,55-2,75 (7H, m), 3,10-3,20 (6H, m), 3,83 (1H, d, J = 13,7 Hz), 4,05 (2H, t, J = 8,4 Hz), 4,78 (1H, d, J = 13,3 Hz), 6,85-6,95 (3H, m), 7,11 (2H, d, J = 8,8 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,39 (1H, d, J = 5,6 Hz), 7,42 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,55 (1H, d, J = 8,1 Hz).	-	
337	-H	-H		-H	-H	RMN ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 1,75-1,85 (4H, m), 2,00-2,10 (4H, m), 2,32 (3H, s), 2,35-2,45 (1H, m), 2,63 (2H, t, J = 7,4 Hz), 2,73 (4H, s ancho), 2,96 (2H, d, J = 11,5 Hz), 3,20 (4H, s ancho), 4,04 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,85-6,95 (3H, m), 7,14 (2H, d, J = 8,6 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,1 Hz).	-	

[Tabla 56]

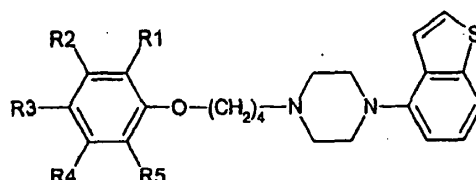
							
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	RMN	Sal
338	-H	-H	-F	-H	-H	RMN H^1 (DMSO- d_6) δ ppm: 3,10-3,25 (2H, m), 3,40-3,75 (8H, m), 4,40-4,45 (2H, m), 6,98 (1H, d, J = 7,7 Hz), 7,00-7,25 (4H, m), 7,33 (1H, dd, J = 7,9, 7,8 Hz), 7,50 (1H, d, J = 5,6 Hz), 7,71 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,78 (1H, d, J = 5,5 Hz), 10,37 (1H, s ancho).	Hidrocloruro
339	-H	-H	-H	-H	-H	RMN H^1 (DMSO- d_6) δ ppm: 3,10-3,35 (2H, m), 3,40-3,80 (8H, m), 4,48 (2H, t, J = 4,8 Hz), 8,85-7,10 (4H, m), 7,25-7,40 (3H, m), 7,51 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,71 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,77 (1H, d, J = 5,5 Hz), 10,80-11,20 (1H, ancho).	Hidrocloruro

[Tabla 57]

							
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	RMN	Sal
340	R1 -H	-H	-H	-H	-H	RMN H^1 (DMSO- d_6) δ ppm: 1,70-2,00 (4H, m), 3,10-3,40 (6H, m), 3,50-3,80 (4H, m), 4,03 (2H, t, J = 5,9 Hz), 6,90-7,00 (5H, m), 7,25-7,40 (3H, m), 7,50 (1H, d, J = 5,6 Hz), 7,71 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,77 (1H, d, J = 5,5 Hz), 10,59 (1H, s ancho)	Hidrocloruro
341	-H	-H	-F	-H	-H	RMN H^1 (DMSO- d_6) δ ppm: 1,75-1,95 (4H, m), 3,10-3,50 (8H, m), 3,50-3,65 (4H, m), 4,00 (2H, t, J = 5,9 Hz), 8,90-7,00 (3H, m), 7,00-7,20 (2H, m), 7,32 (1H, dd, J = 7,9, 7,8 Hz), 7,50 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,71 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,77 (1H, d, J = 5,5 Hz), 10,40-10,80 (1H, ancho).	Hidrocloruro
342	-H	-H	-COCH ₃	-H	-OCH ₃	RMN H^1 (DMSO- d_6) δ ppm: 1,80-1,95 (4H, m), 2,52 (3H, s), 3,20-3,35 (6H, m), 3,50-3,85 (4H, m), 3,83 (3H, s), 4,00-4,15 (2H, m), 6,95 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,08 (1H, d, J = 8,5 Hz), 7,30 (1H, dd, J = 7,8, 7,8 Hz), 7,40-7,50 (2H, m), 7,81 (1H, dd, J = 1,9, 8,4 Hz), 7,69 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,75 (1H, d, J = 5,6 Hz), 11,0 (1H, s ancho).	Hidrocloruro

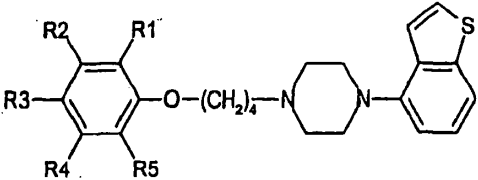
5

Tabla 58-1]

									
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto fusión(°C)	de	Sal
343	-H	-H	NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	241,0 (descomp.)		Hidrocloruro
344	-H	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	Polvo de color blanco	203,0-209,5		Hidrocloruro

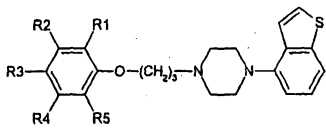
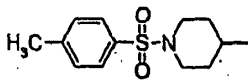
						(Acetato de etilo)		
345	-H	-H	-CN	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	220,0-223,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
346	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-H	Polvo de color blanco (Ácido clorhídrico/-ácido acético)	247,5-250,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
347	-H	-CN	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	196,0-198,5	Hidrocloreuro
348	-H	-H	-H	-CO ₂ H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	255,5-258,5	Hidrocloreuro
349	-CN	-H	-H	-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	187,5-188,5	Hidrocloreuro
350	-H	-H	-H	-CONHCH ₂ CF ₃	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/2-propanol)	137,0 (descomp.)	Hidrocloreuro
351	-H	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/2-propanol)	130,0-135,0	Hidrocloreuro
352	-H	-H	-H	-H	-CO ₂ H	Polvo de color blanco (Diclorometano/agua)	192,0-197,0	Hidrocloreuro
353	-H	-CONH ₂	-H	-H	-H	Polvo de color amarillo claro (2-propanol)	148,0-151,0	-

[Tabla 58-2]

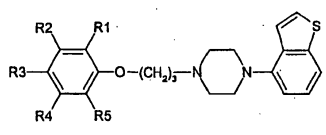
								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión(°C)	Sal
354	-H	-H	-H	-CONHCH ₃	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	234,0-239,0	Hidrocloreuro

355	-H	-H	-H	-CON(CH ₃) ₂	-H	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	135,0-141,5	Hidrocloreuro
356	-H	-H	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	209,5-213,0	Hidrocloreuro

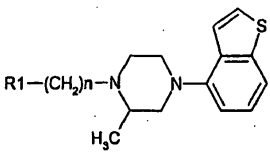
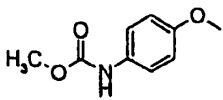
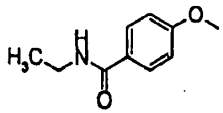
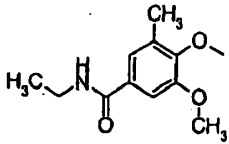
[Tabla 59]

							
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	RMN	Sal
357	-H	-H	$-(CH_2)_2N(CH_3)CO_2C(CH_3)_3$	-H	-H	RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,43(9H, s), 1,97-2,07 (2H, m), 2,84(2H, t, J = 7,5 Hz), 2,69-2,87(6H, m), 2,81(3H, s), 3,15-3,27(4H, m), 3,38 (2H, t, J = 7,5 Hz), 4,04 (2H, t, J = 8,3 Hz), 8,83-8,92 (3H, m), 7,02-7,15(2H, m), 7,28(1H, t, J = 7,8 Hz), 7,37-7,43 (2H, m), 7,55(1H, d, J = 8,80 Hz)	-
358	-H	-H		-H	-H	RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,60-2,10 (6H, m), 2,30-2,40 (2H, m), 2,47 (3H, s), 2,60-2,70 (1H, m), 2,74 (4H, ancho), 2,85-3,00 (2H, m), 3,20 (4H, ancho), 3,90-4,10 (4H, m), 6,85-6,95 (2H, m), 7,07 (1H, d, J = 8,8 Hz), 7,25-7,45 (3H, m), 7,56 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,69 (2H, d, J = 8,2 Hz).	-
359	-H	-H	-H	-H	-CO ₂ H	RMN H^1 ($DMSO-d_6$) δ ppm : 2,20-2,43 (2H, m), 3,17-3,77 (10H, m), 4,30 (2H, t, J = 8,0 Hz), 6,90-7,20 (2H, m), 7,30-7,40 (2H, m), 7,50-7,03 (1H, m), 7,70-7,79 (4H, m), 11,00 (1H, ancho), 12,71(1H, ancho).	-
360	-OCH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-CH ₃	RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,95-2,10 (2H, m), 2,31 (3H, s), 2,60-2,80 (6H, m), 3,10-3,30 (4H, m), 3,89 (6H, s), 4,10 (2H, t, J = 8,4 Hz), 6,90 (1H, dd, J = 0,5, 7,6 Hz), 7,27 (1H, dd, J = 7,8, 7,8 Hz), 7,35-7,45 (3H, m), 7,50-7,60 (2H, m).	-
361	-OCH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-CH ₃	RMN H^1 ($DMSO-d_6$) δ ppm : 1,90-2,05 (2H, m), 2,28 (3H, s), 2,55-3,30 (10H, m), 3,85 (3H, s), 4,03 (2H, t, J = 6,1 Hz), 6,93 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,29 (1H, dd, J = 7,8, 7,8 Hz), 7,35-7,50 (3H, m), 7,65 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,72 (1H, d, J = 5,5 Hz), 11,50-13,50 (1H, ancho).	-

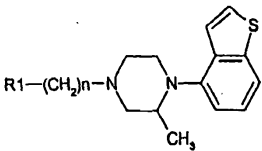
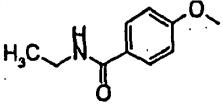
[Tabla 60]

							
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	RMN	Sal
362	-CH ₂ CH=CH ₂	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,98-2,09(2H, m), 2,70-2,83(6H, m), 3,13-3,30(4H, m), 3,45(2H, d, J = 6,5 Hz), 3,89(3H a), 4,10(2H, t, J = 8,4 Hz), 5,04-5,11(2H, m), 5,91-0,09(1H, m), 6,90(1H, d, J = 7,5 Hz), 7,24-7,31(1H, m), 7,38-7,44(2H, m), 7,47-7,57(3H, m).	-
363	-C ₃ H ₇	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 0,97(3H, t, J = 7,3 Hz), 1,52-1,74(2H, m), 1,93-2,13(2H, m), 2,57-2,85(6H, m), 3,07-3,30(4H, m), 3,89(6H, s), 4,09(2H, t, J = 6,3 Hz), 6,90(1H, d, J = 7,5 Hz), 7,24-7,31(1H, m), 7,38-7,45(3H, m), 7,52-7,57(2H, m).	-

[Tabla 61]

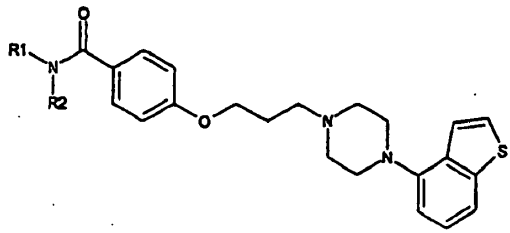
					
Ejemplo	R1	n	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión(°C)	Sal
364		3	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	128,0-138,5	Hidrocloruro
365		3	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	130,0-136,0	Hidrocloruro
366		3	Polvo de color blanco		Fumarato

[Tabla 62]

					
Ejemplo	R1	n	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión(°C)	Sal
367		3	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	151,5-158,5	Hidrocloruro

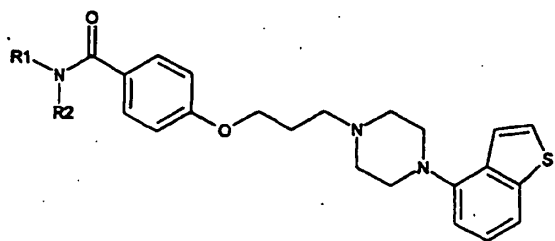
5

[Tabla 63]

					
---	--	--	--	--	--

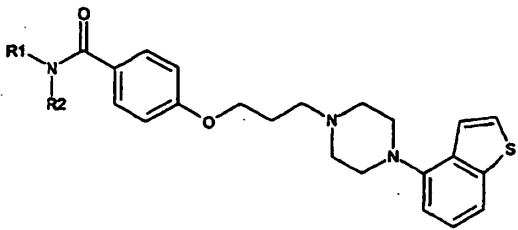
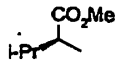
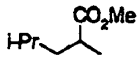
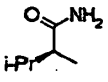
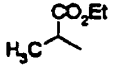
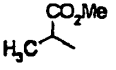
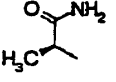
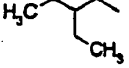
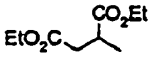
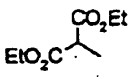
Ejemplo	R1	R2	MS(M+1)
368	-H	-ciclo-C ₈ H ₁₁	478
369	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	508
370	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	484
371	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	481
372	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	512
373	-C ₃ H ₇	-CH ₂ -ciclo-C ₃ H ₅	492
374	-CH ₂ CH=CH ₂	-ciclo-C ₅ H ₉	504
375	-C ₂ H ₃	-C ₂ H ₅	452
376	-H	-C ₄ H ₉	452
377	-H	-C(CH ₃) ₃	452
378	-H	-ciclo-C ₇ H ₂₃	492
379	-C ₂ H ₅	-ciclo-C ₆ H ₁₁	506
380	-C ₂ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	466
381	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	452
382	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	454
383	-H	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	488
384	-H	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	482
385	-H	-1-CH ₃ -CICLOHEXILO	492
386	-H	-CH ₂ -ciclo-C ₃ H ₅	450
387	-H	-CH ₂ -ciclo-C ₆ H ₁₁	492
388	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	468
389	-H	-CH ₂ CONH ₂	453
390	-CH ₃	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	482
391	-H	-CH ₂ CCH	434
392	-CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	452
393	-H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	466
394	-H	-CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃	480
395	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	467
396	-CH ₃	-CH ₂ -ciclo-C ₃ H ₅	464
397	-H	-CH ₂ CF ₃	478
398	-CH ₃	-ciclo-C ₆ H ₁₁	492
399	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OH	468
400	-CH ₂ CH ₂ OH	-ciclo-C ₆ H ₁₁	522
401	-H	-ciclo-C ₅ H ₉	464
402	-H	-3-PIRIDILO	473
403	-H	-4-PIRIDILO	473
404	-CH ₂ CH ₂ OH	-C ₆ H ₅	516

[Tabla 64]

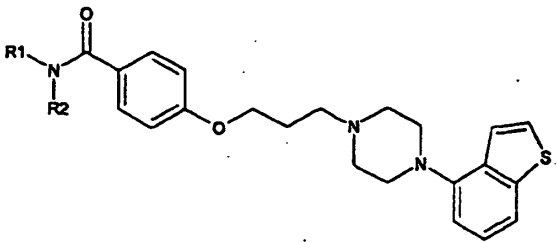
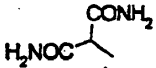
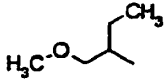
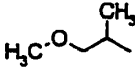
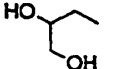
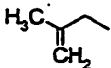
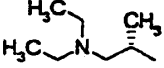
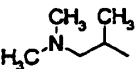
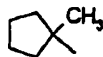


Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
405	-H	-C ₆ H ₅	435
406	-H	-CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	468
407	-H	-CH(C ₂ H ₅) ₂	449
408	-H	-CH ₂ CN	566
409	-H	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	523
410	-H	-CH ₂ CH ₂ CN	523
411	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	481
412	-CH ₃	-(CH ₂) ₃ N(C ₂ H ₅) ₂	482
413	-C ₂ H ₆	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	523
414	-H	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	481
415	-H	-(CH ₂) ₅ OH	495
416	-H	-(CH ₂) ₂ N(I-Pr) ₂	524
417	-H	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃) ₂	524
418	-H	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	563
419	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	509
420	-H	-(CH ₂) ₄ CO ₂ C ₂ H ₅	493
421	-ciclo-C ₅ H ₉	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	528
422	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	484
423	-H	NHCH ₂ CF ₃	496
424	-H	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	482
425	-H	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	442
426	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	467
427	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	470
428	-H	-CH ₂ CH ₂ F	435
429	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	468
430	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	449

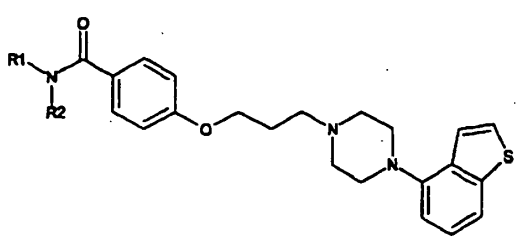
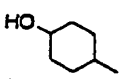
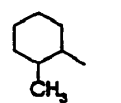
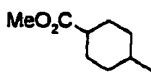
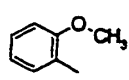
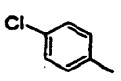
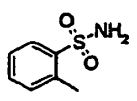
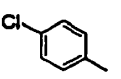
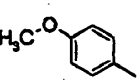
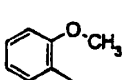
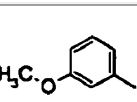
[Tabla 65]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
431	-H		510
432	-H		524
434	-H		495
435	-H		496
436	-H		482
437	-H		467
438	-H		466
439	-H		480
440	-H		568
441	-H		554

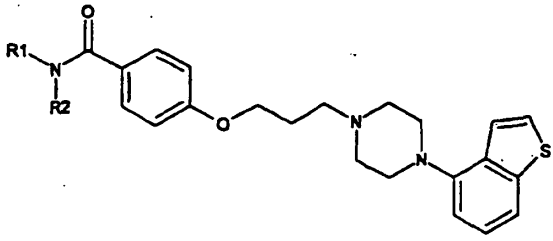
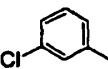
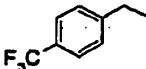
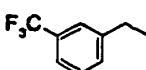
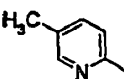
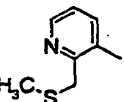
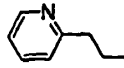
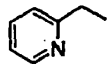
[Tabla 66]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
442	-H		496
443	-H		482
444	-H		468
445	-H		470
446	-H		450
447	-H		509
448	-H		481
449	-H		450
450	-H		478

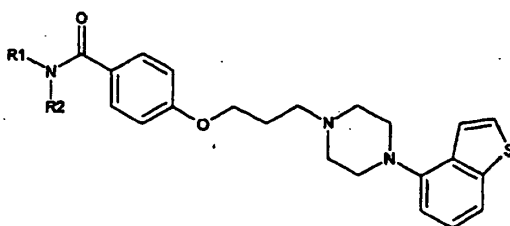
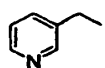
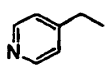
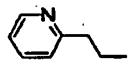
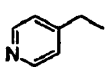
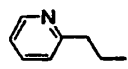
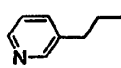
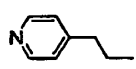
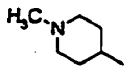
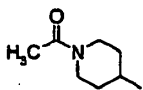
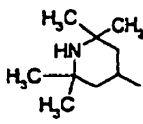
[Tabla 67]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
451	-H		494
452	-H		492
453	-H		536
454	-CH ₃		516
455	-CH ₃		520
456	-H		551
457	-H		506
458	-H		502
459	-H		502
460	-H		502

[Tabla 68]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
461	-H		508
462	-H		506
463	-H		540
464	-H		554
465	-H		554
466	-H		487
467	-H		533
468	-CH ₃		515
469	-H		487

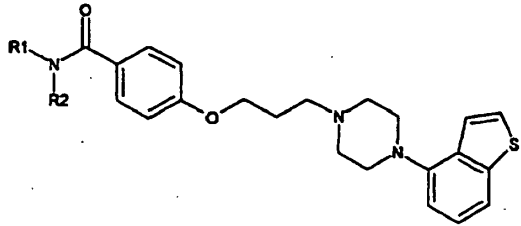
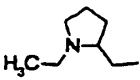
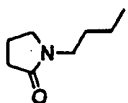
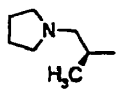
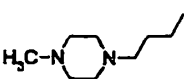
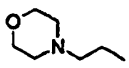
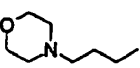
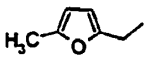
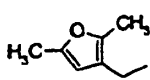
[Tabla 69]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
470	-H		487
471	-H		487
472	-C ₂ H ₅		529
473	-C ₂ H ₅		515
474	-H		501
475	-H		501
476	-H		501
477	-CH ₃		507
478	-CH ₃		535
479	-H		535

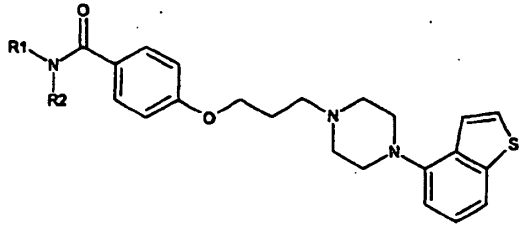
[Tabla 70]

Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
480	-H		551
481	-H		579
482	-H		479
483	-H		493
484	-H		507
485	-H		565
486	-H		465
487	-H		479
488	-H		493
489	-H		507

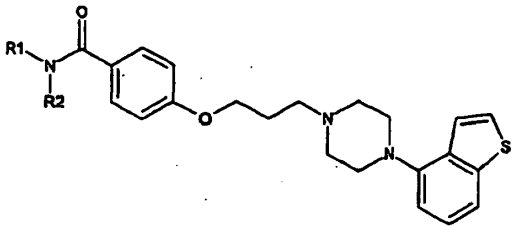
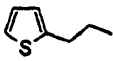
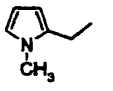
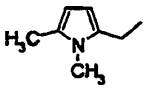
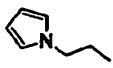
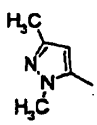
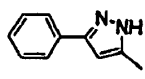
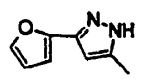
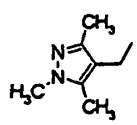
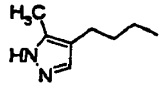
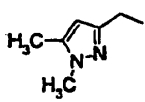
[Tabla 71]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
490	-H		507
491	-H		521
492	-H		507
493	-H		536
494	-H		507
495	-H		509
496	-H		523
497	-H		476
498	-H		490
499	-H		504

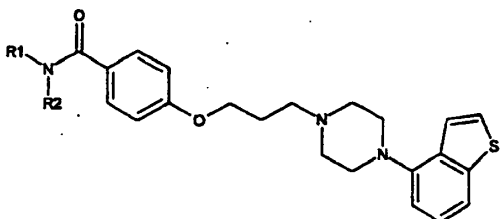
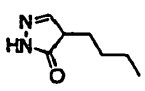
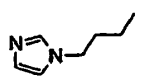
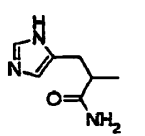
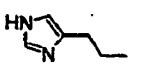
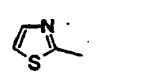
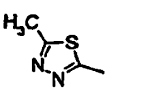
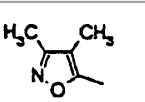
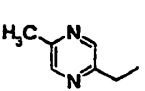
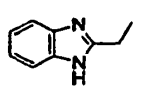
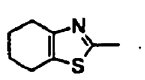
[Tabla 72]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
500	-H		476
501	-H		480
502	-H		480
503	-C ₂ H ₅		522
504	-H		494
505	-H		482
506	-H		496
507	-H		492
508	-H		506
509	-H		492

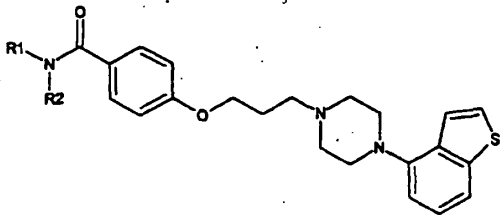
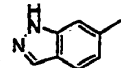
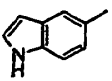
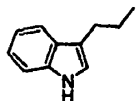
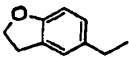
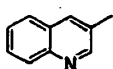
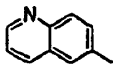
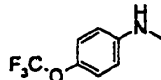
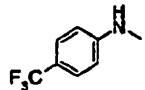
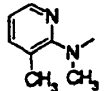
[Tabla 73]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
510	-H		508
511	-H		489
512	-H		503
513	-H		489
514	-H		490
515	-H		538
516	-H		528
517	-H		518
518	-H		518
519	-H		504

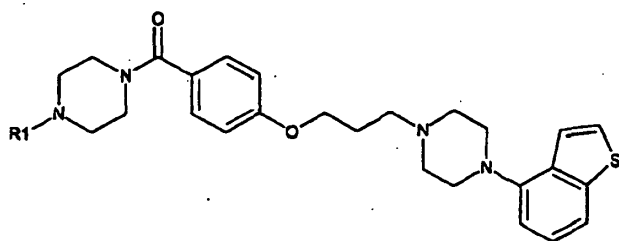
[Tabla 74]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
520	-H		520
521	-H		504
522	-H		533
523	-H		490
524	-H		479
525	-H		494
526	-H		491
527	-H		502
528	-H		528
529	-H		533

[Tabla 75]

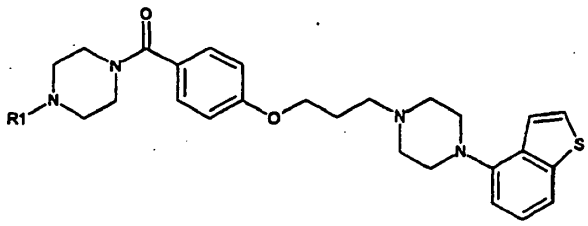
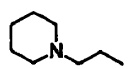
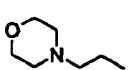
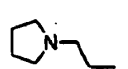
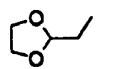
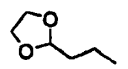
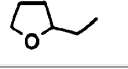
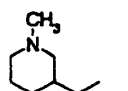
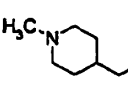
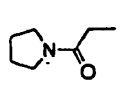
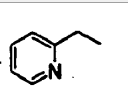
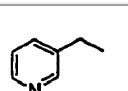
			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
530	R1		512
531	-H		511
532	-H		539
533	-H		528
534	-H		523
535	-H		523
536	-H		555
537	-H		571
538	-H		555
539	-H		570

[Tabla 76]

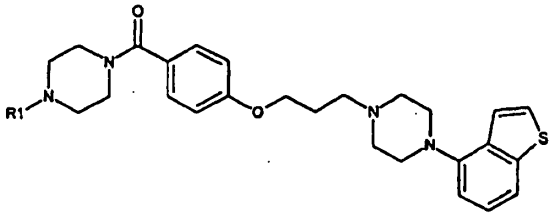
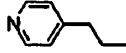
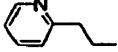
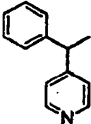
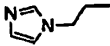
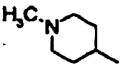
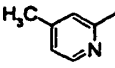


Ejemplo	R1	EM (M+1)
540	-H	465
541	-C ₄ H ₈	521
542	-CH(C ₂ H ₅) ₂	535
543	-CH(CH ₃) ₂	507
544	-C(CH ₃) ₂	535
545	-C ₃ H ₇	507
546	-C ₂ H ₅	493
547	-C ₆ H ₁₃	549
548	-ciclo-C ₅ H ₉	533
549	-ciclo-C ₇ H ₁₃	561
550	-CH ₂ CH ₂ OH	509
551	-CH ₂ CH ₂ OC ₃	523
552	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	537
553	-(CH ₂) ₄ OCH ₃	551
554	-CO ₂ C ₂ H ₅	537
555	-CO ₂ C(CH ₃) ₃	565
556	-COCH ₃	507
557	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	550
558	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	536

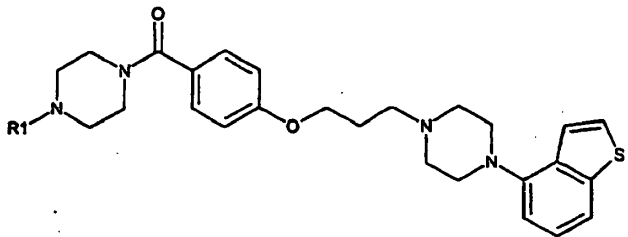
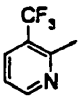
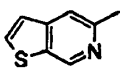
[Tabla 77]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
559		576
560		578
561		562
562		551
563		565
564		549
565		576
566		576
567		576
568		556
569		556

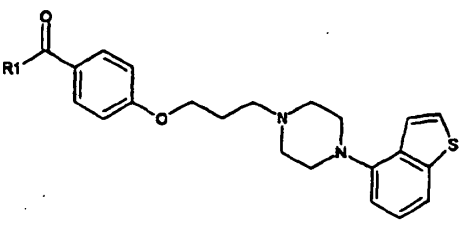
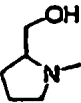
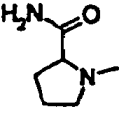
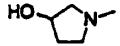
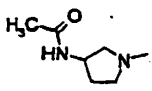
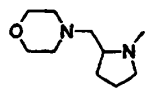
[Tabla 78]

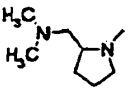
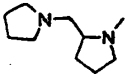
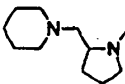
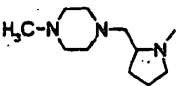
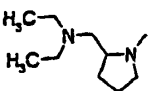
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
570		556
571		570
572		570
573		632
574		559
575		545
576		561
577	-4-PIRIDILO	542
578	-3-PIRIDILO	542
575	-2-PIRIDILO	542
580		567
581		556
582		556

[Tabla 79]

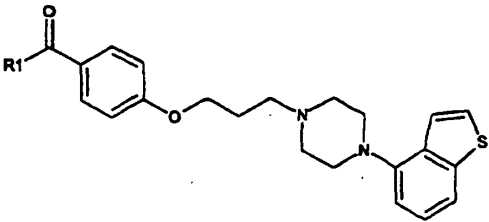
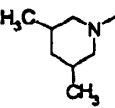
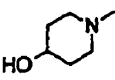
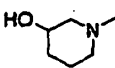
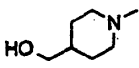
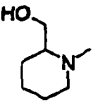
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
583		610
584		598

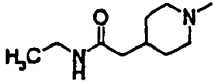
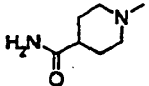
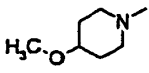
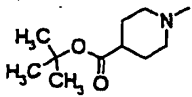
[Tabla 80]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
585		450
586		480
587		493
588		466
589		507
590		549

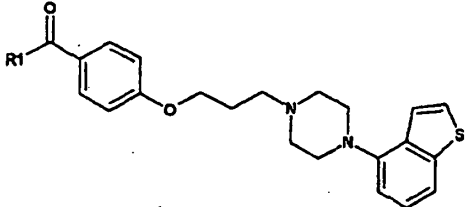
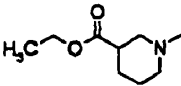
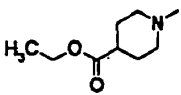
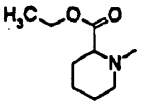
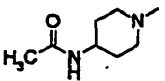
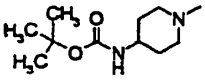
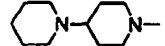
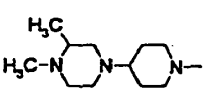
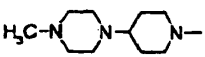
591		507
592		533
593		547
594		562
595		535

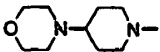
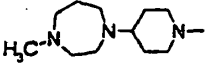
[Tabla 81]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
596		464
597		492
598		480
599		480
600		494
601		494

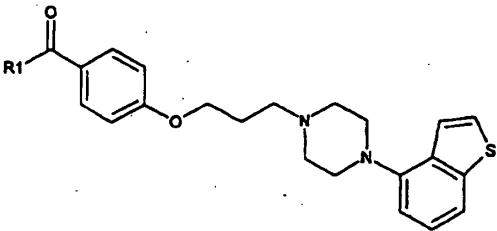
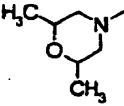
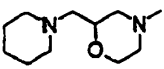
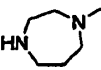
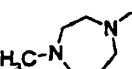
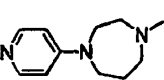
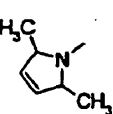
602		549
603		507
604		494
605		564

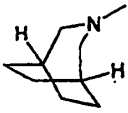
[Tabla 82]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
606		536
607		536
608		536
609		521
610		578
611		547
612		576
613		562

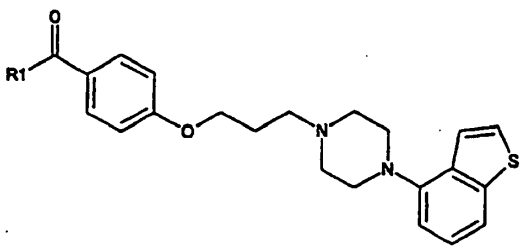
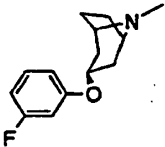
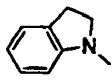
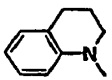
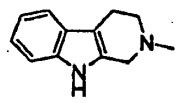
614		549
615		576
616		522

[Tabla 83]

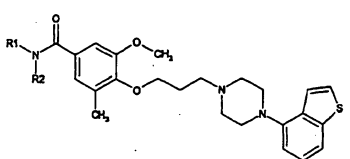
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
617		478
618		482
619		494
620		563
621		479
622		493
623		556
624		476

625		468
626		504

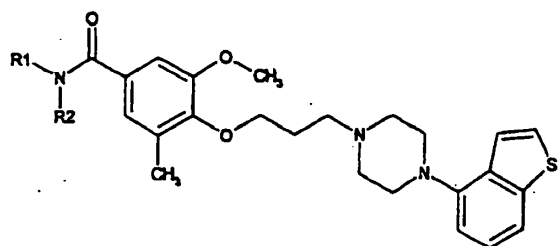
[Tabla 84]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
627		600
628		498
629		512
630		551

[Tabla 85]

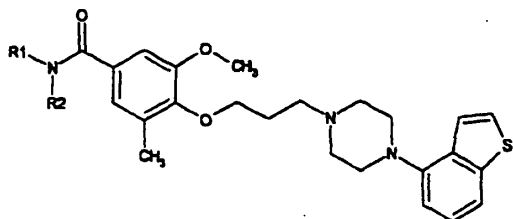
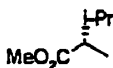
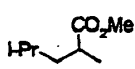
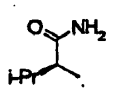
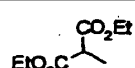
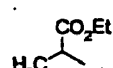
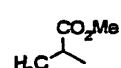
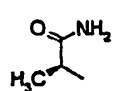
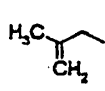
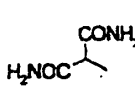
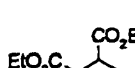
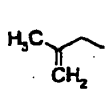
			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
631	-H	-ciclo-C ₆ H ₁₁	522
632	-H	-CH(CH ₃) ₂	482
633	-H	-C ₄ H ₉	496
634	-H	-ciclo-C ₃ H ₅	480
635	-H	-ciclo-C ₇ H ₁₃	536
636	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	530
637	-H	-C ₃ H ₇	482
638	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	496
639	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	498
640	-H	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	512
641	-H	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	526
642	-H	-1-CH ₃ -CICLOHEXILO	536
643	-H	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	560
644	-H	-ciclo-C ₅ H ₉	508
645	-H	-CH ₂ -ciclo-C ₃ H ₅	494
646	-H	-CH ₂ -ciclo-C ₆ H ₁₁	536
647	-H	-CH(CH ₃)C ₆ H ₅	544
648	-H	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	544
649	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	512
650	-H	-CH ₂ CONH ₂	497
651	-H	-CH ₂ CCH	478
652	-H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	510
653	-H	-CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃	524
654	-H	-CH ₂ C(CH ₃) ₃	510
655	-CH ₃	-ciclo-C ₆ H ₁₁	536
656	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	496
657	-H	-C(CH ₃) ₃	496
658	-CH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	544
659	-C ₂ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	510
660	-CH ₃	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	526
661	-CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	496
662	-CH ₃	-CH ₂ -ciclo-C ₃ H ₅	508
663	-H	CH ₂ CF ₃	522
664	-H	-CH(C ₂ H ₅) ₂	510

[Tabla 86]

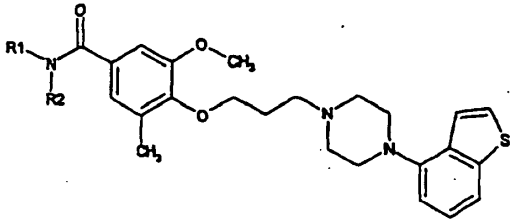
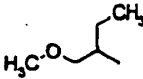
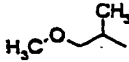
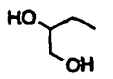
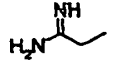
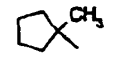
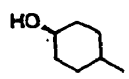
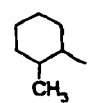
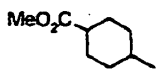
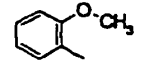
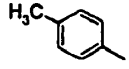


Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
665	-H	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	512
666	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	484
667	-H	-CH ₂ CN	479
668	-C ₂ H ₅	-2-PIRIDILO	545
669	-H	-3-PIRIDILO	517
670	-H	-C ₆ H ₅	516
671	-H	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	525
672	-H	-CH ₂ CH(C ₂ H ₅) ₂	524
673	-H	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	528
674	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	540
675	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	526
676	-H	-CH ₂ CH ₂ F	486
677	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	511
678	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	514
679	-H	-CH ₂ CHF ₂	504

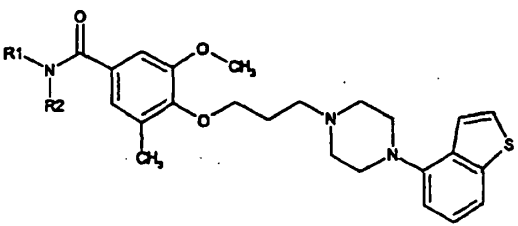
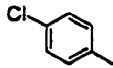
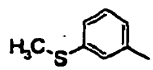
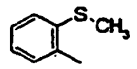
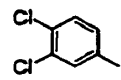
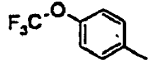
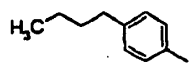
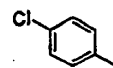
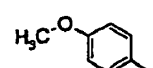
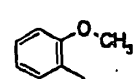
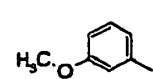
[Tabla 87]

			
Ejemplo	R1		EM (M+1)
680	-H		554
681	-H		568
682	-H		539
683	-H		598
684	-H		540
685	-H		526
686	-H		511
687	-H		494
688	-H		540
689	-H		612
690	-C2H5		522

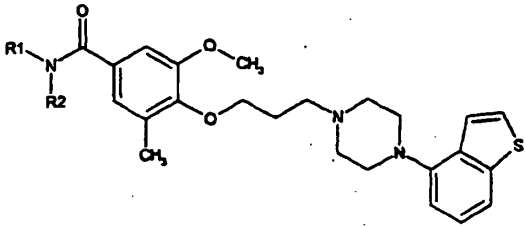
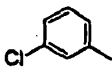
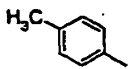
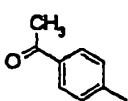
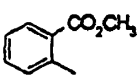
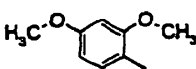
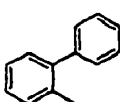
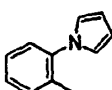
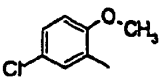
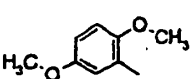
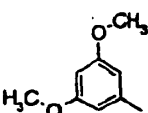
[Tabla 88]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
691	-H		526
692	-H		512
693	-H		514
694	-H		496
695	-H		494
696	-H		522
697	-H		538
698	-H		536
699	-H		580
700	-CH ₃		560
701	-CH ₃		544

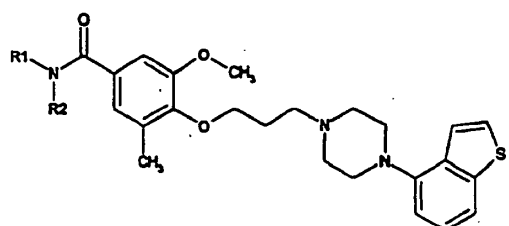
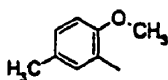
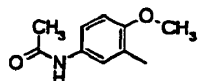
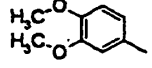
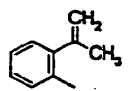
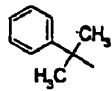
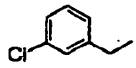
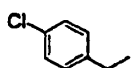
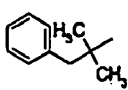
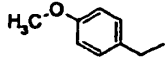
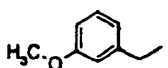
[Tabla 89]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
702	-CH ₃		564
703	-H		562
704	-H		562
705	-H		584
706	-H		600
707	-H		572
708	-H		550
709	-H		546
710	-H		546
711	-H		546
712	-H		550

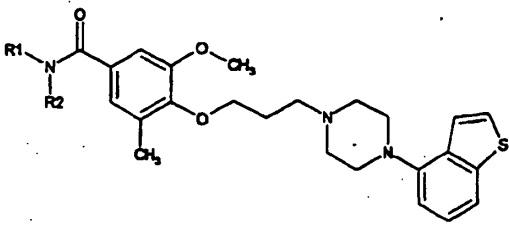
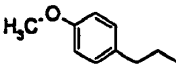
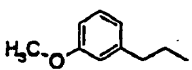
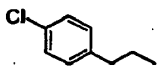
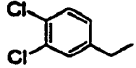
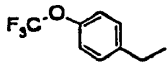
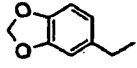
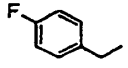
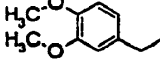
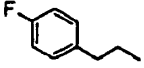
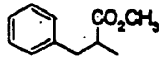
[Tabla 90]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
713	-H		550
714	-H		530
715	-H		558
716	-H		574
717	-H		576
718	-H		592
719	-H		581
720	-H		580
721	-H		576
722	-H		576

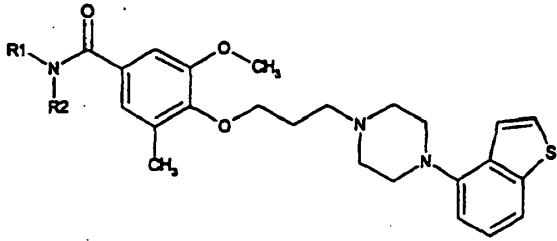
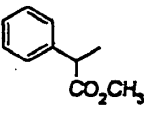
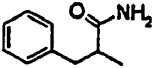
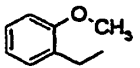
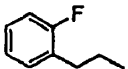
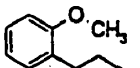
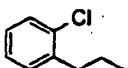
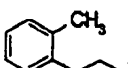
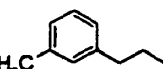
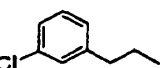
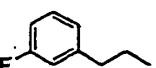
[Tabla 91]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
723	-H		560
724	-H		603
725	-H		576
726	-H		556
727	-H		558
728	-H		564
729	-H		564
730	-H		564
731	-H		572
732	-H		560
733	-H		560

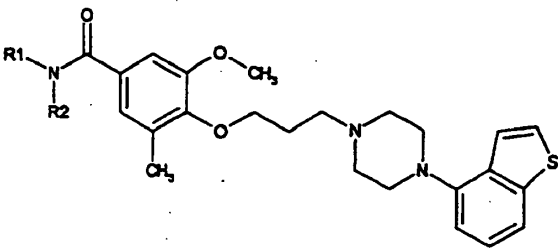
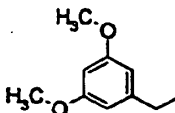
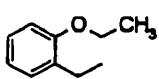
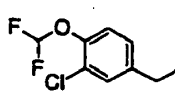
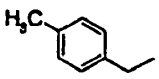
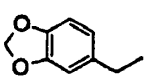
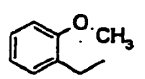
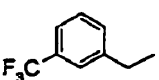
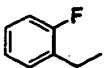
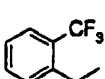
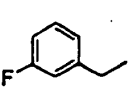
[Tabla 92]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
734	-H		574
735	-H		574
736	-H		578
737	-H		598
738	-H		614
739	-H		574
740	-H		548
741	-H		590
742	-H		544
743	-H		562
744	-H		602

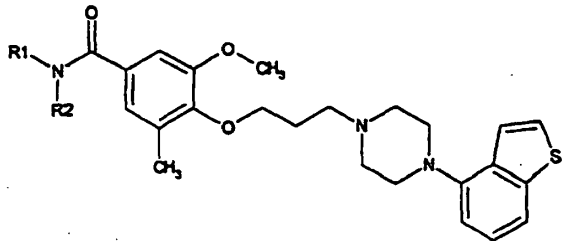
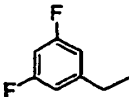
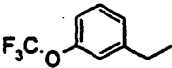
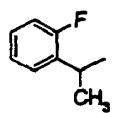
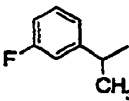
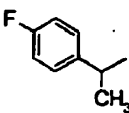
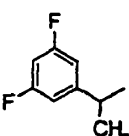
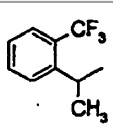
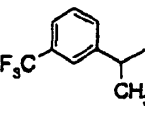
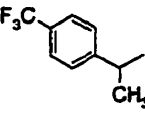
[Tabla 93]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
745	-H		588
746	-H		587
747	-H		560
748	-H		562
745	-H		574
750	-H		578
751	-H		558
752	-H		558
753	-H		578
754	-H		562

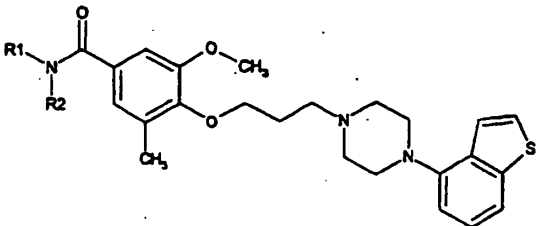
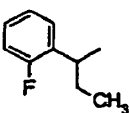
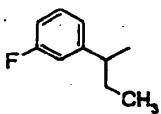
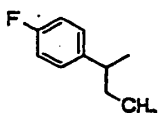
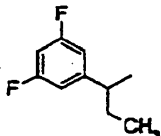
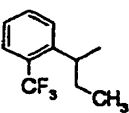
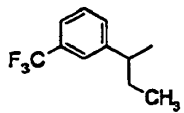
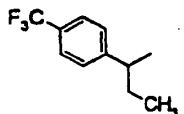
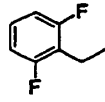
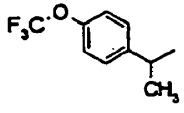
[Tabla 94]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
755	-H		590
756	-H		574
757	-H		830
758	-CH ₃		558
759	-CH ₃		588
760	-CH ₃		574
761	-H		598
762	-H		548
763	-H		598
764	-H		548

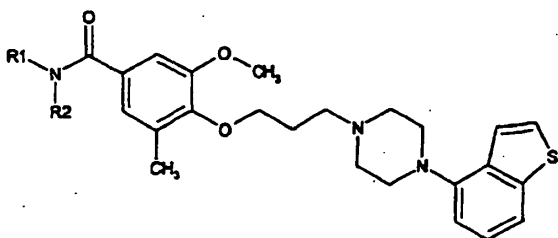
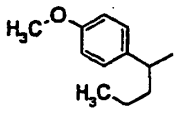
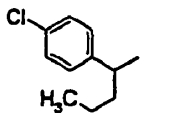
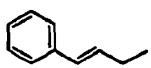
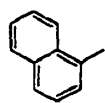
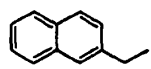
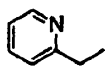
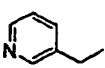
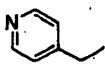
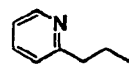
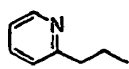
[Tabla 95]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
765	-H		566
766	-H		614
767	-H		562
768	-H		562
769	-H		562
770	-H		580
771	-H		612
772	-H		612
773	-H		612

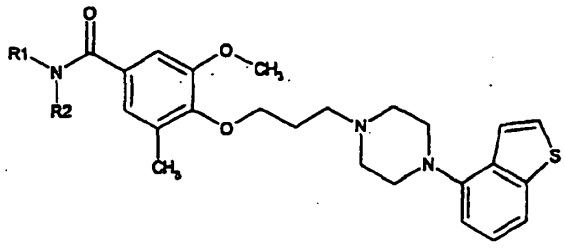
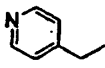
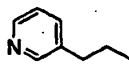
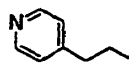
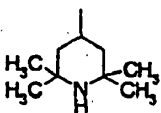
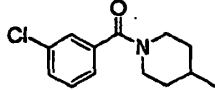
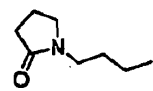
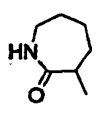
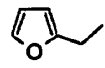
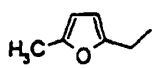
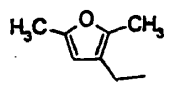
[Tabla 96]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
774	-H		576
775	-H		576
776	-H		576
777	-H		594
778	-H		626
779	-H		626
780	-H		626
781	-H		566
782	-H		628

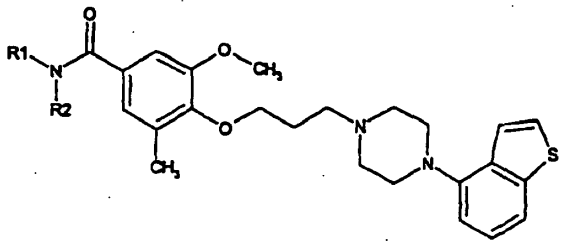
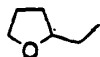
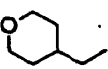
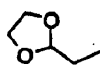
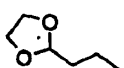
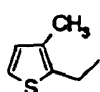
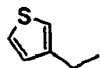
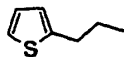
[Tabla 97]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
783	-H		602
784	-H		606
785	-C ₂ H ₅		584
786	-H		566
787	-H		580
788	-H		531
789	-H		531
790	-H		531
791	-H		545
792	-C ₂ H ₅		573

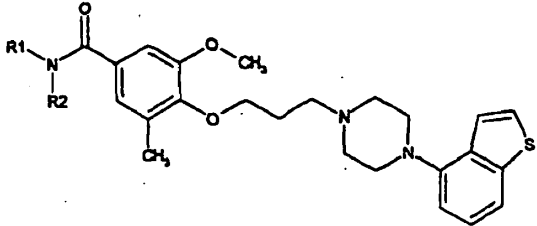
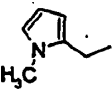
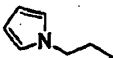
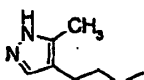
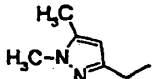
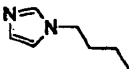
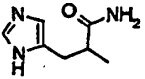
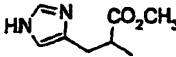
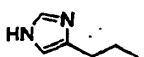
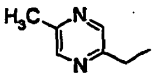
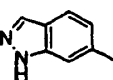
[Tabla 98]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
793	-C ₂ H ₅		559
794	-H		545
795	-H		545
796	-H		579
797	-CH ₃		675
798	-H		565
799	-H		551
800	-H		520
801	-H		534
802	-H		548

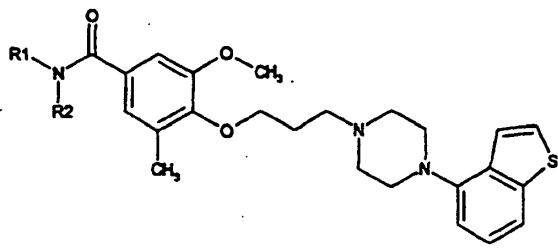
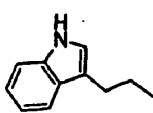
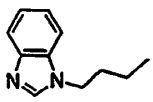
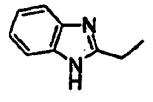
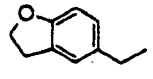
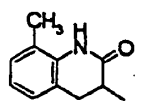
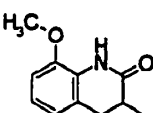
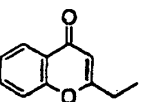
[Tabla 99]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
803	-H		520
804	-H		524
805	-H		524
806	-H		538
807	-H		526
808	-H		540
809	-H		536
810	-H		550
811	-H		536
812	-H		550

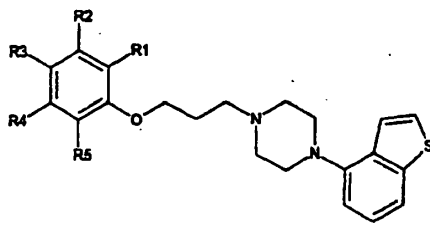
[Tabla 100]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
813	-H		533
814	-H		533
815	-H		562
816	-H		548
817	-H		548
818	-H		577
819	-H		592
820	-H		534
821	-H		537
822	-H		546
823	-H		556

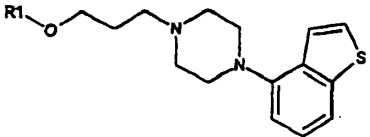
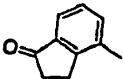
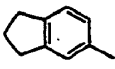
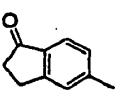
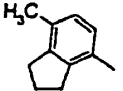
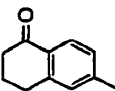
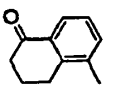
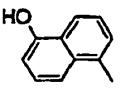
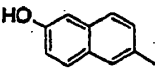
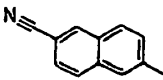
[Tabla 101]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
824	-H		583
825	-H		598
826	-H		570
827	-H		572
828	-H		599
829	-H		615
830	-H		598

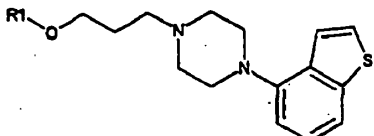
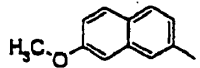
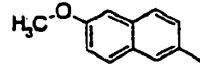
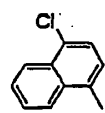
[Tabla 102]

						
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	EM (M+1)
831	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	410
832	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	410
833	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	383
834	-H	-H	-Cl	-H	-H	387
835	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	367
836	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	421
837	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	437
838	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	399
839	-H	-H	C ₆ H ₅	-H	-H	429
840	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	459
841	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	398
842	-H	-H	-COCH ₃	-H	-H	395
843	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	413
844	-OCH ₃	-H	-H	-H	-OCH ₃	413
845	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	413
846	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	367
847	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	381
848	-F	-H	-H	-H	-H	371
849	-H	-F	-H	-H	-H	371
850	-H	-H	-F	-H	-H	371
851	-F	-H	-F	-H	-H	389
852	-H	-F	-H	-H	-H -F	389
853	-F	-H	-H	-H	-F	389
854	-F	-H	-H	-CH ₃	-H	385
855	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-H	-H	425
856	-CH ₃	-H	-COCH ₃	-H	-H	409
857	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	-H	445
858		-H	-H	-H	-H	420
859	-H	-H		-H	-H	419

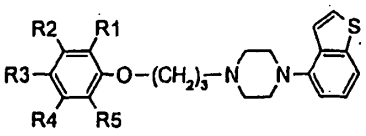
[Tabla 103]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
860		407
861		393
862		407
863		407
864		421
865		421
866		419
867		419
868		428

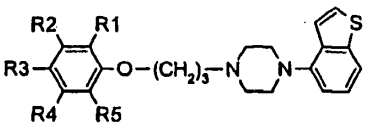
[Tabla 104]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
869		433
870		433
871		437

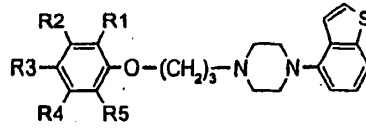
[Tabla 105]

								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	sal
872	⁻ OCH ₃	-H	-NHCO ₂ C ₂ H ₅	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	235,5-237,5	Hidrocloruro
873	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-OH	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	246,5 (descomp.)	Hidrocloruro
874	-CH ₃	-H	-Br	-H	⁻ OCH ₃	Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	265,0 (descomp.)	Hidrocloruro
875	⁻ OCH ₃	-H	-NHCOCH ₂ NH- CO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/ éter isopropílico)	140,5-142,5	-
876	-CH ₃	-H	-NHCOCH ₂ NH ₂	-H	⁻ OCH ₃	Polvo de color blanco (Metanol/agua)	268,0 (descomp.)	Dihidrocloruro
877	⁻ OCH ₃	-H	⁻ NHCOCH ₂ NHCOCH ₃	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)/ éter isopropílico)	167,5-170,5	-
878	⁻ OCH ₃	-H	⁻ NHCOCH ₂ NHCO ₂ CH ₃	-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)/ Isopropilo éter)	157,0-159,5	-
879	-CH ₃	-H	-NHCOCH ₂ NHCHO	-H	⁻ OCH ₃	Polvo de color blanco (Diclorometano/agua)	235,5 (descomp.)	Hidrocloruro

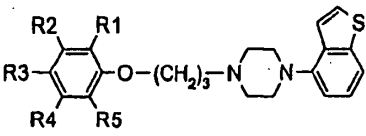
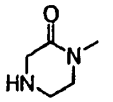
[Tabla 106]

								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	sal
880	-CH ₃	-H	⁻ CONHCH ₃	-H	-O(CH ₂) ₂ N(CH ₃) ₂	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	235,5-240,5 (descomp.)	Dihidrocloruro
881	-CH ₃	-H	⁻ CONHCH ₃	-H	-O(CH ₂) ₂ OH ₃ ,	Polvo de color blanco (alcohol isopropílico/éter isopropílico)	194,0-197,5	Hidrocloruro
882	-CH ₃	-H	⁻ CONHCH ₃	-H	-OCH ₂ CF ₃	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)/ (Isopropilo éter)	156,0-157,5	Hidrocloruro

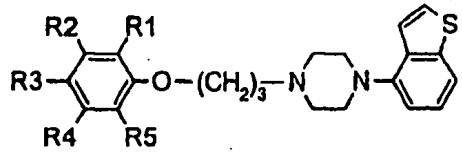
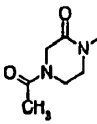
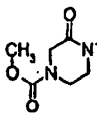
[Tabla 107]

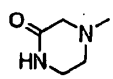
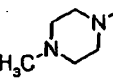
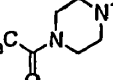
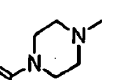
								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
883	-H	-H		-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/ éter isopropílico)	114,0-115,5	-
884	⁻ OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	245,0 (descomp.)	Hidrocloruro
885	-H	-H		-H	-H	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	217,0-224,5 (descomp.)	Hidrocloruro
886	⁻ OCH ₃	-H		-H	-CHO	Polvo de color blanco (Etanol)	218,0 (descomp.)	Hidrocloruro
887	⁻ CCH ₃	-H		-H	-CH ₂ OH	Polvo de color blanco (Etanol)	224,0-226,5 (descomp.)	Hidrocloruro
888	⁻ OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ OCH ₃	Polvo de color blanco (metanol)	224,0-226,0	Hidrocloruro

[Tabla 108]

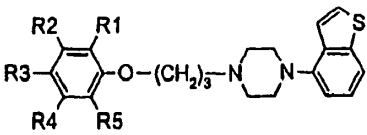
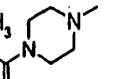
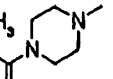
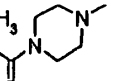
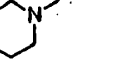
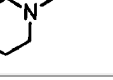
								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
889	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ (CH ₃) ₂	Polvo de color blanco (Etanol/éter)	151,0-152,0	Difumarato
890	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Polvo de color amarillo claro (Etanol/agua)	264,0 (descomp.)	Hidrocloruro
891	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/Éter isopropílico)	143,5-151,0	-
892	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	246,5-249,0 (descomp.)	Hidrocloruro
893	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	234,0-240,0 (descomp.)	Dihidrocloruro
894	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Metanol/agua)	288,5 (descomp.)	Dihidrocloruro

[Tabla 109]

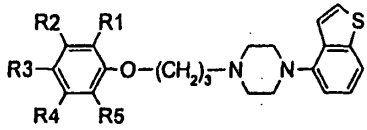
								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
895	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Etanol/agua)	218,0-221,5	Hidrocloruro
896	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	223,0-228,0	Hidrocloruro

897	$^-\text{OCH}_3$	-H		-H	$-\text{CH}_3$	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	139,5-142,	-
898	$^-\text{OCH}_3$	-H		-H	$-\text{CH}_3$	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	270, 0 (descomp.)	Trihidrocloruro
899	$^-\text{OCH}_3$	-H		-H	$-\text{CH}_3$	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	257,0-261,0 (descomp.)	0 Hidrocloruro
900	$^-\text{OCH}_3$	-H		-H	$^-\text{CH}_2\text{OH}$	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	217,5-221,0	0 Hidrocloruro

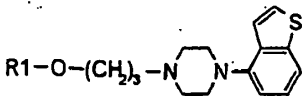
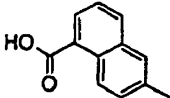
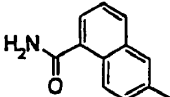
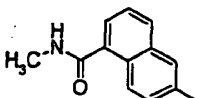
[Tabla 110]

								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
901	$^-\text{OCH}_3$	-H		-H	$-\text{CH}_3$	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	250, 0 (descomp.)	Hidrocloruro
902	$^-\text{OCH}_3$	-H		-H	$-\text{CHO}$	Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	225, 0 (descomp.)	Hidrocloruro
903	$^-\text{OCH}_3$	-H		-H	$^-\text{CH}_2\text{OH}$	Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	128,0-130,0	-
904	$^-\text{OCH}_3$	-H		-H	$-\text{CH}_3$	Polvo de color blanco. (Acetato de etilo)	246,0 (descomp.)	Hidrocloruro
905	$^-\text{OCH}_3$	-H		-H	$-\text{CH}_3$	Polvo de color blanco (Acetato de etilo).	248,0-251,0 (descomp.)	Dihidrocloruro

[Tabla 111]

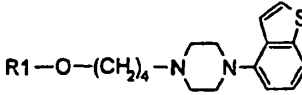
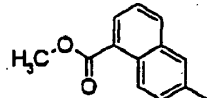
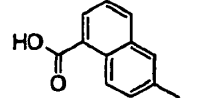
							
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	RMN	Sal
906	-NH ₂	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	-H	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,23 (3H, t, J = 7, 4 Hz), 2,00-2,15 (2H, m), 2,67 (2H, t, J = 7, 3 Hz), 2,75 (4H, s ancho), 3,21 (4H, s ancho), 3,40-3,50 (2H, m), 3,50-4,30 (2H, ancho), 4,13 (2H, t, J = 6,5 Hz), 6,99 (1H, s ancho), 6,80 (1H, d, J = 8,4 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,8 Hz), 7,08 (1H, dd, J = 2,1, 8,3 Hz), 1,19 (1H, d, J = 2,1 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz).	-

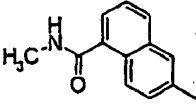
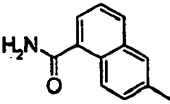
[Tabla 112]

				
Ejemplo	R1	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
907		Polvo de color blanco (agua)	203,0-210,0	-
908		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	167,0-169,0	-
909		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	138, 0-140,0	-

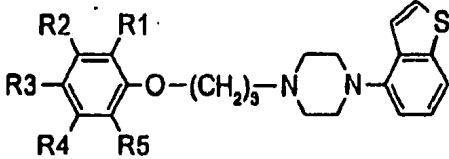
5

[Tabla 113]

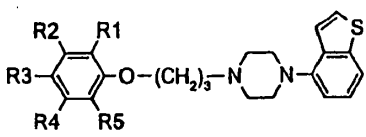
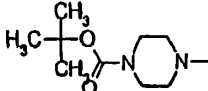
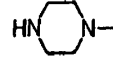
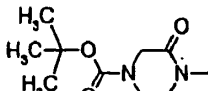
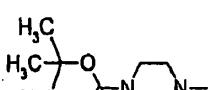
				
Ejemplo	R1	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
910		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	96,5-97,0	-
911		Polvo de color blanco, (Ácido acético)	254,0 (descomp.)	Dihidrocloreuro

912		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	124,0-126,5	-
913		Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	181,5-183,5	-

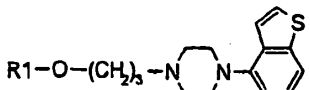
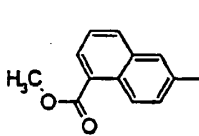
[Tabla 114]

						
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	RMN
914	-OCH ₃	-H	-NHCO ₂ C(CH ₃)	-H	-CH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,51(9H, s), 1,95-2,10 (2H, m), 2,24(3H, s), 2,66-2,81(6H, m), 3,14-3,3 (2H, m), 3,84(3H, s), 3,95(2H, t, J = 6,3 Hz), 6,36(1H, ancho), 6,60(1H, d, J = 2,5 Hz), 6,87-6,92(1H, m), 7,01 (1H, d, J = 2,0 Hz), 7,24-7,31(1H, m), 7,37-7,44(2H, m), 7,55(1H, d, J = 8,0 Hz)
915	-OCH ₃	-H	-I	-H	-CH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,92-2,10 (2H, m), 2,23(3H, s), 2,57-2,86(6H, m), 3,11-3,31(4H, m), 3,82(3H, s), 3,98(2H, t, J = 6,4 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,03(1H, d, J = 2,0 Hz), 1,13(1H, d, J = 1,6 Hz), 7,22-7,34(1H m), 7,40 (1H, dd, J = 5,5 Hz, 9,3 Hz), 7,55(1H, d, J = 6,0 Hz).
916	-OCH ₃	-H	-NHCONH(CH ₂)Cl	-H	-CH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,94-2,13 (2H, m), 2,26(3H, s), 2,60-2,90(6H, m), 3,12-3,33(4H, m), 3,49-3,76(4H, m), 3,83(3H,s), 3,97(2H, t, J = 6,4 Hz), 5,22(1H, ancho), 6,25(1H, ancho), 6,59(1H, d, J = 2,3 Hz), 6,88(1H, d, J = 2,3 Hz), 8,91(1H, d, J = 7,4 Hz), 7,21-7,33(1H, m), 7,41 (1H, dd, J = 5,6 Hz, 7,6 Hz), 7,56(1H, d, 4=8,0 Hz).
917	-OCH ₃	-H	-NH(CH ₂) ₂ NH ₂	-H	-CH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,91-2,08 (2H, m), 2,22 (3H, s), 2,62-2,81(6H, m), 2,95 (2H, t, J = 5, 7 Hz), 3,08-3,27 (6H, m), 3,80(3H, s), 3,91(2H, t, J = 6,4 Hz), 6,05(1H, d, J = 2,6 Hz), 6,10(1H, d, J = 2,6 Hz); 6,80(1H, d, J = 7,5 Hz) , 7,20-7,32(1H, m), 7,34-7,46 (2H, m), 7,55(1H, d, J = 8,0 Hz).
918	-OCH ₃	-H	-NH(CH ₂)NHCOCH ₂ Cl	-H	-CH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,91-2,11 (2H, m), 2,23(3H, s), 2,60-2,84 (6H, m), 3,11-3,26(4H, m), 3,26-3,36 (2H, m), 3,46-3,63 (2H, m), 3,81(3H, s), 3,91(2H, t, J = 6,4 Hz), 4,06(2H, s), 6,04(1H, d, J = 2,5 Hz), 6,10(1H, d, J = 2,5 Hz), 6,78-6,96 (2H, m), 7,21-7,33 (1H, m), 7,35-7,47 (2H, m), 7,55(1H, d, J = 8,1 Hz).

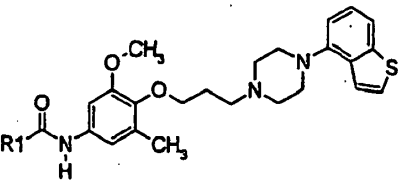
[Tabla 115]

						
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	RMN
919	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ Cl	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,00-2,17 (2H, m), 2,63-2,83 (6H, m), 3,14-3,28 (2H, m), 3,89 (3H, s), 3,98-4,17 (4H, m), 4,40-4,54 (2H, m), 4,69 (2H, m), 6,77 (1H, d, J = 2,5 Hz), 6,91 (1H, d, J = 2,5 Hz), 7,21-7,32 (1H, m), 7,35-7,46 (2H, m), 7,66 (1H, d, J = 9,3 Hz)
920	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,48 (9H, s), 1,93-2,12 (2H, m), 2,26 (3H, a), 2,60-2,86 (6H, m), 2,95-3,12 (4H, m), 3,14-3,31 (4H, m), 3,60-3,67 (4H, m), 3,83 (3H, s), 3,84 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,33 (1H, d, J = 2,5 Hz), 6,38 (1H, d, J = 2,6 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,19-7,33 (1H, m), 7,41 (2H, dd, J = 5,5 Hz, 9,3 Hz), 7,65 (1H, d, J = 8,0 Hz).
921	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,92-2,09 (2H, m), 2,26 (3H, s), 2,61-2,81 (6H, m), 2,98-3,12 (8H, m), 3,14-3,25 (4H, m), 3,83 (3H, s), 3,94 (2H, t, J = 6,4 Hz), 6,33 (1H, d, J = 2,5 Hz), 6,38 (1H, d, J = 2,5 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,0 Hz), 7,20-7,93 (1H, m), 7,34-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz).
922	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm : 1,50 (9H, s), 1,95-2,11 (2H, m), 2,27 (3H, s), 2,59-2,82 (6H, m), 3,12-3,27 (4H, m), 3,63-3,81 (4H, m), 3,83 (3H, s), 4,01 (2H, t, J = 6,4 Hz), 4,24 (2H, s), 6,61-8,71 (2H, m), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,21-7,33 (1H, m), 7,41 (2H, dd, J = 5,6 Hz, 9,8 Hz), 7,65 (1H, d, J = 8,1 Hz).
923	-OCH ₃	-H		-H	-CHO	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,49 (9H, s), 1,96-2,12 (2H, m), 2,60-2,82 (6H, m), 3,04-3,16 (4H, m), 3,16-3,28 (4H, m), 3,52-3,64 (4H, m), 3,89 (3H, s), 4,14 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,78 (1H, d, J = 2,8 Hz), 6,86-6,96 (2H, m), 7,20-7,33 (1H, m), 7,35-7,46 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz), 10,44 (1H, s).
924	-OCH ₃	-H		-H	-CHO	RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,97-2,13 (2H, m), 2,59-2,83 (6H, m), 2,96-3,09 (4H, m), 3,09-3,17 (4H, m), 3,17-3,28 (4H, m), 3,89 (3H, s), 4,13 (2H, t, J = 6,5 Hz), 6,79 (1H, d, J = 2,7 Hz), 6,86-6,96 (2H, m), 7,20-7,34 (1H, m), 7,36-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,1 Hz), 10,44 (1H, s).

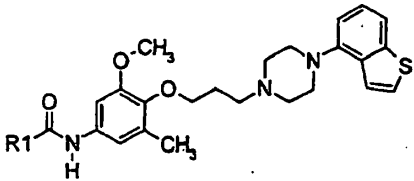
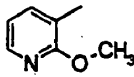
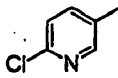
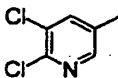
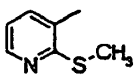
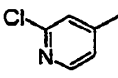
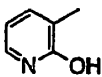
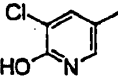
[Tabla 116]

		
Ejemplo	R1	RMN
925		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,01-2,20 (2H, m), 2,62-2,87 (6H, m), 3,10-3,30 (4H, m), 3,99 (3H, s), 4,20 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,91 (1H, dd, J = 0,7 Hz, 7,6 Hz), 7,20 (1H, d, J = 2,6 Hz), 7,22-7,34 (2H, m), 7,35-7,50 (3H, m), 7,55 (1H, d, J = 8, Hz), 7,90 (1H, d, J = 8,1 Hz), 8,03 (1H, dd, J = 1,2 Hz, 7,3 Hz), 8,83 (1H, d, J = 9,4 Hz).

[Tabla 117]

		
Ejemplo	R1	MS(M+1)
926	-2-PIRIDILO	517
927	-3-PIRIDILO	517
928	-4-PIRIDILO	517
929	-2-FURILO	506
930	-2-TIENILO	522
931	-3-FURILO	505
932	-3-TIENILO	522
933	-CH ₃	454
934	-C ₂ H ₅	468
935	-C ₃ H ₇	482
936	-CH(CH ₃) ₂	482
937	-ciclo-C ₃ H ₅	480
938	-ciclo-C ₅ H ₉	508
939	-ciclo-C ₆ H ₁₁	522
940	-CH ₂ -ciclo-C ₃ H ₃	494
941	-CH ₂ -ciclo-C ₆ H ₁₁	536
942	-CH ₂ OCH ₃	484
943	-CH ₂ N(CH ₃) ₂	497
944	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	525
945	<CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	539
946	-CH ₂ NHCHO	497
947	-CH ₂ N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂	557
948	-CH ₂ N(CH ₃)CO ₂ C(CH ₃) ₃	583
949	-(CH ₂) ₃ NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	597
950	-CH ₂ NHCH ₃	483
951	-(CH ₂) ₃ NH ₂	497
952	-CH ₂ NHCOCH ₃	511

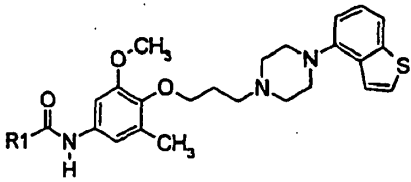
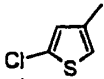
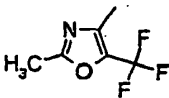
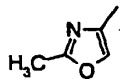
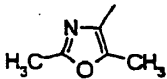
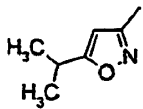
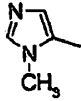
[Tabla 118]

		
Ejemplo	R1	MS(M+1)
953		547
954		551
955		585
956		563
957		551
958		533
959		567
960		551
961		505

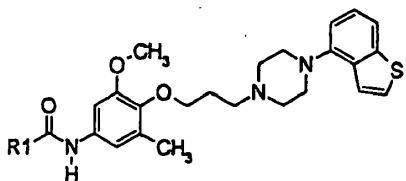
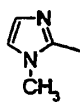
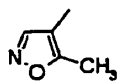
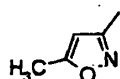
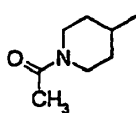
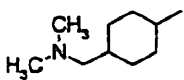
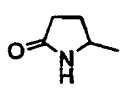
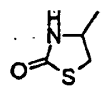
[Tabla 119]

Ejemplo	R1	MS(M+1)
962		556
963		551
964		519
965		535
966		518
967		532
968		523
969		534
970		590

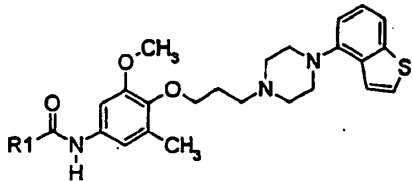
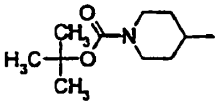
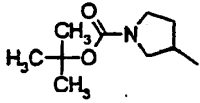
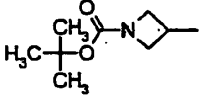
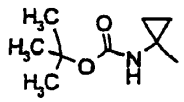
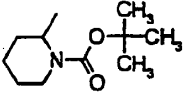
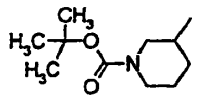
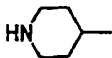
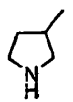
[Tabla 120]

		
Ejemplo	R1	MS(M+1)
971		556
972		589
973		521
974		523
975		535
976		549
977		520
978		520

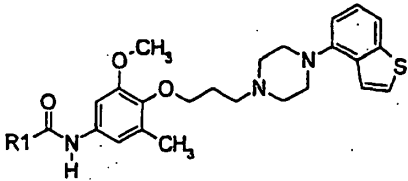
[Tabla 121]

		
Ejemplo	R1	MS(M+1)
979		520
980		521
981		521
982		565
983		579
984		523
985		541
986		510
987		524

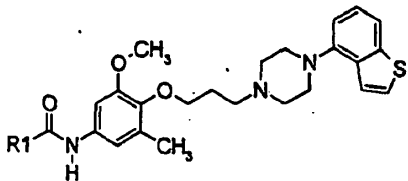
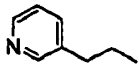
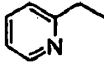
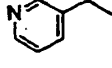
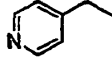
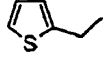
[Tabla 122]

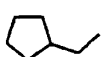
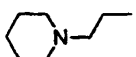
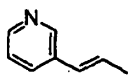
		
Ejemplo	R1	MS(M+1)
988		623
989		609
990		595
991		595
992		623
993		623
994		523
995		509
996		495

[Tabla 123]

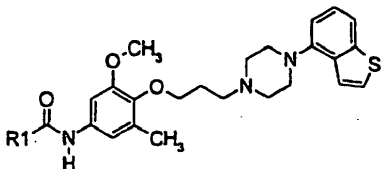
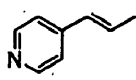
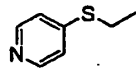
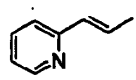
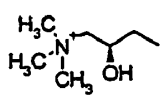
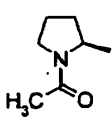
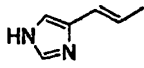
		
Ejemplo	R1	MS(M+1)
997		495
998		523
999		523

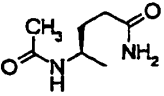
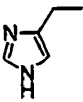
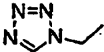
[Tabla 124]

		
Ejemplo	R1	MS(M+1)
1000		545
1001		531
1002		531
1003		531
1004		536

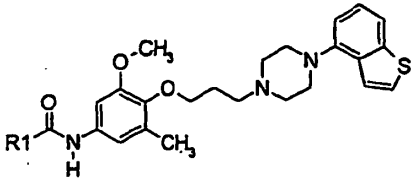
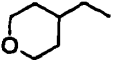
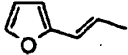
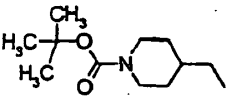
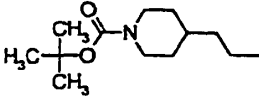
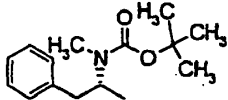
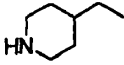
1005		536
1006		522
1007		551
1008		543

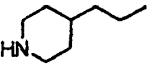
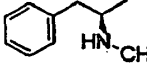
[Tabla 125]

		
Ejemplos	R1	MS(M+1)
1009		543
1010		563
1011		543
1012		556
1013		551
1014		532

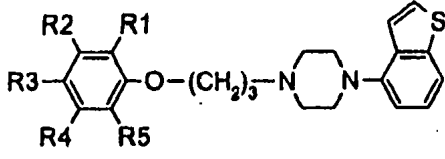
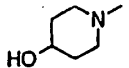
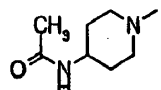
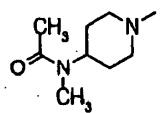
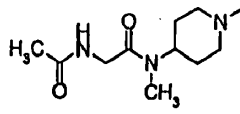
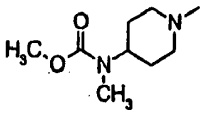
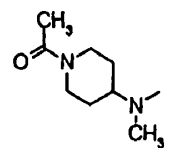
1015		582
1016		520
1017		522

[Tabla 126]

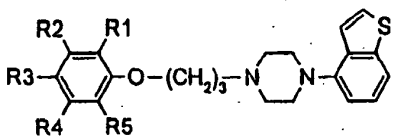
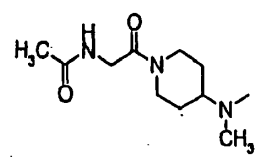
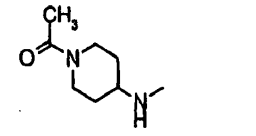
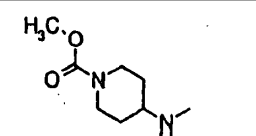
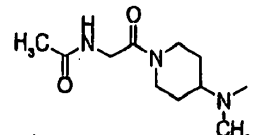
		
Ejemplo	R1	MS(M+1)
1018		538
1019		532
1020		637
1021		651
1022		673
1023		537

1024		551
1025		573

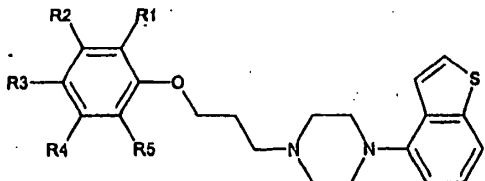
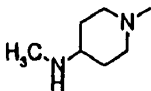
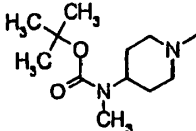
[Tabla 127]

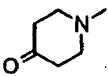
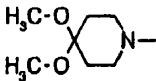
								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
1026	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	230,0 (descomp.)	Hidrocloruro
1027	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃			
1028	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	235,0 (descomp.)	Hidrocloruro
1029	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	227,0 (descomp.)	Hidrocloruro
1030	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	240,0 (descomp.)	Hidrocloruro
1031	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	211,0-213,5	Hidrocloruro

[Tabla 128]

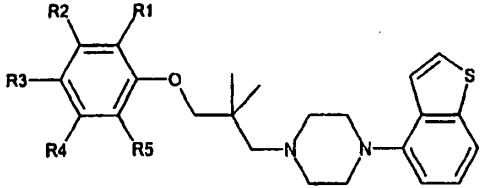
								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
1032	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	207,5-210,0	Hidrocloruro
1033	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	247,0 (descomp.)	-
1034	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-OC ₃ H ₇	Polvo de color blanco (Etanol)	178,5-179,5	Hidrocloruro
1035	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃			Hidrocloruro
1036	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	248,5-257,5	Hidrocloruro

[Tabla 129]

[Págs. 129-130]							
							
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	RMN	Sal
1037	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	RMN ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 1,38-1,85(4H, m), 1,88-2,11 (3H, m), 2,25(3H, s), 2,47(3H, s), 2,60-2,82(8H, m), 3,12-3,29(4H, m), 3,47-3,63(2H, m), 3,82(3H, s), 3,93(2H, t, J = 6,4 Hz), 8,34(1H, d, J = 2,7 Hz), 6,40(1H, d, J = 2,7 Hz), 8,80(1H, d, J = 7,1 Hz), 7,21 - 7,34(1H, m), 7,40 (2H, dd, J = 5,5 Hz, 9,9 Hz), 7,55(1H, d, J = 8,0 Hz).	-
1038	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	RMN ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 1,48(6H, s), 1,67-1,92(4H, m), 1,95-2,11 (2H, m), 2,25(3H, s), 2,81-2,87(12H, m), 3,11-3,28(4H, m), 3,54-3,70(2H, m), 3,83(3H, s), 3,94(2H, t, J = 8,3 Hz), 8,34(1H, d, J = 2,8 Hz), 6,39(1H, d, J = 2,6 Hz), 6,90(1H, d, J = 6,9 Hz), 7,17-7,34(1H, m), 7,35-7,47 (2H, m), 7,55(1H, d, J = 8,0 Hz).	-

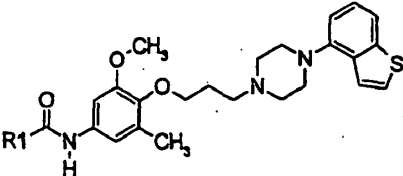
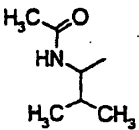
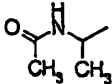
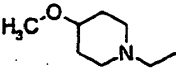
1039	CH_3	-H		-H	OCH_3	RMN H^1 (CDCl_3) δ ppm: 1,96-2,11 (2H, m), 2,27 (3H, s), 2,57 (4H, t, J = 6,0 Hz), 2,84-2,84 (6H, m), 3,13-3,27 (14H, m), 3,51 (4H, t, J = 6,0 Hz), 3,84 (3H, s), 3,96 (2H, t, J = 6,4 Hz), 6,38 (1H, d, J = 2,7 Hz), 8,20 (1H, d, J = 2,7 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,21-7,32 (1H, m), 7,40 (2H, dd, J = 5,5 Hz, 10,0 Hz), 7,55 (1H, d, J = 8,1 Hz).	-
1040	CH_3	-H		-H	OCH_3	RMN H^1 (CDCl_3) δ ppm: 1,83-1,95 (4H, m), 1,95-2,10 (2H, m), 2,25 (3H, s), 2,81-2,81 (6H, m), 3,07-3,28 (14H, m), 3,82 (3H, s), 3,93 (2H, t, J = 6,5 Hz), 6,30-6,43 (2H, m), 6,90 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,29-7,34 (1H, m), 7,41 (2H, dd, J = 6,0 Hz, 10,0 Hz), 7,55 (1H, d, J = 7,9 Hz).	-

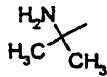
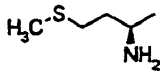
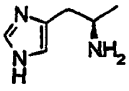
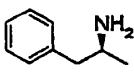
[Tabla 130]

								
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
1041	OCH_3	-H	-CONH ₂	-H	CH_3	Polvo de color blanco (Etanol)	189,0-102,6	Hidrocloreuro
1042	OCH_3	-H	-CONHCH ₃	-H	CH_3	Polvo de color blanco (Isopropilo alcohol/agua)	165,5-167,0	-

5

[Tabla 131]

		
Ejemplo	R1	MS(M+1)
1043		553
1044		525
1045		567
1046		499

1047		497
1048		543
1049		549
1050		559

Ejemplo 1051**Síntesis de 3-amino-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-N-etil-benzamida**

Se añadió paladio sobre carbono al 5% (0,8 g) a una disolución etanólica (30 ml) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-N-etil-3-nitrobenzamida (1,0 g, 2,1 mmoles) y la mezcla se sometió a la reducción catalítica a temperatura ambiente a presión normal. El catalizador se eliminó mediante filtración y el producto filtrado se concentró a presión reducida. Se añadió agua al residuo y la disolución se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano : metanol = 30:1 → 20:1). El producto purificado se concentró a presión reducida para obtener 3-amino-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-N-etil-benzamida (0,78 g, rendimiento 83%) en forma de un sólido amorfo de color amarillo.

RMN ¹H (CDCl₃) δ ppm: 1,23 (3H, t, J = 7,4 Hz), 2,00-2,15 (2H, m), 2,67 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,75 (4H, s ancho), 3,21 (4H, s ancho), 3,40-3,50 (2H, m), 3,50-4,30 (2H, ancho), 4,13 (2H, t, J = 6,5 Hz), 5,99 (1H, s ancho), 6,80 (1H, d, J = 8,4 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,08 (1H, dd, J = 2,1, 8,3 Hz), 7,19 (1H, d, J = 2,1 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz).

Ejemplo 1052 (Referencia)**Síntesis de hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(1-acetilpiperidin-4-iloxi)propil]piperazina**

Se añadió trietilamina (0,28 ml, 2,0 mmoles) a una disolución en diclorometano (15 ml) de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(piperidin-4-iloxi)-propil]-piperazina (0,45 g, 1,25 mmoles) y la mezcla se enfrió en un baño de hielo. A esto, se le añadió cloruro de acetilo (0,1 ml, 1,4 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con diclorometano. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano : metanol = 30:1). El producto purificado se concentró a presión reducida. Al residuo, se le añadió una disolución 0,5 N de hidrocloreto-metanol (3 ml). Los cristales producidos se obtuvieron mediante filtración y se secaron para obtener hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(1-acetilpiperidin-4-iloxi)propil]piperazina en forma de polvo de color blanco (0,36 g, rendimiento 66%).

Punto de fusión: 208-210°C

Ejemplo 1053 (Referencia)**Síntesis de Hidrocloreto de 1-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]pirrolidina-2,5-diona**

Se añadieron PS-trifenilfosfina (3 mmoles/g, 1,80 g), azodicarboxilato de di-terc-butilo (1,27 g, 5,4 mmoles) y N-hidroxisuccinimida (510 mg, 4,3 mmoles) a una disolución en THF (50 ml) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propanol (1,00 g, 3,6 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas. La resina se eliminó mediante filtración y el producto filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 1:2). El producto purificado se concentró a presión reducida para obtener un sólido amorfo de color blanco (762 mg, rendimiento 47%). Se disolvieron 157 mg del sólido amorfo de color blanco en etanol. A la disolución, se le añadió una disolución 1N de ácido clorhídrico-etanol (0,42 ml) y se añadió éter adicionalmente. La disolución se dejó estar en un refrigerador. Los cristales producidos se filtraron y se secaron para obtener hidrocloreto de 1-[3-(4-Benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-

il)propoxi]-pirrolidino-2,5-diona (158 mg) en forma de polvo de color blanco.
Punto de fusión: 255,0-257,0°C

Ejemplo 1054

Síntesis de amiduro de ácido 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]naftalen-1-carboxílico

Se añadieron trietilamina (0,24 ml, 1,7 mmoles) y cloroformiato de isobutilo (0,19 ml, 1,4 mmoles) a una disolución en acetonitrilo (10 ml) de ácido 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)-propoxi]-naftalen-1-carboxílico (0,52 g; 1,2 mmoles) enfriando con hielo y la mezcla se agitó durante 20 minutos. A la disolución de reacción, se le añadió agua amoniacal al 28% (0,5 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 20 minutos. A la disolución de reacción, se le añadió acetato de etilo y la disolución se lavó con agua. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 2:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se recrystalizó en una mezcla disolvente de acetato de etilo-éter diisopropílico para obtener amiduro de ácido 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-naftalen-1-carboxílico (0,27 g, rendimiento 53%) en forma de polvo de color blanco.
Punto de fusión 167,0-169,0°C

Ejemplo 1055 (Referencia)

Síntesis de metilamiduro de ácido 1-alil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1H-pirazol-3-carboxílico

Se añadió una disolución metanólica de metilamina al 40% (5 ml) a una disolución metanólica (5 ml) de éster etílico de ácido 1-alil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1H-pirazol-3-carboxílico (0,5 g, 1,1 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 días. La disolución se concentró a presión reducida y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 5:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se recrystalizó en una mezcla disolvente de acetato de etilo-éter diisopropílico para obtener metilamiduro de ácido 1-alil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1H-pirazol-3-carboxílico (0,32 g, rendimiento 67%) en forma de polvo de color blanco.
Punto de fusión 138,5-140,5°C

Ejemplo 1056 (Referencia)

Síntesis de amiduro de ácido 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-ciclohexanocarboxílico

Se añadieron agua amoniacal (28%, 0,5 ml), hidrocloreto de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (WSC) (0,36 g, 1,9 mmoles) y 4-dimetilaminopiridina (DMAP) (0,05 g, 0,4 mmoles) a una disolución en diclorometano (10 ml) de ácido 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-ciclohexanocarboxílico (0,5 g, 1,2 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 19 horas. A la disolución de reacción, se le añadió diclorometano y la mezcla se lavó con agua. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 3:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se recrystalizó en una mezcla disolvente de acetato de etilo-éter diisopropílico para obtener amiduro de ácido 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-ciclohexanocarboxílico (0,1 g, rendimiento 22%), en forma de polvo de color blanco.
Punto de fusión 107,5-108,5°C

Ejemplo 1057

Síntesis de hidrocloreto de {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metil-fenil}amiduro de ácido etanosulfónico

Una disolución en diclorometano (4 ml) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenilamina (0,2 g, 0,49 mmoles) se enfrió sobre hielo. A esto, se le añadieron N-etildiisopropilamina (0,15 ml, 0,87 mmoles) y cloruro de etanosulfonilo (0,07 ml, 0,73 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una hora. Nuevamente, se añadieron N-etildiisopropilamina (0,15 ml, 0,87 mmoles) y cloruro de etanosulfonilo (0,07 ml, 0,73 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 19 horas. A esto, se añadieron una disolución de hidróxido de sodio 6N (0,5 ml) y etanol (2 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Se añadió diclorometano a la disolución de reacción, que después se lavó con agua. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 2:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida. Se añadió al residuo una disolución de hidrocloreto

4N/acetato de etilo. Los cristales generados se filtraron y se secaron para obtener hidrocloreto de {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metil-fenil}amiduro de ácido etanosulfónico (222 mg, rendimiento 85%) en forma de polvo de color blanco.
Punto de fusión: 235,5-237,5°C

Ejemplo 1058 (Referencia)

Síntesis de éster metílico de ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-carbámico

Una disolución en diclorometano (2 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il-amina (0,17 g, 0,47 mmoles) se enfrió sobre hielo. A esto, se añadieron piridina (0,08 ml, 0,94 mmoles) y cloroformiato de metilo (0,04 ml, 0,52 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 17 horas. A la disolución de reacción, se añadió acetato de etilo y la mezcla de reacción se lavó con agua. La capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se combinaron, se secaron sobre sulfato de magnesio anhidro, y después de eso, se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 2:1 → 1:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se recristalizó en una mezcla disolvente de acetato de etilo-éter diisopropílico para obtener éster metílico de ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}carbámico (0,10 g, rendimiento 51%) en forma de polvo de color blanco.
Punto de fusión: 162,5-165,0°C.

Ejemplo 1059 (Referencia)

Síntesis de hidrocloreto de 3-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-1,1-dimetil-urea

Una disolución en diclorometano (5 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il-amina (0,27 g, 0,73 mmoles) se enfrió sobre hielo. A esto, se añadieron trietilamina (0,36 ml, 2,5 mmoles), cloruro de dimetilcarbamoilo (0,20 ml, 2,1 mmoles) y piridina (0,06 ml, 0,73 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. A la disolución de reacción, se le añadió agua y la disolución de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 3:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en acetato de etilo y a esto se añadió una disolución de hidrocloreto 4N/acetato de etilo. Los cristales producidos se filtraron y se secaron para obtener hidrocloreto de 3-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-1,1-dimetil-urea (0,10 g, rendimiento 30%), en forma de polvo de color amarillo claro.
Punto de fusión: 174,0-176,5°C

Ejemplo 1060 (Referencia)

Síntesis de hidrocloreto de 3-{5-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-1,1-dimetil-urea

Una disolución acuosa de dimetilamina (50%, 0,16 ml, 1,6 mmoles) se añadió a una disolución en DMF (3 ml) de éster fenílico de ácido 5-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il-carbámico (0,26 g, 0,52 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. Se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 7:3 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en acetato de etilo. Se añadió una disolución de ácido clorhídrico 1N/etanol y los cristales producidos se filtraron y se secaron para obtener hidrocloreto de 3-{5-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-1,1-dimetil-urea (95 mg, rendimiento 37%) en forma de polvo de color blanco.
Punto de fusión: 186,0-187,5°C

Ejemplo 1061 (Referencia)

Síntesis de N-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-acetamida

Se añadieron anhídrido acético (1 ml) y trietilamina (0,09 ml, 0,65 mmoles) a una disolución en diclorometano (4 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il-amina (0,20 g, 0,54 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 6 horas. Se añadió una disolución acuosa de carbonato de potasio a la disolución de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía

en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 2:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se recrystalizó en una mezcla disolvente de acetato de etilo-éter diisopropílico para obtener N-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}acetamida (0,19 g, rendimiento 89%) en forma de polvo de color blanco.

Punto de fusión: 137,0-139,0°C

Ejemplo 1062 (Referencia)

Síntesis de hidrocloreto de 3-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-hidroximetil-5-metoxifenil}oxazolidin-2-ona

En primer lugar, se añadió hidrocloreto de 2-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzaldehído (1,28 g, 2,4 mmoles) a una disolución acuosa de hidrocloreto de potasio. La mezcla se extrajo con diclorometano. La disolución extraída se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en THF (15 ml). A la disolución, se le añadió borohidruro de sodio (0,05 g, 1,2 mmoles) enfriando con hielo y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. A continuación, se añadió ácido clorhídrico al 10% a la mezcla enfriando con hielo para descomponer el reactivo presente en exceso. Después se añadió una disolución acuosa 6N de hidróxido de sodio a la disolución para convertirla en una disolución alcalina, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano : acetato de etilo = 3:7 → diclorometano : metanol = 100:3). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en etanol. A esto se añadió una disolución de ácido clorhídrico 1N/etanol. Los cristales producidos se recrystalizaron en etanol para obtener hidrocloreto de 3-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)-propoxi]-3-hidroximetil-5-metoxifenil}oxazolidin-2-ona (0,52 g, rendimiento 41%) en forma de polvo de color blanco.

Punto de fusión: 224,0-226,5°C (descomp.)

Ejemplo 1063

Síntesis de hidrocloreto de 1-acetil-4-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}piperazin

Se añadieron hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-bromo-2-metoxi-6-metilfenoxi)propil]piperazina (0,5 g, 0,98 mmoles), 1-acetilpiperazina (0,15 g, 1,2 mmoles), acetato de paladio (11 mg, 0,048 mmoles), 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo (BINAP) (63 mg, 0,098 mmoles) y t-butoxido de sodio (0,23 g, 2,3 mmoles) a tolueno (10 ml) y la mezcla se agitó en atmósfera de argón a 90°C durante 22 horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se filtró con cerite. La torta del filtro se lavó con acetato de etilo. El producto filtrado y el líquido de lavado se combinaron y después de eso se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano: acetato de etilo = 11:1 → 1:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en acetato de etilo. A esto se añadió una disolución ácido clorhídrico de 1N/etanol y los cristales producidos se filtraron y se secaron para obtener hidrocloreto de 1-acetil-4-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}-piperazina (75 mg, rendimiento 14%) en forma de polvo de color blanco.

Punto de fusión: 257,0-261,0 °C (descomp.)

Ejemplo 1064

Síntesis de dihidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-imidazol-1-il-2-metoxi-6-metil-fenoxi)-propil]-piperazina

Se añadieron 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-iodo-2-metoxi-6-metil-fenoxi)-propil]-piperazina (0,6 g, 0,69 mmoles), imidazol (0,07 g, 1,03 mmoles), yoduro de cobre (I) (13 mg, 0,069 mmoles), trans-N,N'-dimetil-1,2-ciclohexanodiamina (0,02 ml, 0,14 mmoles) y carbonato de cesio (0,47 g, 1,38 mmoles) a 1,4-dioxano (6 ml) y la mezcla se sometió a reflujo calentando en atmósfera de argón durante 50 horas. Después de enfriar la mezcla de reacción resultante a temperatura ambiente, se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano: acetato de etilo = 5:1 → 1:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en acetato de etilo. A esto se añadió una disolución de ácido clorhídrico 1N/etanol y los cristales producidos se filtraron y se secaron para obtener dihidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-imidazol-1-il-2-metoxi-6-metilfenoxi)propil]-piperazina (60 mg, rendimiento 17%) en forma de polvo de color amarillo claro.

Punto de fusión: 234,0-240,0°C (descomp.).

Ejemplo 1065

Síntesis de hidrocloreto de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3,N-dimetil-5-(2,2,2-trifluoroetoxi)benzamida

Se añadieron carbonato de cesio (0,34 g, 0,99 mmoles) y 1,1,1-trifluoro-2-yodoetano (0,05 ml, 0,47 mmoles) a una disolución en DMF (2 ml) de 4-[3-(4-Benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-hidroxi-5,N-dimetilbenzamida (188 mg, 0,39 mmoles), y la mezcla se agitó a 40°C durante 2 horas. A continuación, se añadió nuevamente 1,1,1-trifluoro-2-yodoetano (0,1 ml, 0,94 mmoles) y la mezcla se agitó a 40°C durante 5 horas. Después de enfriar la mezcla de reacción a temperatura ambiente, se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano: acetato de etilo = 3:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en alcohol isopropílico. Se añadió a esto una disolución de ácido clorhídrico 1N/etanol y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se recrystalizó en una mezcla disolvente de alcohol isopropílico/acetato de etilo para obtener hidrocloreto de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3,N-dimetil-5-(2,2,2-trifluoroetoxi)benzamida (88 mg, rendimiento 40%) en forma de polvo de color amarillo claro. Punto de fusión: 156,0-157,5°C

Ejemplo 1066 (Referencia)**Síntesis de hidrocloreto de 1-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-etanona**

Se añadió hidrocloreto de metoximetilamido de ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico (0,61 g, 1,3 mmoles) a una disolución acuosa de hidróxido de sodio y la mezcla disolvente se extrajo con diclorometano. La disolución extraída se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en THF (12 ml). La disolución se enfrió a -78°C y a esto se añadió una disolución de metil litio 1N-éter (1,2 ml) y la mezcla se agitó a la misma temperatura durante 2 horas. A la disolución de reacción, se le añadió una disolución acuosa de cloruro de amonio y la disolución se calentó a temperatura ambiente. Se añadió cloruro de potasio a la disolución, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano : acetato de etilo = 3:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en etanol. A esto se añadió una disolución de ácido clorhídrico 1N/etanol y los cristales producidos se recrystalizaron en etanol que contenía agua para obtener hidrocloreto de 1-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}etanona (0,22 g, rendimiento 40%) en forma de polvo de color blanco. Punto de fusión: 245,0°C (descomp.)

Ejemplo 1067 (Referencia)**Síntesis de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-hidroximetil-1-metil-1H-pirazol**

Una disolución en THF (8 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-(terc-butil-dimetilsilaniloximetil)-1-metil-1H-pirazol (0,75 g, 1,5 mmoles) se enfrió sobre hielo y a esto se añadió una disolución 1M en THF de fluoruro de tetrabutilamonio (1,7 ml). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. Se añadió acetato de etilo a la disolución de reacción, que se lavó con agua. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano : metanol = 1:0 → 30:1 → 15:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se recrystalizó en una mezcla disolvente de acetato de etilo y éter diisopropílico para obtener 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-hidroximetil-1-metil-1H-pirazol (0,46 g, rendimiento 79%) en forma de polvo de color blanco. Temperatura de fusión: 123,5-126,0°C

Ensayo Farmacológico 1**1) Análisis de unión al receptor D₂ de dopamina**

El análisis se realizó de acuerdo con el método de Kohler et al. (Kohler C, Hall H, Ogren SO y Gawell L, Specific in vitro and in vivo binding of 3H-racloprida. A potent substituted benzamida drug with high affinity for dopamine D-2 receptors in the rat brain. Biochem. Pharmacol., 1985; 34: 2251-2259).

Se decapitaron ratas macho Wistar, los cerebros se retiraron inmediatamente y se recogió el cuerpo estriado. Éste se homogeneizó en tampón tris(hidroximetil)-aminometano (Tris)-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4) de un volumen de 50 veces el peso del tejido utilizando un homogeneizador con una cuchilla giratoria de alta velocidad, y se centrifugó a 4°C, 48.000 × g durante 10 minutos. El precipitado obtenido se suspendió de nuevo en el tampón anteriormente descrito de un volumen de 50 veces el peso del tejido y después de incubar a 37°C durante 10 minutos, se

centrifugó en las condiciones anteriormente descritas. El precipitado obtenido se suspendió en tampón (Tris)-ácido clorhídrico 50 mM (conteniendo NaCl 120 mM, KCl 5 mM, CaCl_2 2 mM, MgCl_2 1 mM, pH 7,4) de un volumen de 25 veces el peso del tejido y se conservó congelando a -85°C hasta que se utilizó para el análisis de unión como espécimen de membrana.

El análisis de unión se realizó utilizando 40 μl del espécimen de membrana, 20 μl de racloprida- $[\text{H}^3]$ (concentración final 1 a 2 nM), 20 μl de un fármaco de ensayo y tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (conteniendo NaCl 120 mM, KCl 5 mM, CaCl_2 2 mM, MgCl_2 1 mM, pH 7,4) de manera que la cantidad total fue 200 μl (concentración final de dimetilsulfóxido 1%). La reacción se realizó a temperatura ambiente durante 1 hora y se terminó llevando a cabo la filtración mediante succión con una cosechadora celular sobre una placa de filtro de fibra de vidrio. La placa del filtro elaborada de fibra de vidrio se lavó con tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4), y después de secarla, se añadió un cóctel de centelleo líquido para microplacas y la radiactividad se midió con un contador de centelleo de microplacas. La radiactividad en presencia de (+)-hidrocloruro de butaclamol 10 μM se adoptó como la unión no específica.

El valor de Cl_{50} se calculó a partir de la reacción dependiente de la concentración utilizando un programa de análisis no lineal. El valor de K_i se calculó a partir del valor de Cl_{50} utilizando la fórmula de Cheng-Prusoff. Los resultados se muestran en la siguiente Tabla 132.

[Tabla 132]

Ensayo de unión al receptor D2 de Dopamina	
Compuesto de ensayo	K_i (nM)
Compuesto del Ejemplo 10	0,2
Compuesto del Ejemplo 13	0,3
Compuesto del Ejemplo 14	0,4
Compuesto del Ejemplo 16	0,6
Compuesto del Ejemplo 23	2,0
Compuesto del Ejemplo 35	0,4
Compuesto del Ejemplo 44	0,9
Compuesto del Ejemplo 45	1,0
Compuesto del Ejemplo 61	1,3
Compuesto del Ejemplo 65	1,2
Compuesto del Ejemplo 107	1,1
Compuesto del Ejemplo 116	0,4
Compuesto del Ejemplo 118	0,2
Compuesto del Ejemplo 127	0,3
Compuesto del Ejemplo 146	1,2
Compuesto del Ejemplo 156	0,3
Compuesto del Ejemplo 161	0,2
Compuesto del Ejemplo 176	0,2
Compuesto del Ejemplo 178	1,0
Compuesto del Ejemplo 179	0,3
Compuesto del Ejemplo 188	0,7
Compuesto del Ejemplo 189	0,8
Compuesto del Ejemplo 198	1,5
Compuesto del Ejemplo 215	1,9
Compuesto del Ejemplo 218	0,9
Compuesto del Ejemplo 220	1,6

Ensayo de unión al receptor D2 de Dopamina	
Compuesto de ensayo	Ki (nM)
Compuesto del Ejemplo 229	0,2
Compuesto del Ejemplo 233	0,2
Compuesto del Ejemplo 234	0,2
Compuesto del Ejemplo 238	2,0
Compuesto del Ejemplo 243	0,4
Compuesto del Ejemplo 257	0,5
Compuesto del Ejemplo 269	3,8
Compuesto del Ejemplo 328	0,9
Compuesto del Ejemplo 337	0,4
Compuesto del Ejemplo 416	0,6
Compuesto del Ejemplo 521	1,2
Compuesto del Ejemplo 577	1,0
Compuesto del Ejemplo 673	0,6
Compuesto del Ejemplo 875	0,4
Compuesto del Ejemplo 876	0,1
Compuesto del Ejemplo 877	0,1
Compuesto del Ejemplo 887	0,1
Compuesto del Ejemplo 892	1,2
Compuesto del Ejemplo 895	0,4
Compuesto del Ejemplo 896	0,6
Compuesto del Ejemplo 899	0,3
Compuesto del Ejemplo 900	0,1
Compuesto del Ejemplo 902	1,0
Compuesto del Ejemplo 903	0,3
Compuesto del Ejemplo 905	1,0

2) Análisis de unión al receptor 5-HT_{2A} de serotonina

5 El análisis se realizó de acuerdo con el método de Leysen JE et al. (Leysen JE, Niemegeers CJE, Van Nueten JM y Laduron PM. [3H] Ketanserin (R 41 468), a selective 3H-ligand for serotonin 2 receptor binding sites. Mol. Pharmacol., 1982, 21: 301-314).

10 Se decapitaron ratas Wistar macho, el cerebro se retiró inmediatamente y se recogió el córtex frontal. Éste se homogeneizó en sacarosa 0,25 M de un volumen 10 veces el peso del tejido utilizando un homogeneizador de vidrio y Teflón, y se centrifugó a 4°C, 1.000 × g durante 10 minutos. El sobrenadante obtenido se transfirió a otro tubo de centrifuga y se suspendió en sacarosa 0,25 M de un volumen 5 veces el peso del tejido y el precipitado se centrifugó en las condiciones anteriormente descritas. El sobrenadante obtenido se combinó con el sobrenadante obtenido antes y se ajustó a un volumen de 40 veces el peso del tejido con tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4), y se centrifugó a 4°C, 35.000 × g durante 10 minutos. El precipitado obtenido se suspendió de nuevo en el tampón descrito anteriormente de un volumen de 40 veces el peso del tejido y se centrifugó en las condiciones anteriormente descritas. El precipitado obtenido se suspendió en el tampón descrito anteriormente de un volumen de 20 veces el peso del tejido y se conservó congelando a -85°C hasta que se utilizó para el análisis de unión como espécimen de membrana.

20 El análisis de unión se realizó utilizando 40 µl del espécimen de membrana, 20 µl de Cetanserina-[H³] (concentración final 1 a 3 nM), 20 µl de un fármaco de ensayo y tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4) de manera que la

cantidad final fue 200 μ l (concentración final en dimetilsulfóxido al 1%). La reacción se realizó a 37°C durante 20 minutos y se terminó llevando a cabo la filtración mediante succión con una cosechadora celular sobre una placa de filtro de fibra de vidrio.

- 5 La placa del filtro elaborada de fibra de vidrio se lavó con tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4), y después de secarla, se añadió un cóctel de centelleo líquido para microplacas y la radiactividad se midió con un contador de centelleo de microplacas. La radioactividad en presencia de espiperona 10 μ M se adoptó como la unión no específica.
- 10 El valor de CI_{50} se calculó a partir de una reacción dependiente de la concentración utilizando un programa de análisis no lineal. El valor de K_i se calculó a partir del valor de CI_{50} utilizando la fórmula de Cheng-Prusoff. Los resultados se muestran en la siguiente Tabla 133.

[Tabla 133]

Ensayo de unión al receptor 5-HT _{2A} de serotonina	
Compuesto de ensayo	K_i (nM)
Compuesto del Ejemplo 10	4,4
Compuesto del Ejemplo 13	2,4
Compuesto del Ejemplo 14	5,9
Compuesto del Ejemplo 16	3,4
Compuesto del Ejemplo 23	3,9
Compuesto del Ejemplo 35	0,6
Compuesto del Ejemplo 44	2,6
Compuesto del Ejemplo 45	3,3
Compuesto del Ejemplo 61	2,0
Compuesto del Ejemplo 65	0,6
Compuesto del Ejemplo 107	2,7
Compuesto del Ejemplo 116	0,7
Compuesto del Ejemplo 118	0,5
Compuesto del Ejemplo 127	0,3
Compuesto del Ejemplo 146	0,6
Compuesto del Ejemplo 156	0,6
Compuesto del Ejemplo 161	0,8
Compuesto del Ejemplo 176	0,4
Compuesto del Ejemplo 178	2,5
Compuesto del Ejemplo 182	0,7
Compuesto del Ejemplo 188	1,1
Compuesto del Ejemplo 189	0,8
Compuesto del Ejemplo 198	0,7
Compuesto del Ejemplo 215	4,8
Compuesto del Ejemplo 218	0,5
Compuesto del Ejemplo 220	1,9
Compuesto del Ejemplo 229	0,6
Compuesto del Ejemplo 233	1,1
Compuesto del Ejemplo 234	1,1

Ensayo de unión al receptor 5-HT _{2A} de serotonina	
Compuesto de ensayo	Ki (nM)
Compuesto del Ejemplo 238	1,1
Compuesto del Ejemplo 243	0,7
Compuesto del Ejemplo 257	0,6
Compuesto del Ejemplo 269	4,7
Compuesto del Ejemplo 328	1,2
Compuesto del Ejemplo 337	1,7
Compuesto del Ejemplo 416	0,7
Compuesto del Ejemplo 521	0,6
Compuesto del Ejemplo 577	0,9
Compuesto del Ejemplo 673	1,4
Compuesto del Ejemplo 875	3,8
Compuesto del Ejemplo 876	1,2
Compuesto del Ejemplo 877	1,2
Compuesto del Ejemplo 887	1,3
Compuesto del Ejemplo 892	12,4
Compuesto del Ejemplo 895	2,8
Compuesto del Ejemplo 896	3,4
Compuesto del Ejemplo 899	1,5
Compuesto del Ejemplo 900	1,4
Compuesto del Ejemplo 902	5,8
Compuesto del Ejemplo 903	2,6
Compuesto del Ejemplo 905	13,9

3) Análisis de unión al receptor $\alpha 1$ de adrenalina

5 El análisis se realizó de acuerdo con el método de Groß G et al. (Groß G, Hanft G y Kolassa N. Urapidil and some analogues with hypotensive properties show high affinities for 5-hydroxytryptamine (5-HT) binding sites of the 5-HT_{1A} subtype and for $\alpha 1$ -adrenoceptor binding sites. Naunin-Schmiedeberg's Arch Pharmacol., 1987, 336: 597-601).

10 Se decapitaron ratas Wistar macho, el cerebro se retiró inmediatamente y se recogió el córtex cerebral. Éste se homogeneizó en tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (NaCl 100 mM, que contenía dihidrogeno-etilendiaminotetraacetato disódico 2 mM, pH 7,4) de un volumen de 20 veces el peso del tejido utilizando un homogeneizador con una cuchilla giratoria de alta velocidad, y se centrifugó a 4°C, 80.000 × g durante 20 minutos. El precipitado obtenido se suspendió en el tampón descrito anteriormente de un volumen de 20 veces el peso del tejido y después de incubarlo a 37°C durante 10 minutos, se centrifugó en las condiciones anteriormente descritas. El precipitado obtenido se suspendió de nuevo en el tampón descrito anteriormente de un volumen de 20 veces el peso del tejido y se centrifugó en las condiciones anteriormente descritas. El precipitado obtenido se suspendió en tampón (Tris)-ácido clorhídrico 50 mM (conteniendo dihidrogeno etilendiaminotetraacetato disódico 1 mM, pH 7,4) de un volumen de 20 veces el peso del tejido y se conservó congelándolo a -85°C hasta que se utilizó para el análisis de unión como espécimen de membrana.

20 El análisis de unión se realizó utilizando 40 μ l del espécimen de membrana, 20 μ l de prazosina-[H³] (concentración final 0,2 a 0,5 nM), 20 μ l de un fármaco de ensayo y tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (conteniendo EDTA 1 mM, pH 7,4) de manera que la cantidad total fue 200 μ l (concentración final de dimetilsulfóxido 1%). La reacción se realizó a 30°C durante 45 minutos y se terminó llevando a cabo la filtración mediante succión con una cosechadora celular sobre una placa de filtro de fibra de vidrio.

25 La placa del filtro elaborada de fibra de vidrio se lavó con tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4), y después

de secarla, se añadió un cóctel de centelleo líquido para microplacas y la radiactividad se midió con un contador de centelleo de microplacas. La radioactividad en presencia de hidrocloreto de fentolamina 10 μM se adoptó como la unión no específica.

- 5 El valor de CI_{50} se calculó a partir de una reacción dependiente de la concentración utilizando un programa de análisis no lineal. El valor de KI se calculó a partir del valor de CI_{50} utilizando la fórmula de Cheng-Prusoff.

Ensayo Farmacológico 2

10 Actividad agonística parcial sobre el receptor D_2 de dopamina utilizando células que expresan el receptor D_2

La actividad agonística parcial sobre el receptor D_2 de dopamina se evaluó determinando cuantitativamente el efecto inhibidor de la producción de AMP cíclico de un compuesto de ensayo en células que expresan el receptor D_2 de dopamina en las que se indujo la producción de monofosfato de adenosina 3',5'-cíclico (AMP cíclico) mediante estimulación con forskolina.

Se cultivaron células de ovario de hámster Chino/DHFR(-) que expresan el receptor D_2 de dopamina recombinante humano en un medio de cultivo (Medio de Dulbecco Modificado por Iscove (medio de cultivo IMDM), suero bovino fetal al 10%, penicilina de 50 U.I./ml, estreptomycin de 50 $\mu\text{g}/\text{ml}$, geneticina de 200 $\mu\text{g}/\text{ml}$, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 μM) a 37°C y en condiciones de dióxido de carbono al 5%. Las células se sembraron a 10⁴ células/pocillo en una placa de microtitulación de 96 pocillos revestida con poli-L-lisina y se desarrollaron en las mismas condiciones durante 2 días. Cada pocillo se lavó con 100 μl de un medio de cultivo (medio de cultivo IMDM, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 μM). El medio de cultivo se reemplazó por 50 μl de medio de cultivo (medio de cultivo IMDM, ascorbato sódico al 0,1%, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 μM) que tenía disueltos 3 μM de un compuesto de ensayo. Después de dejar incubando a 37°C, en condiciones de dióxido de carbono al 5% durante 20 minutos, el medio de cultivo se reemplazó por 100 μl de medio de cultivo estimulante con forskolina (medio de cultivo IMDM, ascorbato de sodio al 0,1%, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 μM , forskolina 10 μM , 3-isobutil-1-metilxantina 500 μM) que tenía disueltos 3 μM del compuesto de ensayo y se dejó incubando a 37°C, condiciones de dióxido de carbono al 5% durante 10 minutos. Después de retirar el medio de cultivo, se dispensaron 200 μl de solución acuosa Lysis 1B (Amersham Bioscience, reactivo vinculado a un sistema de inmunoanálisis enzimático para AMP cíclico Biotrack) y se sacudieron durante 10 minutos. La solución acuosa de cada pocillo se utilizó como muestra para la medición. Las muestras para la medición por cuadruplicado diluidas se sometieron a medición de la cantidad de AMP cíclico utilizando el sistema de inmunoanálisis enzimático anteriormente descrito. La razón de inhibición del compuesto de ensayo respectivo se calculó suponiendo que la cantidad de AMP cíclico del pocillo al que no se había añadido compuesto de ensayo fue el 100%. En este sistema de ensayo empírico, la dopamina que se utilizó como fármaco de control suprimió la cantidad de AMP cíclico a aproximadamente 10% de la actividad máxima.

Se confirmó que los compuestos de ensayo tenían actividad agonística parcial para el receptor D_2 de dopamina en el ensayo anteriormente descrito.

Puesto que los compuestos de ensayo tienen actividad agonística parcial para el receptor de dopamina D_2 , estos pueden estabilizar la neurotransmisión de dopamina a unas condiciones normales en un paciente de esquizofrenia y como resultado, muestran, por ejemplo, un efecto mejorador de las condiciones positivas y negativas, un efecto mejorador del deterioro cognitivo y otros efectos mejoradores de los síntomas sin causar efectos secundarios.

Ensayo Farmacológico 3

Efecto inhibidor sobre el comportamiento estereotipado inducido por apomorfina en ratas

50 Como animales de ensayo se utilizaron ratas Wistar (macho, seis-siete semanas de edad, Japan SLC, Inc.). Se suspendió un compuesto de ensayo en goma arábiga al 5%/(solución salina fisiológica o agua) utilizando un mortero de ágata y se diluyó con el mismo disolvente cuando fue necesario.

55 Los animales de ensayo se mantuvieron en ayunas durante la noche desde el día anterior. Se administró subcutáneamente apomorfina (0,7 mg/kg) (1 ml/kg) 1 hora después de administrar oralmente cada compuesto de ensayo (5 ml/kg). El comportamiento estereotipado se observó durante 1 minuto respectivamente 20, 30 y 40 minutos después de la inyección de apomorfina.

60 El comportamiento estereotipado de cada animal se cuantificó de acuerdo con las siguientes condiciones y las puntuaciones realizadas en tres momentos se sumaron y se evaluó el efecto anti-apomorfina. Para cada grupo se utilizaron seis animales de ensayo.

0: La apariencia de los animales es la misma que la de las ratas tratadas con solución salina;

1: Olisqueo discontinuo, actividad exploratoria constante;

2: Olisqueo continuo, actividad exploratoria periódica;

3: Olisqueo continuo, mosdisqueo, roedura o lameteo discontinuos. Períodos muy breves de actividad locomotora;

4: Mosdisqueo, roedura o lameteo continuos; sin actividad exploratoria.

5 Se utilizó un sistema de análisis estadístico no clínico para todo el tratamiento estadístico. Cuando el valor de la probabilidad de significación fue inferior a 0,05, se consideró que existía una diferencia significativa. La diferencia de la puntuación entre el grupo de administración de disolvente y cada grupo de administración de compuesto de ensayo se analizó utilizando la prueba de la suma de rangos de Wilcoxon o la prueba de Steel. Además, se utilizó un análisis de regresión lineal para calcular la dosis eficaz del 50% (intervalo de confianza de 95%).

10 Puesto que los compuestos de ensayo mostraron un efecto inhibitor del comportamiento estereotipado inducido por apomorfina, se confirmó que los compuestos de ensayo tienen un efecto antagónico del receptor D₂.

15 **Ensayo Farmacológico 4**

Efecto inhibitor de contracciones en la cabeza inducidas por (±)D-2,5-dimetoxi-4-yodoanfetamina (DOI) en ratas

20 Como animales de ensayo se utilizaron ratas Wistar (macho, seis-siete semanas de edad, Japan SLC, Inc.). Se suspendió un compuesto de ensayo en goma arábica al 5%/(solución salina fisiológica o agua) utilizando un mortero de ágata y se diluyó con el mismo disolvente cuando fue necesario.

25 Los animales de ensayo se mantuvieron en ayunas durante la noche desde el día anterior. Se administró subcutáneamente DOI (5,0 mg/kg) (1 ml/kg) 1 hora después de administrar oralmente cada compuesto de ensayo (5 ml/kg). Se contó el número de contracciones en la cabeza durante 10 minutos inmediatamente después de la inyección de DOI. Se utilizaron seis animales de ensayo para cada grupo.

30 Se utilizó un sistema de análisis estadístico no clínico para todo el tratamiento estadístico. Cuando el valor de la probabilidad de significación fue inferior a 0,05, se consideró que existía una diferencia significativa. La diferencia del número de contracciones de la cabeza entre el grupo de administración de disolvente y cada grupo de administración de compuesto de ensayo se analizó utilizando la prueba de la t o la prueba de Dunnett. Además, se utilizó un análisis de regresión lineal para calcular la dosis eficaz del 50% (intervalo de confianza de 95%).

35 Puesto que los compuestos de ensayo mostraron un efecto inhibitor de las contracciones de la cabeza inducidas por DOI, se confirmó que los compuestos de ensayo tenían un efecto antagónico del receptor 5HT_{2A} de serotonina.

Ensayo Farmacológico 5

Efecto inductor de catalepsia en ratas

40 Como animales de ensayo se utilizaron ratas Wistar (macho, seis-siete semanas de edad, Japan SLC, Inc.). Se suspendió un compuesto de ensayo en goma arábica al 5%/(solución salina fisiológica o agua) utilizando un mortero de ágata y se diluyó con el mismo disolvente cuando fue necesario.

45 Los animales se mantuvieron en ayunas durante la noche desde el día anterior a la observación de la catalepsia y se realizó la ptosis 1, 2, 4, 6 y 8 horas después de administrar oralmente cada compuesto de ensayo (5 ml/kg). Para cada grupo se utilizaron seis animales de ensayo.

50 Una pata trasera de una rata se colocó en un borde de una pequeña caja de acero (anchura: 6,5 cm, profundidad: 4,0 cm, altura: 7,2 cm) (una postura no natural) y cuando la rata mantuvo la postura durante más de 30 segundos, se consideró que el caso era positivo para la catalepsia. Esta observación se realizó tres veces en cada momento, y si hubo al menos un caso positivo, se consideró que se producía catalepsia en el individuo.

55 Como resultado, el efecto de inducción de catalepsia de un compuesto de ensayo se disoció del efecto inhibitor sobre el comportamiento estereotipado inducido por apomorfina, por lo tanto se sugirió que la percepción del efecto secundario extrapiramidal en pruebas clínicas sería baja.

Ensayo Farmacológico 6

Medición de la actividad inhibitor de la absorción de serotonina (5-HT) de un compuesto de ensayo por el sinaptosoma cerebral en ratas

Se decapitaron ratas Wistar macho, se retiró el cerebro y se extirpó el córtex frontal, y se homogeneizó en una solución de sacarosa 0,32 M de un peso de 20 veces el peso del tejido utilizando un homogeneizador de tipo Potter.

El producto homogeneizado se centrifugó a 4°C, 1.000 × g durante 10 minutos, el sobrenadante obtenido se centrifugó adicionalmente a 4°C, 20.000 × g durante 20 minutos, y el sedimento se suspendió en un tampón de incubación (tampón Hepes 20 mM (pH 7,4) que contenía glucosa 10 mM, cloruro de sodio 145 mM, cloruro potasio 4,5 mM, cloruro de magnesio 1,2 mM, cloruro de calcio 1,5 mM), que se utilizó como fracción de sinaptosoma bruta.

La reacción de absorción de 5-HT se realizó en un volumen de 200 µl utilizando una placa de fondo redondo de 96 pocillos y en el tampón de incubación tras la reacción estaban contenidos pargilina (concentración final 10 µM) y ascorbato de sodio (concentración final de 0,2 mg/ml) y se utilizaron.

A cada pocillo se añadieron tampón de incubación (recuento total), 5-HT no marcada (concentración final 10 µM, recuento no específico) y el compuesto de ensayo diluido (concentración final 300 nM). Se añadió una décima parte de la cantidad de volumen final de la fracción de sinaptosoma y después de preincubar a 37°C durante 10 minutos, se añadió una solución de 5-HT marcada con tritio (concentración final 8 nM) y la reacción de absorción comenzó a 37°C. El tiempo de absorción fue de 10 minutos y la reacción se terminó mediante filtración a vacío a través de una placa de papel de filtro de fibra de vidrio de 96 pocillos, y después de lavar el papel de filtro con solución salina normal fría, se secó lo suficiente y se añadió al filtro Microscint0 (Perkin-Elmer) y se midió la radiactividad que quedaba en el filtro.

La actividad inhibidora de la absorción de serotonina (%) se calculó a partir de la radiactividad del recuento total como el 100%, del recuento no específico como 0%, y del recuento obtenido con el compuesto de ensayo.

$$\% \text{ de inhibición de 5-HT (\%)} = \frac{100 - [(\text{Recuento obtenido con el compuesto de ensayo} - \text{Recuento no específico (Absorción 0\%)}) / (\text{Recuento total (Absorción 100\%) - Recuento no específico (Absorción 0\%)})] \times 100}{100}$$

Los resultados se muestran en la siguiente Tabla 314.

[Tabla 314]

Compuesto de ensayo	Razón de inhibición de la absorción de serotonina (%) (300 nM)
Compuesto del Ejemplo 10	95,2
Compuesto del Ejemplo 14	95,3
Compuesto del Ejemplo 673	96,6
Compuesto del Ejemplo 887	94,4
Compuesto del Ejemplo 892	87,8
Compuesto del Ejemplo 905	85,0
Compuesto del Ejemplo 899	96,3
Compuesto del Ejemplo 895	82,3
Compuesto del Ejemplo 896	95,6
Compuesto del Ejemplo 875	97,2
Compuesto del Ejemplo 876	97,5
Compuesto del Ejemplo 877	97,5
Compuesto del Ejemplo 902	98,6
Compuesto del Ejemplo 903	97,1

Ejemplos de Preparación

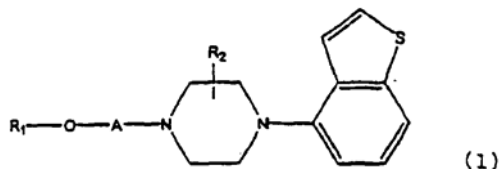
Se mezclaron 100 g de un compuesto de la presente invención, 40 g de Avicel (nombre de fábrica, producto de Asahi Chemical Industry Co., Ltd.), 30 g de almidón de maíz y 2 g de estearato de magnesio y se pulieron y se comprimieron con un mortero para glicocalyx R10 mm.

El comprimido obtenido se revistió con una película utilizando un agente de revestimiento pelicular elaborado con 10 g de TC-5 (nombre de fábrica, producto de Shin-Etsu Chemical Co., Ltd., hidroxipropilmetilcelulosa), 3 g de polietilenglicol 6000, 40 g de aceite de ricino y una cantidad apropiada de etanol para producir un comprimido con revestimiento pelicular de la composición anterior.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto heterocíclico o una de sus sales representado por la fórmula (1):

[Fórmula 1]



donde R^2 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_1-C_6 ;

A representa un grupo alquileo C_1-C_6 o un grupo alquenileno C_2-C_6 ; y

R^1 representa

un grupo aromático seleccionado entre un grupo fenilo, un grupo naftilo, un grupo dihidroindenilo y un grupo tetrahidronaftilo;

donde al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en los grupos (1) a (66) de más abajo puede estar presente como sustituyente en el grupo aromático representado por R^1 :

(1) un grupo alquilo C_1-C_6 ,

(2) un grupo alquenilo C_2-C_6 ,

(3) un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con halógeno,

(4) un grupo alcoxi C_1-C_6 ,

(5) un grupo ariloxi,

(6) un grupo alquil(C_1-C_6)tio,

(7) un grupo alcoxi C_1-C_6 sustituido con halógeno,

(8) un grupo hidroxilo,

(9) un grupo hidroxilo protegido,

(10) un grupo hidroxialquilo C_1-C_6 ,

(11) un grupo hidroxialquilo C_1-C_6 protegido,

(12) un átomo de halógeno,

(13) un grupo ciano,

(14) un grupo arilo,

(15) un grupo nitro,

(16) un grupo amino,

(17) un grupo amino que tiene uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo alcanilo C_1-C_6 , un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilo, un grupo alquil(C_1-C_6)sulfonilo, un grupo carbamoilo, un grupo alquil(C_1-C_6)carbamoilo, un grupo aminoalcanilo C_1-C_6 , un grupo alcanilo(C_1-C_6)aminoalcanilo C_1-C_6 y un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilaminoalcanilo C_1-C_6 como sustituyentes,

(18) un grupo alcanilo C_1-C_6 ,

(19) un grupo arilsulfonilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C_1-C_6 en el grupo arilo,

(20) un grupo carboxi,

(21) un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilo,

(22) un grupo carboxialquilo C_1-C_6 ,

(23) un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilalquilo C_1-C_6 ,

(24) un grupo alcanilo(C_1-C_6)aminoalcanilo C_1-C_6 ,

(25) un grupo carboxialquenilo C_2-C_6 ,

(26) un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilalquenilo C_2-C_6 ,

(27) un grupo carbamoilalquenilo C_2-C_6 que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 y un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con halógeno como sustituyente,

(28) un grupo carbamoilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en los grupos (i) a (1xxviii) de más abajo como sustituyente:

(i) un grupo alquilo C_1-C_6 ,

(ii) un grupo alcoxi C_1-C_6 ,

(iii) un grupo hidroxialquilo C_1-C_6 ,

(iv) un grupo alcoxi(C_1-C_6)alquilo C_1-C_6 ,

(v) un grupo ariloxialquilo C_1-C_6 ,

(vi) un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con halógeno,

(vii) un grupo aminoalquilo C_1-C_6 que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo alcanilo C_1-C_6 , un grupo aroilo y un grupo carbamoilo,

(viii) un grupo cicloalquilo C_3-C_8 que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que

- consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo fenilalcoxi C₁-C₆ como sustituyente,
- (ix) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con cicloalquilo C₃-C₈,
- (x) un grupo alqueno C₂-C₆,
- 5 (xi) un grupo carbamoilalquilo C₁-C₆ que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo fenilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ y uno o varios grupos fenilo que pueden tener uno o varios grupos alcoxi C₁-C₆ como sustituyente,
- (xii) un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilalquilo C₁-C₆,
- 10 (xiii) un grupo furilalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo furilo).
- (xiv) un grupo tetrahidrofurilalquilo C₁-C₆,
- (xv) un grupo 1,3-dioxolanilalquilo C₁-C₆,
- (xvi) un grupo tetrahidropiranolalquilo C₁-C₆,
- 15 (xvii) un grupo pirrolilalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo pirrolilo),
- (xviii) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo dihidropirazolilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
- (xix) un grupo pirazolilalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo pirazolilo),
- 20 (xx) un grupo imidazolilalquilo C₁-C₆,
- (xxi) un grupo piridilalquilo C₁-C₆,
- (xxii) un grupo pirazinilalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo pirazinilo),
- 25 (xxiii) un grupo pirrolidinilalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en uno o varios grupos oxo y un grupo alquilo C₁-C₆ como sustituyente en el grupo pirrolidinilo),
- (xxiv) un grupo piperidilalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanilo C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo piperidilo),
- 30 (xxv) un grupo piperazinilalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo piperazinilo),
- (xxvi) un grupo morfolinilalquilo C₁-C₆,
- (xxvii) un grupo tienilalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo tienilo), grupo tienilo),
- 35 (xxviii) un grupo tiazolilalquilo C₁-C₆,
- (xxix) un grupo dihidrobenzofurilalquilo C₁-C₆,
- (xxx) un grupo benzopiranilalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos oxo como sustituyentes en el grupo benzopiranilo),
- (xxxi) un grupo benzimidazolilalquilo C₁-C₆,
- 40 (xxxii) un grupo indolilalquilo C₁-C₆ que puede tener uno o varios grupos alcoxi(C₁-C₆)carbonilo en el grupo alquilo C₁-C₆,
- (xxxiii) un grupo imidazolilalquilo C₁-C₆ que tiene uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo en el grupo alquilo C₁-C₆,
- 45 (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo alquil(C₁-C₆)tioalquilo C₁-C₆ como sustituyente,
- (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alcanilo C₁-C₆ y un grupo aroilo como sustituyentes,
- 50 (xxxvi) un grupo piperidilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alcanilo C₁-C₆ y un grupo aroilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un átomo de halógeno como sustituyente,
- 55 (xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
- (xxxviii) un grupo hexahidroazepinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
- (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo arilo y un grupo furilo como sustituyentes,
- (xl) un grupo tiazolilo,
- 60 (xli) un grupo tiadiazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆,
- (xlii) un grupo isoxazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆,
- (xliii) un grupo indazolilo,
- (xliv) un grupo indolilo,
- (xlv) un grupo tetrahidrobenzotiazolilo,
- (xlvi) un grupo tetrahydroquinolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que

- consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un átomo de halógeno y un grupo oxo como sustituyentes,
- (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆,
- (xlviii) un grupo benzodioxolilalquilo C₁-C₆,
- 5 (xlix) un grupo arilo que puede tener uno o varios grupos como sustituyentes, seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno; un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno; un grupo alquenilo C₂-C₆; un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo alquil(C₁-C₆)sulfonilo, un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo arilo; un grupo
- 10 sulfamoilo; un grupo alquil(C₁-C₆)tio; un grupo alcanoilo C₁-C₆; un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo C₂-C₆; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo ariloxi; un grupo arilalcoxi C₁-C₆; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxialquilo C₁-C₆; un grupo carbamoilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo arilo;
- 15 un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆; un grupo dihidrofurilo que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo tiazolidinilalquilo C₁-C₆ que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo imidazolilalcanoilo C₁-C₆ y un grupo piperidinilcarbonilo,
- (i) un grupo cianoalquilo C₁-C₆,
- (ii) un grupo dihidroquinolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo oxo,
- 20 (iii) un grupo alquil(C₁-C₆)amino sustituido con halógeno,
- (liii) un grupo alquil(C₁-C₆)tioalquilo C₁-C₆,
- (liv) un grupo amidino que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆,
- (lv) un grupo amidinoalquilo C₁-C₆,
- 25 (lvi) un grupo alquenil(C₁-C₆)oxialquilo C₁-C₆,
- (lvii) un grupo arilamino que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno y un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno, en el grupo arilo,
- (lviii) un grupo arilalquenilo C₂-C₆,
- 30 (lix) un grupo piridilamino que puede tener uno o varios grupos C₁-C₆,
- (lx) un grupo arilalquilo C₁-C₆ (que puede tener en el grupo arilo y/o el grupo alquilo C₁-C₆ uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno, un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno, un grupo
- 35 alcoxi C₁-C₆, un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo como sustituyente),
- (lxi) un grupo alquinilo C₂-C₆,
- (lxii) un grupo ariloxialquilo C₁-C₆ (que puede tener como sustituyente en el grupo arilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo carbamoilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo
- 40 alquilo C₁-C₆; y un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo),
- (lxiii) un grupo isoxazolilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
- (lxiv) un grupo dihidroindenilo,
- (lxv) un grupo arilalcoxi(C₁-C₆)alquilo C₁-C₆,
- (lxvi) un grupo tetrahidropiranilo,
- 45 (lxvii) un grupo azetidínilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoilo C₁-C₆ y un grupo aroilo
- (lxviii) un grupo azetidínilalquilo C₁-C₆ que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoilo C₁-C₆ y un grupo aroilo,
- (lxix) y un grupo tetrazolilo,
- (lxx) y un grupo indolinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
- 50 (lxxi) un grupo triazolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo alquil(C₁-C₆)tio,
- (lxxii) un grupo imidazolilo que puede tener uno o varios grupos carbamoilo,
- (lxxiii) un grupo oxazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆,
- (lxxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆,
- 55 (lxxv) un grupo benzimidazolilo,
- (lxxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
- (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener uno o varios grupos alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, y
- (lxxviii) un grupo oxazolilalquilo C₁-C₆ que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆
- 60 (29) un grupo aminoalquilo C₁-C₆ que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo arilo, un grupo arilalquilo C₁-C₆, un grupo aroilo y un grupo alquilo sustituido con amino (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo amino) en el grupo amino,

- (30) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo carbamoilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno,
- 5 (31) un grupo tiocarbamoilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆,
- (32) un grupo sulfamoilo,
- (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
- (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo C₁-C₆,
- 10 (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
- (36) un grupo imidazolilo,
- (37) un grupo triazolilo,
- (38) un grupo isoxazolilo,
- (39) un grupo piperidilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo arilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un
- 15 grupo amino que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo alcanilo(C₁-C₆)aminoalcanilo C₁-C₆,
- (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo carboxialquilo C₁-C₆, un grupo alquil(C₁-C₆)carbamoilalquilo C₁-C₆, un grupo carbamoilo, un grupo
- 20 alcoxi C₁-C₆, un grupo carboxilo, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo amino (en el que pueden estar presentes 1 o 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo aroilo), un grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo
- 25 alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo aroilo), un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes uno o varios grupos alquilo C₁-C₆), un grupo 1,4-dioxo-8-azaspiro[4,5]decilo, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,9-diazepinilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes uno o varios grupos alquilo C₁-C₆) un grupo piridilo, un grupo piridiloxilo, un grupo piridilalcoxi C₁-C₆, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos oxo), un grupo benzodioxolilo, un
- 30 grupo arilalcoxi C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno en el grupo arilo), un grupo arilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo hidroxilo), un
- 35 grupo ariloxilo (que puede tener en el grupo arilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno), un grupo arilalquilo C₁-C₆ (que puede tener en el grupo arilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno), y un grupo aroilo (que puede tener en el grupo arilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxi C₁-C₆),
- 40 (41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener un grupo como sustituyente, seleccionado del grupo que consiste en un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, un grupo carbamoilo, un grupo hidroxilo, un grupo amino (que puede tener en el grupo amino uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆ y un grupo aroilo), un grupo morfolinilalquilo C₁-C₆, un grupo pirrolidinilalquilo C₁-C₆, un grupo piperidilalquilo C₁-C₆, un grupo piperazinilalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo
- 45 C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo piperazinilo), un grupo aminoalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo amino), un grupo ariloxilo (que puede tener uno o varios grupos alcoxi C₁-C₆ sustituidos con halógeno en el grupo arilo), un grupo ariloxialquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alcoxi C₁-C₆ sustituidos con halógeno en el grupo arilo) y un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos oxo),
- 50 (42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos como sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo aminoalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo amino), un grupo piperidilalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes
- 55 en el grupo piperidilo), un grupo morfolinilalquilo C₁-C₆, un grupo pirrolidinilalquilo C₁-C₆, un grupo 1,3-dioxolanilalquilo C₁-C₆, un grupo tetrahydrofuralalquilo C₁-C₆, un grupo piridilalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos fenilo como sustituyentes en el grupo alquilo C₁-C₆), un grupo imidazolilalquilo C₁-C₆, un grupo furilalquilo C₁-C₆, un grupo pirrolidinilcarbonilalquilo C₁-C₆, un grupo piperidilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes, un grupo piridilo (que puede tener en el grupo piridilo uno o
- 60 varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo ciano y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno como sustituyentes), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo arilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo C₁-C₆), un grupo aroilo, un grupo furilcarbonilo, un grupo arilalcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo oxo,

- (43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,
 (44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo piridilo,
 (45) un grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆,
 5 (46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo,
 (47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo piperidilalquilo C₁-C₆ y un grupo arilo,
 (48) un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos arilo que pueden tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo ciano,
 10 (49) un grupo azabicyclo[3,2,2]nonilcarbonilo,
 (50) un grupo 8-azabicyclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos ariloxi sustituidos con halógeno o insustituidos,
 (51) un grupo indolinilcarbonilo,
 (52) un grupo tetrahydroquinolilcarbonilo,
 15 (53) un grupo tetrahidropirido[3,4-b]indolilcarbonilo,
 (54) un grupo morfolinilalquilo C₁-C₆,
 (55) un grupo piperazinilalquilo C₁-C₆ que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ en el grupo piperazinilo,
 20 (56) un grupo morfolinilcarbonilalquilo C₁-C₆,
 (57) un grupo piperazinilcarbonilalquilo C₁-C₆ que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ en el grupo piperazinilo,
 (58) un grupo oxo,
 (59) un grupo aminoalcoxi C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ en el grupo amino),
 25 (60) un grupo alcoxi(C₁-C₆)alcoxi C₁-C₆,
 (61) un grupo piperazinilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆ y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo,
 (62) un grupo morfolinilo,
 (63) un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanil-carbonilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo arilo,
 30 (64) un grupo tetrahidropiranilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos piridilo,
 (65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos tioxi, y
 (66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decanilo.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde, en el grupo aromático representado por R¹, de 1 a 5 grupos seleccionados del grupo que consiste en los grupos (1) a (66) de más abajo pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes:

- (1) un grupo alquilo C₁-C₆,
 (2) un grupo alqueno C₂-C₆,
 40 (3) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno,
 (4) un grupo alcoxi C₁-C₆,
 (5) un grupo fenoxi,
 (6) un grupo alquil(C₁-C₆)tio,
 (7) un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno,
 45 (8) un grupo hidroxilo,
 (9) un grupo fenilalcoxi C₁-C₆,
 (10) un grupo hidroxialquilo C₁-C₆,
 (11) un grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo C₁-C₆,
 (12) un átomo de halógeno,
 50 (13) un grupo ciano,
 (14) un grupo fenilo,
 (15) un grupo nitro,
 (16) un grupo amino,
 (17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alquil(C₁-C₆)sulfonilo, un grupo carbamoilo, un grupo alquil(C₁-C₆)carbamoilo, un grupo aminoalcanoilo C₁-C₆, un grupo alcanilo(C₁-C₆)aminoalcanoilo C₁-C₆ y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilaminoalcanoilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes,
 55 (18) un grupo alcanilo C₁-C₆,
 (19) a fenilsulfonilo grupo que puede tener un solo grupo alquilo C₁-C₆ en el grupo fenilo,
 60 (20) un grupo carboxi,
 (21) un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo,
 (22) un grupo carboxialquilo C₁-C₆,
 (23) un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilalquilo C₁-C₆,

- (24) un grupo alcanoil(C₁-C₆)aminoalcanoilo C₁-C₆,
 (25) un grupo carboxialquenilo C₁-C₆,
 (26) un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilalquenilo C₁-C₆,
 (27) un grupo carbamoilalquenilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que
 5 consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno como
 sustituyente o sustituyentes,
 (28) un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en los
 grupos (i) a (lxxviii) de más abajo como sustituyente o sustituyentes:
- (i) un grupo alquilo C₁-C₆,
 (ii) un grupo alcoxi C₁-C₆,
 (iii) un grupo hidroxialquilo C₁-C₆,
 (iv) un grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo C₁-C₆,
 (v) un grupo fenoxialquilo C₁-C₆,
 15 (vi) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno,
 (vii) un grupo aminoalquilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que
 consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo benzoilo y un grupo carbamoilo,
 (viii) un grupo cicloalquilo C₃-C₈ que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste
 20 en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo fenilalcoxi C₁-
 C₆ como sustituyente o sustituyentes,
 (ix) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con cicloalquilo C₃-C₈,
 (x) un grupo alquenilo C₂-C₆,
 (xi) un grupo alquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 2 grupos carbamoilo que pueden tener de 1 a 2 grupos
 25 como sustituyente o sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un
 grupo fenilo que puede tener un solo grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo fenilo que puede tener un solo
 grupo alcoxi C₁-C₆,
 (xii) un grupo alquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 2 grupos alcoxi(C₁-C₆)carbonilo,
 (xiii) un grupo furilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o
 30 sustituyentes en el grupo furilo),
 (xiv) un grupo tetrahidrofurilalquilo C₁-C₆,
 (xv) un grupo 1,3-dioxolanilalquilo C₁-C₆,
 (xvi) un grupo tetrahidropiranilalquilo C₁-C₆,
 (xvii) un grupo pirrolilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ en el grupo pirrolilo
 como sustituyente o sustituyentes),
 35 (xviii) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo dihidropirazolilo que puede tener un solo grupo
 oxo,
 (xix) un grupo pirazolilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o
 sustituyentes en el grupo pirazolilo),
 (xx) un grupo imidazolilalquilo C₁-C₆,
 40 (xxi) un grupo piridilalquilo C₁-C₆,
 (xxii) un grupo pirazinilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo C₁-C₆
 como sustituyente o sustituyentes en el grupo pirazinilo),
 (xxiii) un grupo pirrolidinilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que
 45 consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el grupo
 pirrolidinilo),
 (xxiv) un grupo piperidilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que
 consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el grupo
 piperidilo),
 50 (xxv) un grupo piperazinilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆ como
 sustituyente o sustituyentes en el grupo piperazinilo),
 (xxvi) un grupo morfolinilalquilo C₁-C₆,
 (xxvii) un grupo tienilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o
 sustituyentes en el grupo tienilo),
 55 (xxviii) un grupo tiazolilalquilo C₁-C₆,
 (xxix) un grupo dihidrobenzofurilalquilo C₁-C₆,
 (xxx) un grupo benzopiranilalquilo C₁-C₆ (que puede tener un solo grupo oxo como sustituyente en el
 grupo benzopiranilo),
 (xxxi) un grupo benzimidazolilalquilo C₁-C₆,
 60 (xxxii) un grupo indolilalquilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi(C₁-C₆)carbonilo en el grupo
 alquilo C₁-C₆,
 (xxxiii) un grupo imidazolilalquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que
 consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, en el grupo alquilo C₁-C₆,
 (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un
 grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo alquil(C₁-C₆)tioalquilo C₁-C₆ como sustituyente o

sustituyentes

- (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alcanilo C₁-C₆ y un grupo benzoilo como sustituyente o sustituyentes,
- 5 (xxxvi) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alcanilo C₁-C₆ y un grupo benzoilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un átomo de halógeno como sustituyente o sustituyentes en el grupo fenilo),
- 10 (xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener un solo grupo oxo
- (xxxviii) un grupo hexahidroazepinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo fenilo y un grupo furilo como sustituyente o sustituyentes,
- (xl) un grupo tiazolilo,
- 15 (xli) tiadiazolilo grupo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,
- (xlii) un grupo isoxazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,
- (xliii) un grupo indazolilo,
- (xliv) un grupo indolilo,
- (xlv) un grupo tetrahidrobenzotiazolilo,
- 20 (xlvi) un grupo tetrahidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un átomo de halógeno y un grupo oxo como sustituyente o sustituyentes,
- (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,
- (xlviii) un grupo benzodioxolilalquilo C₁-C₆,
- 25 (xlix) un grupo fenilo o un grupo naftilo que pueden tener de 1 a 3 grupos como sustituyente o sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno; un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno; un grupo alqueno C₂-C₆; un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo alquil(C₁-C₆)sulfonilo, un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo arilo; un grupo sulfamoilo; un
- 30 grupo alquil(C₁-C₆)tio; un grupo alcanilo C₁-C₆; un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo; un grupo pirrolilo; un grupo alquino C₂-C₆; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo fenilo; un grupo fenilalcoxi C₁-C₆; un grupo hidroxi; un grupo hidroxialquilo C₁-C₆; un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo fenilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆; un grupo dihidrofurilo que puede tener un solo grupo oxo; un grupo tiazolidinilo C₁-C₆ que puede tener dos grupos oxo; un grupo imidazolilalcanilo C₁-C₆ y un grupo piperidinilcarbonilo,
- 35 (i) un grupo cianoalquilo C₁-C₆,
- (ii) un grupo dihidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo oxo,
- 40 (iii) un grupo alquil(C₁-C₆)amino sustituido con halógeno,
- (iiii) un grupo alquil(C₁-C₆)tioalquilo C₁-C₆,
- (liv) un grupo amidino que puede tener un grupo alquilo C₁-C₆,
- 45 (lv) un grupo amidinoalquilo C₁-C₆,
- (lvi) un grupo alqueno(C₂-C₆)oxialquilo C₁-C₆,
- (lvii) un grupo fenilamino que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno y un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno en el grupo fenilo,
- 50 (lviii) un grupo fenilalqueno C₂-C₆,
- (lix) un grupo piridilamino que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,
- 55 (lx) un grupo fenilalquilo C₁-C₆ (que puede tener como sustituyente o sustituyentes en el grupo fenilo y/o el grupo alquilo C₁-C₆ de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno, un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo),
- (lxi) un grupo alquino C₂-C₆,
- (lxii) un grupo feniloxialquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo N-alcoxi(C₁-C₆)-N-alquil(C₁-C₆)carbamoilo y un grupo oxopirrolidinilo como sustituyente o sustituyentes en el grupo fenilo),
- 60 (lxiii) un grupo isoxazolilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (lxiv) un grupo dihidroindenilo,
- (lxv) un grupo fenilalcoxi(C₁-C₆)alquilo C₁-C₆,
- (lxvi) un grupo tetrahidropirano,
- (lxvii) un grupo azetidino que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un

- grupo alcanoilo C₁-C₆ y un grupo benzoilo,
 (lxviii) un grupo azetidinalquilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que
 consiste en un grupo alcanoilo C₁-C₆ y un grupo benzoilo,
 (lix) y un grupo tetrazolilo,
 5 (lxx) y un grupo indolinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (lxxi) un grupo triazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un
 grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo alquil(C₁-C₆)tio,
 (lxxii) un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos carbamoilo,
 (lxxiii) un grupo oxazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,
 10 (lxxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,
 (lxxv) un grupo benzimidazolilo,
 (lxxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, y
 (lxxviii) un grupo oxazolilalquilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,
 15
- (29) un grupo aminoalquilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en
 un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un
 grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo fenilo, un grupo fenilalquilo C₁-C₆, un grupo benzoilo y un grupo alquilo
 20 sustituido con amino (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el
 grupo amino), en el grupo amino,
 (30) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un solo grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos
 seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con
 halógeno,
 (31) un grupo tiocarbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆,
 25 (32) un grupo sulfamoilo,
 (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en
 un grupo oxo y un grupo alquilo C₁-C₆,
 (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 30 (36) un grupo imidazolilo,
 (37) un grupo triazolilo,
 (38) un grupo isoxazolilo,
 (39) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un
 grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo alquil(C₁-C₆)fenilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo
 35 hidroxilo, y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo
 alquilo C₁-C₆, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo
 alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo alcanoil(C₁-C₆)aminoalcanoilo C₁-C₆,
 (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste
 en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo
 40 carboxialquilo C₁-C₆, un grupo alquil(C₁-C₆)carbamoilalquilo C₁-C₆, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi C₁-
 C₆, un grupo carboxi, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo amino (en el que pueden estar presentes 1 o
 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo
 alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo benzoilo), un grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes como
 45 sustituyentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo
 alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo benzoilo), un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes como
 sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆), un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decilo, un
 grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que puede estar presente como sustituyente un
 solo grupo alquilo C₁-C₆), un grupo piridilo, un grupo piridiloxi, un grupo piridilalcoxi C₁-C₆, un grupo
 50 tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un solo grupo oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo
 fenilalcoxi C₁-C₆ (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en
 un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con
 halógeno), un grupo fenilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 3 grupos
 seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo hidroxilo), un
 grupo feniloxi (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un
 55 grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆
 sustituido con halógeno), un grupo fenilalquilo C₁-C₆ (en el grupo fenilo, pueden estar presentes de 1 a 3
 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo
 alcoxi C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno), y un grupo benzoilo (que puede tener de 1 a 3
 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxi C₁-C₆ en el grupo
 60 fenilo),
 (41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos como sustituyente o sustituyentes
 seleccionados del grupo que consiste en un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, un grupo carbamoilo, un grupo hidroxilo,
 un grupo amino (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo
 C₁-C₆, un grupo alcanoilo C₁-C₆ y un grupo benzoilo en el grupo amino), un grupo morfolinilalquilo C₁-C₆, un

grupo pirrolidinilalquilo C₁-C₆, un grupo piperidilalquilo C₁-C₆, un grupo piperazinilalquilo C₁-C₆ (que puede tener un solo grupo alquilo C₁-C₆ como sustituyente en el grupo piperazinilo), un grupo aminoalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ que pueden estar presentes como sustituyentes en el grupo amino), un grupo feniloxi (que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi C₁-C₆ sustituidos con halógeno en el grupo fenilo), un grupo feniloxialquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi C₁-C₆ sustituidos con halógeno en el grupo fenilo) y un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un grupo oxo),

(42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos como sustituyente o sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo aminoalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el grupo amino), un grupo piperidilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el grupo piperidilo), un grupo morfolinilalquilo C₁-C₆, un grupo pirrolidinilalquilo C₁-C₆, un grupo 1,3-dioxoranilalquilo C₁-C₆, un grupo tetrahydrofuralalquilo C₁-C₆, un grupo piridilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos fenilo como sustituyente o sustituyentes en el grupo alquilo C₁-C₆), un grupo imidazolilalquilo C₁-C₆, un grupo furilalquilo C₁-C₆, un grupo pirrolidinilcarbonilo C₁-C₆, un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes), un grupo piridilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo ciano y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno como sustituyente o sustituyentes en el grupo piridilo), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo fenilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo C₁-C₆), un grupo benzoilo, un grupo furilcarbonilo, un grupo fenilalcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo oxo,

(43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,

(44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo C₁-C₆ y un grupo piridilo,

(45) un grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,

(46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo,

(47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo piperidilalquilo C₁-C₆ y un grupo fenilo,

(48) un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos fenilo que pueden tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo ciano,

(49) un grupo azabicyclo[3,2,2]nonilcarbonilo,

(50) un grupo 8-azabicyclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos feniloxi sustituidos con halógeno o insustituidos,

(51) un grupo indolinilcarbonilo,

(52) un grupo tetrahydroquinolilcarbonilo,

(53) un grupo tetrahidropirido[3,4-b]indolil-carbonilo,

(54) un grupo morfolinilalquilo C₁-C₆,

(55) un grupo piperazinilalquilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆ en el grupo piperazinilo,

(56) un grupo morfolinilcarbonilalquilo C₁-C₆,

(57) un grupo piperazinilcarbonilalquilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆ en el grupo piperazinilo,

(58) un grupo oxo,

(59) un grupo aminoalcoxi C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ en el grupo amino),

(60) un grupo alcoxi(C₁-C₆)alcoxi C₁-C₆,

(61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆ y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo,

(62) un grupo morfolinilo,

(63) un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanil-carbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo fenilo,

(64) un grupo tetrahidropiranilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos piridilo,

(65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener un solo grupo tioxo, y

(66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decanilo.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, donde A es un grupo alquileo C₁-C₆.

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, donde R¹ representa un grupo fenilo; y

en el grupo fenilo representado por R¹, de 1 a 5 grupos seleccionados del grupo que consiste en los apartados (1) a (66) definidos en la reivindicación 2 pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes.

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde R¹ representa un grupo fenilo; y

en el grupo fenilo representado por R¹, de 1 a 5 grupos seleccionados del grupo que consiste en los apartados (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) y (62) mostrados más abajo pueden estar

presentes como sustituyente o sustituyentes:

(1) un grupo alquilo C₁-C₆,
 (4) un grupo alcoxi C₁-C₆,
 (10) un grupo hidroxialquilo C₁-C₆,
 (17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alquil(C₁-C₆)sulfonilo, un grupo carbamoilo, un grupo alquil(C₁-C₆)carbamoilo, un grupo aminoalcanoilo C₁-C₆, un grupo alcanilo(C₁-C₆)aminoalcanoilo C₁-C₆ y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilaminoalcanoilo C₁-C₆, como sustituyente o sustituyentes,
 (18) un grupo alcanilo C₁-C₆,
 (21) un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo,
 (28) un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en los grupos (i), (ii), (iv), (xii) y (xxi) de más abajo como sustituyente o sustituyentes:

(i) un grupo alquilo C₁-C₆,
 (ii) un grupo alcoxi C₁-C₆,
 (iv) un grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo C₁-C₆,
 (xii) un grupo alquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 2 grupos alcoxi(C₁-C₆)carbonilo,
 (xxi) un grupo piridilalquilo C₁-C₆,

(29) un grupo aminoalquilo C₁-C₆ que puede tener, en el grupo amino, de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo fenilo, un grupo fenilalquilo C₁-C₆, un grupo benzoilo y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con amino (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ que pueden estar presente como sustituyente o sustituyentes en el grupo amino),

(30) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un solo grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno, (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,

(34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo C₁-C₆,

(35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,

(36) un grupo imidazolilo,

(39) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo alquil(C₁-C₆)fenilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo alcanilo(C₁-C₆)aminoalcanoilo C₁-C₆,

(61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆ y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, y

(62) un grupo morfolinilo.

6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 5, donde R¹ representa (II) un grupo fenilo y, en el grupo aromático representado por R¹, de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en los apartados (1), (4), (10), (17), (18) (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) y (62) definidos en la reivindicación 5 pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes.

7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, donde R¹ representa (II) un grupo fenilo, y, en el grupo fenilo representado por R¹, de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en los apartados (1), (4), (10), (17), (18), (28), (33), (35), (39) y (61) mostrados más abajo pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes.

(1) un grupo alquilo C₁-C₆,
 (4) un grupo alcoxi C₁-C₆,
 (10) un grupo hidroxialquilo C₁-C₆,
 (17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo aminoalcanoilo C₁-C₆, un grupo alcanilo(C₁-C₆)aminoalcanoilo C₁-C₆ y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilaminoalcanoilo C₁-C₆, como sustituyente o sustituyentes,
 (18) un grupo alcanilo C₁-C₆,
 (28) un grupo carbamoilo que tiene un solo grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo C₁-C₆,
 (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (39) un grupo piperidilo, y
 (61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alcanilo C₁-C₆ y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo.

8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 7, donde R¹ es un grupo fenilo que tiene, en el grupo fenilo, un solo grupo alquilo C₁-C₆, un solo grupo alcoxi C₁-C₆ y un solo grupo amino que tiene 1 o 2 grupos alquilo C₁-C₆ en el grupo amino;

un grupo fenilo que tiene, en el grupo fenilo, un solo grupo alquilo C₁-C₆, un solo grupo alcoxi C₁-C₆ y un solo grupo carbamoilo que tiene un solo grupo alquilo C₁-C₆, que tiene dos grupos alcoxi C₁-C₆ en el grupo alquilo C₁-C₆;

un grupo fenilo que tiene, en el grupo fenilo, un solo grupo hidroxialquilo C₁-C₆, un solo grupo alcoxi C₁-C₆ y un solo grupo oxazolidinilo que tiene un solo grupo oxo en el grupo oxazolidinilo;

un grupo fenilo que tiene, en el grupo fenilo, un solo grupo alquilo C₁-C₆, un solo grupo alcoxi C₁-C₆ y un solo grupo pirrolidinilo;

un grupo fenilo que tiene, en el grupo fenilo, un solo grupo alquilo C₁-C₆, un solo grupo alcoxi C₁-C₆ y un solo grupo piperidilo;

un grupo fenilo que tiene, en el grupo fenilo, un solo grupo alquilo C₁-C₆, un solo grupo alcoxi C₁-C₆ y un solo grupo piperazilo que tiene un solo grupo alcanilo C₁-C₆ en el grupo piperazilo;

un grupo fenilo que tiene, en el grupo fenilo, un solo grupo alquilo C₁-C₆, un solo grupo alcoxi C₁-C₆ y un solo grupo piperazilo que tiene un solo grupo alcanilo C₁-C₆ y un solo grupo oxo en el grupo piperazilo;

un grupo fenilo que tiene, en el grupo fenilo, un solo grupo alquilo C₁-C₆, un solo grupo alcoxi C₁-C₆ y un solo grupo piperazilo que tiene un solo grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un solo grupo oxo en el grupo piperazilo;

un grupo fenilo que tiene, en el grupo fenilo, un solo grupo alquilo C₁-C₆, un solo grupo alcoxi C₁-C₆ y un solo grupo N-[(N-alcoxi(C₁-C₆)carbonilamino)alcanilo(C₁-C₆)]amino;

un grupo fenilo que tiene, en el grupo fenilo, un solo grupo alquilo C₁-C₆, un solo grupo alcoxi C₁-C₆ y un solo grupo N-[aminoalcanilo(C₁-C₆)]amino;

un grupo fenilo que tiene, en el grupo fenilo, un solo grupo alquilo C₁-C₆, un solo grupo alcoxi C₁-C₆ y un solo grupo N-[(N-alcanilo(C₁-C₆)aminoalcanilo(C₁-C₆)]amino;

un grupo fenilo que tiene, en el grupo fenilo, un solo grupo alcoxi C₁-C₆, un solo grupo alcanilo C₁-C₆ y un solo grupo piperazilo que tiene un solo grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo en el grupo piperazilo; o

un grupo fenilo que tiene, en el grupo fenilo, un solo grupo alcoxi C₁-C₆, un solo grupo hidroxialquilo C₁-C₆ y un solo grupo piperazilo que tiene un solo grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo en el grupo piperazilo.

9. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 8 seleccionado del grupo que consiste en :

(1) N-metil-4-[3-{4-(benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propoxi]-3-metoxi-5-metilnilina;

(2) 4-[3-{4-(Benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propoxi]-N,N-dimetil-3-metoxi-5-metilnilina;

(3) 4-[3-{4-(Benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propoxi]-N-(2,2-dimetoxietil)-3-metoxi-5-metilbenzamida;

(4) 1-(Benzo[b]tiofen-4-il)-4-[3-{2-metoxi-6-metil-4-(pirrolidin-1-il)fenoxi}propil]piperazina;

(5) 1-(Benzo[b]tiofen-4-il)-4-[3-{2-metoxi-6-metil-4-(piperidin-1-il)fenoxi}propil]piperazina;

(6) 1-Acetil-4-[3-{4-(Benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil]piperazina;

(7) 4-Acetil-1-[4-[3-{4-(benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil]piperazin-2-ona;

(8) 4-[4-[3-{4-(Benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil]-3-oxo-1-

metoxicarbonilpiperazina;

(9) N-(N-[4-[3-{4-(Benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil]carbamoilmetil)-carbamoilmetil-terc-butilo;

(10) 2-Amino-N-[4-[3-{4-(benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil]acetamida;

(11) 2-Acetilamino-N-[4-[3-{4-(benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil]acetamida;

(12) 4-[4-[3-{4-(Benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propoxi]-3-formil-5-metoxifenil]-1-metoxicarbonilpiperazina; y

(13) 4-[4-[3-{4-(Benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propoxi]-3-hidroximetil-5-metoxifenil]-1-metoxicarbonilpiperazina, o una de sus sales.

10. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto heterocíclico de la fórmula (1) o una de sus sales de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, como ingrediente activo y un portador farmacéuticamente aceptable.

11. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 10 para el tratamiento o la prevención de trastornos del sistema nervioso central.

12. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 11 para el tratamiento o la prevención de trastornos del sistema nervioso central seleccionados del grupo que consiste en esquizofrenia; esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; trastornos emocionales; trastornos psicóticos; trastornos del estado de ánimo; trastorno bipolar de tipo I; trastorno bipolar de tipo II; depresión; depresión endógena; depresión mayor; melancolía y depresión refractaria; trastorno distímico; trastorno ciclotímico; ataque de pánico; trastorno por pánico; agorafobia; fobia social; trastorno obsesivo-compulsivo; trastorno por estrés post-traumático; trastorno de ansiedad generalizado; trastorno de estrés agudo; histeria; trastorno de somatización; trastorno de conversión; trastorno por dolor; hipocondriasis; trastorno facticio; trastorno disociativo; disfunción sexual; trastorno del deseo sexual; trastorno de la excitación sexual; disfunción eréctil; anorexia nerviosa; bulimia nerviosa; trastorno del sueño; trastorno de

adaptación; abuso de alcohol; intoxicación alcohólica; adicción a fármacos; intoxicación con estimulantes; narcotismo; anhedonia; anhedonia iatrogénica; anhedonia de causa psíquica o mental; anhedonia asociada a depresión; anhedonia asociada a esquizofrenia; delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo asociado a la enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y otras enfermedades neurodegenerativas; deterioro cognitivo causado por enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de la esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; vómito; mareo por movimiento; obesidad; migraña; dolor; retraso mental; trastorno de autismo (autismo); síndrome de Tourette; trastornos de tics; trastorno por déficit de atención con hiperactividad; trastorno de la conducta; y síndrome de Down.

13. Un procedimiento para producir una composición farmacéutica que comprende mezclar un compuesto heterocíclico de la fórmula (1) o una de sus sales de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 con un portador farmacéuticamente aceptable.

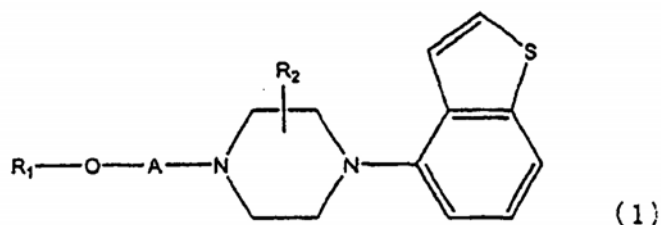
14. Un compuesto heterocíclico de la fórmula (1) o una de sus sales de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 para su uso como fármaco.

15. Un compuesto heterocíclico de la fórmula (1) o una de sus sales de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 para su uso como agonista parcial del receptor D_2 de dopamina y/o antagonista del receptor 5-HT_{2A} de y/o antagonista del receptor α_1 de adrenalina y/o inhibidor de la absorción de serotonina y/o inhibidor de la reabsorción de serotonina, eficaz para el tratamiento o la prevención de un trastorno del sistema nervioso central.

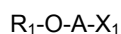
16. Un compuesto heterocíclico de fórmula (1) o una de sus sales de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 para su uso en el tratamiento o la prevención de un trastorno del sistema nervioso central.

17. El compuesto para su uso de acuerdo con la reivindicación 16, donde el trastorno del sistema nervioso central se selecciona del grupo que consiste en esquizofrenia; esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; trastornos emocionales; trastornos psicóticos; trastornos del estado de ánimo; trastorno bipolar de tipo I; trastorno bipolar de tipo II; depresión; depresión endógena; depresión mayor; melancolía y depresión refractaria; trastorno distímico; trastorno ciclotímico; ataque de pánico; trastorno por pánico; agorafobia; fobia social; trastorno obsesivo-compulsivo; trastorno por estrés post-traumático; trastorno de ansiedad generalizado; trastorno de estrés agudo; histeria; trastorno de somatización; trastorno de conversión; trastorno por dolor; hipocondriasis; trastorno facticio; trastorno disociativo; disfunción sexual; trastorno del deseo sexual; trastorno de la excitación sexual; disfunción eréctil; anorexia nerviosa; bulimia nerviosa; trastorno del sueño; trastorno de adaptación; abuso de alcohol; intoxicación alcohólica; adicción a fármacos; intoxicación con estimulantes; narcotismo; anhedonia; anhedonia iatrogénica; anhedonia de causa psíquica o mental; anhedonia asociada a depresión; anhedonia asociada a esquizofrenia; delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo asociado a la enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y otras enfermedades neurodegenerativas; deterioro cognitivo causado por enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de la esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; vómito; mareo por movimiento; obesidad; migraña; dolor; retraso mental; trastorno de autismo (autismo); síndrome de Tourette; trastornos de tics; trastorno por déficit de atención con hiperactividad; trastorno de la conducta; y síndrome de Down.

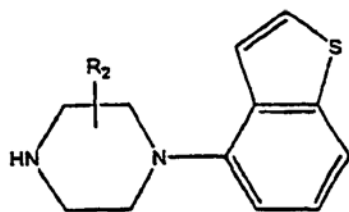
18. Un procedimiento para producir un compuesto heterocíclico representado por la fórmula (1):



[donde R_1 , R_2 y A son los mismos que se han definido en la reivindicación 1] o una de sus sales, **caracterizado porque** comprende una reacción de un compuesto representado por la fórmula:



[donde R_1 y A son los mismos que se han definido antes, y X_1 representa un átomo de halógeno o un grupo que ocasiona una reacción de sustitución igual que en un átomo de halógeno] o una de sus sales con un compuesto representado por la fórmula



[donde R_2 es el mismo que se ha definido antes] o una de sus sales.