

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 369 837**

51 Int. Cl.:
C07D 487/04 (2006.01)
A61P 1/00 (2006.01)
A61P 3/00 (2006.01)
A61P 5/00 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 491/14 (2006.01)
C07D 495/14 (2006.01)
A61K 31/435 (2006.01)
A61K 31/495 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **07111569 .5**
96 Fecha de presentación: **27.12.2001**
97 Número de publicación de la solicitud: **1832590**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **12.09.2007**

54 Título: **COMPUESTOS TRIHETEROCÍCLICOS COMO ANTAGONISTAS DE RECEPTOR CFR.**

30 Prioridad:
28.12.2000 JP 2004002517

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
07.12.2011

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
07.12.2011

73 Titular/es:
ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.
1-5, DOSHOMACHI 2-CHOME, CHUO-KU
OSAKA-SHI, OSAKA 541-8526, JP

72 Inventor/es:
Nakai, HisaoOno y
Kagamiishi, YoshifumiOno

74 Agente: **Miltenyi null, Peter**

ES 2 369 837 T3

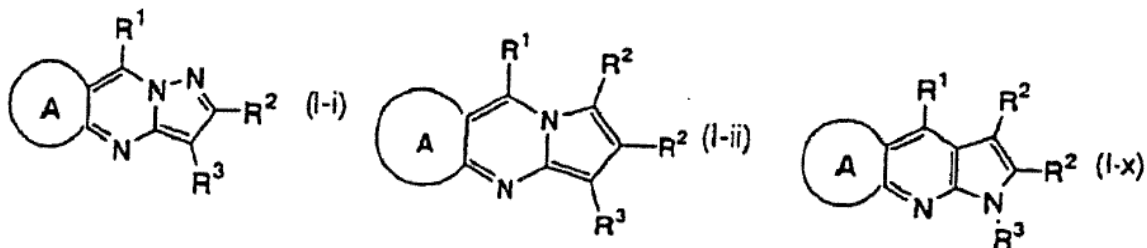
Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar 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

Compuestos triheterocíclicos como antagonistas de receptor CFR

Campo técnico

La presente invención se refiere a compuestos triheterocíclicos de fórmulas (I-i), (I-ii) o (I-x)



5

en las que todos los símbolos son tal como se definen a continuación en el presente documento; que son útiles como producto farmacéutico, y a un producto farmacéutico que los comprende como principio activo.

Antecedentes

10 El factor de liberación de corticotropina (CRF) es un péptido que comprende 41 residuos de aminoácido y se aisló a partir de hipotálamo ovino en 1981. Se sugirió que el CRF se libera por el hipotálamo y controla una secreción de hormona adrenocorticotrópica (ACTH) de la hipófisis [Science, 218, 377-379(1982)].

15 Se empieza un efecto biológico desde que el CRF se une al receptor CRF, que existe en la superficie membranosa de la célula productora de ACTH en la adenohipófisis. Se han identificado dos subtipos de receptores CRF, y cada uno de estos se distribuye en una zona diferente del cerebro. Por ejemplo, mucho receptor 1 está distribuido en la hipófisis, el hipotálamo, la corteza cerebral y mucho receptor 2 está distribuido en el tabique del cerebro, el núcleo paraventricular del hipotálamo. Además, los receptores están distribuidos también en órganos periféricos, por ejemplo, corazón, tracto gastrointestinal, pulmón, glándula adrenal, bazo, hígado, riñón, glándula prostática. De manera concreta, el receptor 1 existe en el intestino o bazo, receptor 2 existe en el estómago y especialmente el receptor 2β existe en el corazón y músculo esquelético.

20 La ACTH, que se libera mediante una estimulación de CRF, estimula una secreción de cortisol de la corteza adrenal y se refiere a una acción sistémica para la reproducción, crecimiento, función gastrointestinal, inflamación, sistema inmunitario, sistema nervioso, etc. En consecuencia, se cree que el CRF desempeña un papel como regulador de estas funciones.

25 Se ha notificado que en cerebros de pacientes con depresión y trastornos de ansiedad se secretó un exceso de CRF [Science, 226, 1342-1343 (1984); Neuroscience and Behavioral Reviews, 22, 635-651 (1998); J. Endocrinol, 160, 1-12 (1999)].

30 Además, se ha notificado una relación del CRF y diversos trastornos, por ejemplo, trastorno alimenticio [Science, 273, 1561-1564 (1996)], inflamación [Endocrinology, 137, 5747-5750 (1996)], síndrome del intestino irritable [Am. J. Physiol, 253, G582-G586 (1987)], drogodependencia [Psychopharmacology 137, 184-190 (1998)] e isquemia [Soc Neurosci Abstr (4-9 de Nov, Nueva Orleans), 807.5 (2000)].

Por otro lado, el CRF tiene una participación íntima en el estrés. Por ejemplo, la administración de CRF al cerebro provocó el mismo comportamiento y respuesta endocrina que un animal en condiciones estresantes [Nature, 297, 331 (1982)].

35 Tal como se menciona anteriormente, atrae atención una relación del CRF y un trastorno del sistema nervioso central, trastorno neuropsiquiátrico o un trastorno de órgano periférico.

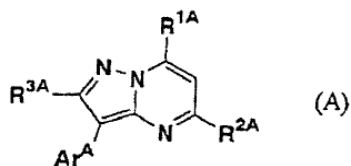
40 Por consiguiente, se considera útil un antagonismo del receptor CRF para una enfermedad por secreción anómala de CRF, por ejemplo, diversas enfermedades que comprenden trastornos relacionados con el estrés. Por ejemplo, se cree que es útil para la prevención y/o el tratamiento de depresión, depresión de episodio único, depresión recurrente, depresión puerperal, depresión inducida por abusos a menores, ansiedad, trastornos relacionados con la ansiedad (trastorno de pánico, fobia particular, miedo a caer, fobia social, trastorno obsesivo compulsivo), trastorno emocional, trastorno bipolar, trastorno de estrés postraumático, úlcera péptica, diarrea, estreñimiento, síndrome del intestino irritable, enfermedad inflamatoria del intestino (colitis ulcerosa, enfermedad de Crohn), alteración gastrointestinal inducida por estrés, vómito nervioso, trastorno alimenticio (por ejemplo, anorexia nerviosa, bulimia nerviosa), obesidad, trastorno del sueño inducido por estrés, trastorno del sueño inducido por dolor de fibra muscular, inmunosupresión inducida por estrés, cefalea inducida por estrés, fiebre inducida por estrés, dolor

45

inducido por estrés, estrés posoperatorio, artritis reumatoide, osteoartritis, osteoporosis, psoriasis, disfunción tiroidea, uveítis, asma, trastorno inducido por hormona antidiarreica inapropiada, dolor, inflamación, enfermedad alérgica, lesión de la cabeza, lesión de la médula espinal, lesión neuronal isquémica, lesión neuronal por toxicidad, enfermedad de Cushing, convulsiones, espasmos, espasmos musculares, epilepsia, enfermedad isquémica, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Huntington, incontinencia urinaria, enfermedad de Alzheimer, demencia senil tipo Alzheimer, demencia vascular, esclerosis lateral amiotrófica, hipoglucemia, enfermedades relacionadas con el corazón o cardiovasculares (hipertensión, taquicardia, insuficiencia cardiaca congestiva), drogadicción o síndrome de dependencia al alcohol.

Por otro lado, se conocen los siguientes compuestos que tienen una actividad antagonista al CRF.

- 10 (1) En la memoria descriptiva del documento WO 97/29109, un compuesto de fórmula (A)



en la que R^{1A} es $NR^{4A}R^{5A}$ u OR^{5A} ;

R^{2A} es alquilo, alquioxilo, alquiltio;

R^{3A} es H, alquilo, alquilsulfonilo, alquilsufoxi o alquiltio;

- 15 R^{4A} es H, alquilo, mono o di(cicloalquil)metilo, cicloalquilo, alquenilo, hidroxialquilo, alquilcarboniloxialquilo o alquioxialquilo;

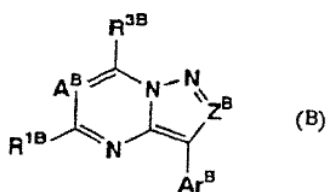
R^{5A} es alquilo, mono o di(cicloalquil)metilo, $Ar^{1A}-CH_2$, alquenilo, alquioxialquilo, hidroxialquilo, tienilmetilo, furanilmetilo, alquiltioalquilo, morfolinilo, etc.;

- 20 o R^{4A} y R^{5A} tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un pirrolidinilo, piperidinilo, homopiperidinilo o morfolinilo, opcionalmente sustituido con alquilo, alquioxialquilo;

Ar^A es fenilo, fenilo sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente de halo, alquilo, trifluorometilo, hidroxilo, etc.; piridinilo, piridinilo sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente de halo, alquilo, trifluorometilo, hidroxilo;

se describió como antagonista del receptor CRF.

- 25 (2) En la memoria descriptiva del documento WO 98/03510, un compuesto de fórmula (B)



en la que A^B es N o CR^B ;

Z^B es N o CR^{2B} ;

- 30 Ar^B se selecciona de fenilo, naftilo, piridilo, pirimidinilo, triazinilo, furanilo, tienilo, benzotienilo, benzofuranilo, etc., cada Ar^B opcionalmente sustituido con de 1 a 5 R^{4B} ;

R^B es H, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, halo, ciano o haloalquilo;

R^{1B} es H, alquilo, alquenilo, alquinilo, halo, ciano o haloalquilo, hidroxialquilo, etc.;

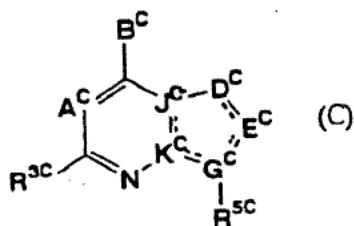
R^{2B} es H, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, hidroxialquilo, etc.;

- 35 R^{3B} es H, OR^{7B} , SH, $S(O)_nR^{13B}$, COR^{7B} , CO_2R^{7B} , $OC(O)R^{13B}$, $NR^{8B}COR^{7B}$, $N(COR^{7B})_2$, $NR^{8B}CONR^{6B}R^{7B}$, $NR^{8B}CO_2R^{13B}$, $NR^{6B}R^{7B}$, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, etc.;

R^{4B} es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, NO_2 , halo, ciano, haloalquilo, $NR^{6B}R^{7B}$, $NR^{8B}COR^{7B}$, etc.;

se describió como antagonista del receptor CRF.

(3) En la memoria descriptiva del documento WO 98/08847, un compuesto de fórmula (C)



en la que las líneas discontinuas son dobles enlaces opcionales;

5 A^C es nitrógeno o CR^{7C} ;

B^C es $NR^{1C}R^{2C}$, $CR^{1C}R^{2C}R^{10C}$, $C(=CR^{2C}R^{11C})R^{1C}$, $NHCR^{1C}R^{2C}R^{10C}$, $OCR^{1C}R^{2C}R^{10C}$, $SCR^{1C}R^{2C}R^{10C}$, $CR^{2C}R^{10C}NHR^{1C}$, $CR^{2C}R^{10C}OR^{1C}$, $CR^{2C}R^{10C}SR^{1C}$ o COR^{2C} ;

J^C y K^C son cada uno independientemente nitrógeno o carbono y ambos no son nitrógenos;

10 D^C y E^C se seleccionan cada uno, independientemente, de nitrógeno, CR^{4C} , $C=O$, $C=S$, azufre, oxígeno, $CR^{4C}R^{6C}$ y NR^{8C} ;

G^C es nitrógeno o carbono;

El anillo que contiene D^C , E^C , G^C , K^C y J^C puede ser un anillo de 5 miembros saturado o insaturado y opcionalmente sustituido con uno o dos dobles enlaces y puede contener opcionalmente de uno a tres heteroátomos en el anillo y puede tener opcionalmente uno o dos $C=O$ o $C=S$;

15 R^{1C} es alquilo opcionalmente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente de hidroxilo, fluoro, cloro, bromo, yodo, O-alquilo, CF_3 , $C(=O)O$ -alquilo, $OC(=O)$ alquilo, etc.;

R^{2C} es alquilo, que puede contener opcionalmente desde uno hasta tres dobles o triples enlaces, arilo o arilalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, etc.;

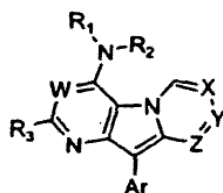
R^{3C} es H, alquilo, O-alquilo, cloro, fluoro, bromo, yodo, alquilen-O-alquilo, alquilen-OH o S-alquilo;

20 R^{4C} es H, alquilo, fluoro, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, amino, alquilen-OH, CF_3 , etc.;

R^{5C} es fenilo, piridilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo y cada grupo está sustituido con desde uno hasta cuatro sustituyentes R^{13C} , en los que de uno a tres de dichos sustituyentes pueden seleccionarse, independientemente, de fluoro, cloro, alquilo y O-alquilo, y uno de dichos sustituyentes puede seleccionarse de bromo, yodo, formilo, OH, alquilen-OH, alquilen-O-alquilo, ciano, CF_3 , nitro, amino, alquilamino, dialquilamino, etc.;

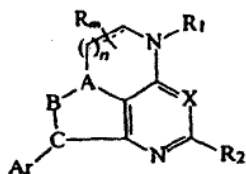
25 se describió como antagonista del receptor CRF.

El documento WO 99/64422 da a conocer derivados de pirido[2,3-b]indolizina y sus análogos aza de la siguiente fórmula:



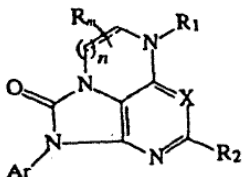
30 en la que Ar, R_1 , R_2 , R_3 , W, X, Y y Z son sustituyentes tal como se definen en el documento WO 99/64422, compuestos que son antagonistas o agonistas parciales altamente selectivos en los receptores CRF_1 humanos y son útiles en el diagnóstico y el tratamiento de trastornos relacionados con el estrés tales como trastorno de estrés postraumático (PTSD) así como depresión, cefalea y ansiedad.

El documento WO 00/27846 da a conocer antagonistas de los receptores CRF de la siguiente fórmula:



que tienen utilidad en el tratamiento de una variedad de trastornos, incluyendo el tratamiento de trastornos que manifiestan hipersecreción de CRF en animales de sangre caliente, tal como accidente cerebrovascular.

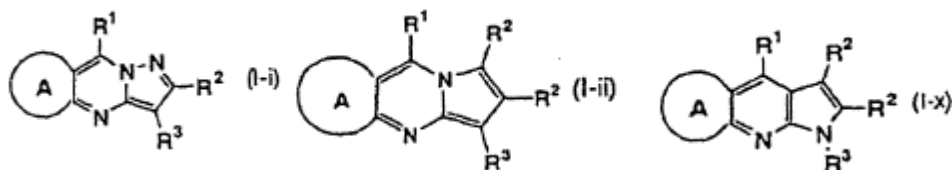
El documento WO 00/27850 da a conocer antagonistas de los receptores CRF de la siguiente fórmula:



5 que tienen utilidad en el tratamiento de una variedad de trastornos, incluyendo el tratamiento de trastornos que manifiestan hipersecreción de CRF en animales de sangre caliente, incluyendo accidente cerebrovascular.

Descripción de la invención

10 La presente invención se refiere a compuestos triheterocíclicos. Más particularmente, esta invención se refiere a compuestos de fórmulas (I-i), (I-ii) o (I-x)



en las que

R² es

- (i) hidrógeno,
- 15 (ii) alquilo C1-8,
- (iii) alqueno C2-8,
- (iv) alquino C2-8,
- (v) átomo de halógeno,
- (vi) CF₃
- 20 (vii) ciano,
- (viii) nitro,
- (ix) NR⁹R¹⁰ en el que R⁹ y R¹⁰ son cada uno independientemente,
 - (i) hidrógeno,
 - (ii) alquilo C1-4,
 - 25 (iii) anillo mono o bicarbocíclico C3-10,
 - (iv) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) o
 - (v) alquilo C1-4 sustituido con anillo mono o bicarbocíclico C3-10 o anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s),

(x) OR¹¹ en el que R¹¹ es

(i) hidrógeno,

(ii) alquilo C1-4,

(iii) anillo carbocíclico C5-6,

5 (iv) anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre o

(v) alquilo C1-4 sustituido con anillo carbocíclico C5-6 o anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre,

(xi) SH,

(xii) S(O)_nR¹² en el que n es 0, 1 ó 2, R¹² es

10 (i) alquilo C1-4,

(ii) anillo carbocíclico C5-6,

(iii) anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre o

(iv) alquilo C1-4 sustituido con anillo carbocíclico C5-6 o anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre,

15 (xiii) COR¹¹,

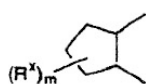
(xiv) COOR¹¹,

(xv) CONR⁹R¹⁰,

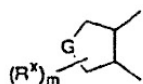
(xvi) anillo mono o bicarbocíclico C3-10,

20 (xvii) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene de 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) o

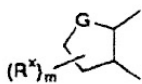
(xviii) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁹R¹⁰, OR¹¹, =N-OR¹¹, SH, S(O)_nR¹², COR¹¹, COOR¹¹, CONR⁹R¹⁰, anillo mono o bicarbocíclico C3-10 y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s),



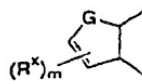
(A-1)



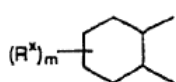
(A-2)



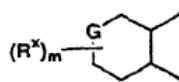
(A-3)



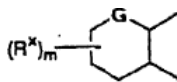
(A-4)



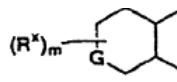
(A-5)



(A-6)



(A-7)



(A-8)

25

en los que G es O, S o NH; R^x es alquilo C1-4, alcoxilo C1-4, átomo de halógeno o CF₃; m es 0-3,

R¹ es

(i) alquilo C1-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁴,

(ii) alqueno C2-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁴,

30 (iii) alquino C2-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁴,

(iv) NR⁴R⁵ en el que R⁴ y R⁵ son cada uno independientemente,

(i) hidrógeno,

- (ii) alquilo C1-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁷,
- (iii) alqueno C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁷,
- (iv) alquino C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁷,
- (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
- 5 (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸.
- (v) OR⁶ en el que R⁶ es
- (i) hidrógeno,
- (ii) alquilo C1-10,
- 10 (iii) alqueno C2-10,
- (iv) alquino C2-10,
- (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
- (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
- 15 (vii) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁹R¹⁰, OR¹¹, =N-OR¹¹, SH, S(O)nR¹², COR¹¹, COOR¹¹, CONR⁹R¹⁰, anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸ y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸.
- 20 (vi) SH,
- (vii) S(O)nR⁷ en el que n es tal como se definió anteriormente en el presente documento, R⁷ es
- (i) alquilo C1-8,
- (ii) anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
- 25 (iii) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene de 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
- (iv) alquilo C1-4 sustituido con anillo mono o bicarbocíclico C3-10, que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸ o anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufres que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
- (viii) COR⁶,
- 30 (ix) COOR⁶,
- (x) CONR⁴R⁵,
- (xi) NR⁸COR^{6a} en el que R^{6a} es
- (i) hidrógeno,
- (ii) alquilo C1-10,
- 35 (iii) alqueno C2-10,
- (iv) alquino C2-10 o
- (v) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁹R¹⁰, OR^{11a}, =N-OR¹¹, SH, S(O)nR¹², COR¹¹, COOR¹¹ y CONR⁹R¹⁰,
- (xii) NR⁸COOR⁶ en el que R⁶ es tal como se definió anteriormente en el presente documento, R⁸ es
- 40 (i) hidrógeno,
- (ii) alquilo C1-8,

- (iii) alqueno C2-8,
 (iv) alqueno C2-8,
 (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
 5 (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸ o
 (vii) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁹R¹⁰, OR¹¹, =N-OR¹¹, SH, S(O)_nR¹², COR¹¹, COOR¹¹, CONR⁹R¹⁰, anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸ y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que está sustituido o no sustituido con 1-5 R¹⁸,
- 10 (xiii) NR³CONR⁴R⁵,
 (xiv) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁵
 o
 (xv) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁵,
- 15 R^{11a} es (i) hidrógeno, (ii) alquilo C1-4 o (iii) alquilo C1-4 sustituido con anillo carbocíclico C5-6 o anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre,
 R¹⁴ es (a) átomo de halógeno, (b) CF₃, (c) OCF₃, (d) ciano, (e) nitro, (f) NR⁴R⁵, (g) OR⁶, (h) =N-OR⁶, (j) SH, (k) S(O)_nR⁷, (l) COR⁶, (m) COOR⁶, (n) CONR⁴R⁵, (o) NR⁸COR⁶, (p) NR⁸COOR⁶, (q) NR⁸CONR⁴R⁵, (r) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁵ o (s) anillo mono o biheterocíclico C3-15 que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que está sustituido o no sustituido con 1-5 R¹⁵,
- 20 R¹⁵ es (a) alquilo C1-8, (b) alqueno C2-8, (c) alqueno C2-8, (d) alcoxi C1-4-alquilo (C1-4), (e) átomo de halógeno, (f) CF₃, (g) OCF₃, (h) ciano, (j) nitro, (k) NR⁴R⁵, (l) OR⁶, (m) SH, (n) S(O)_nR⁷, (o) COR⁶, (p) COOR⁶, (q) CONR⁴R⁵, (r) NR⁸COR⁶, (s) NR⁸COOR⁶, (t) NR⁸CONR⁴R⁵, (u) anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R²⁰, (v) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R²⁰ o (w) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁴R⁵, OR⁶, =N-OR⁶, SH, S(O)_nR⁷, COR⁶, COOR⁶, CONR⁴R⁵, NR⁸COR⁶, NR⁸COOR⁶, NR⁸CONR⁴R⁵, anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R²⁰ y anillo mono o biheterocíclico de 3 a 10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R²⁰, R¹⁷ es (a) átomo de halógeno, (b) CF₃, (c) OCF₃, (d) ciano, (e) nitro, (f) NR⁹R¹⁰, (g) OR^{11a}, (h) =N-OR¹¹, (j) SH, (k) S(O)_nR¹², (l) COR¹¹, (m) COOR¹¹, (n) CONR⁹R¹⁰, (o) NR⁸COR¹¹, (p) NR⁸COOR¹¹, (q) NR⁸CONR⁹R¹⁰, (r) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18a} o (s) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18a},
- 25 R¹⁸ es (a) alquilo C1-4, (b) alqueno C2-4, (c) alqueno C2-4, (d) átomo de halógeno, (e) CF₃, (f) OCF₃, (g) ciano, (h) nitro, (j) SH, (k) S(O)_nR¹², (l) NR⁹R¹⁰, (m) OR¹¹, (n) COR¹¹, (o) COOR¹¹, (p) CONR⁹R¹⁰, (q) anillo carbocíclico C5-6, (r) anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre o (s) alquilo C1-4 sustituido con anillo carbocíclico C5-6 o anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre,
- 30 R^{18a} es (a) alquilo C1-4, (b) alqueno C2-4, (c) alqueno C2-4, (d) átomo de halógeno, (e) CF₃, (f) OCF₃, (g) ciano, (h) nitro, (j) SH, (k) S(O)_nR¹², (l) NR⁹R¹⁰, (m) OR^{11a}, (n) COR¹¹, (o) COOR¹¹ o (p) CONR⁹R¹⁰,
 R²⁰ es alquilo C1-4, alcoxi C1-4, átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, amina, NH(alquilo C1-4) o N(alquilo C1-4)₂
 R³ es (i) anillo mono bicarbocíclico C5-10 sustituido con 1-5 R¹⁶ o
 (ii) anillo mono o biheterocíclico de 5 a 10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) sustituido con 1-5 R¹⁶,
- 45 R¹⁶ es (a) alquilo C1-8,
 (b) alqueno C2-8,
 (c) alqueno C2-8,
 (d) átomo de halógeno,

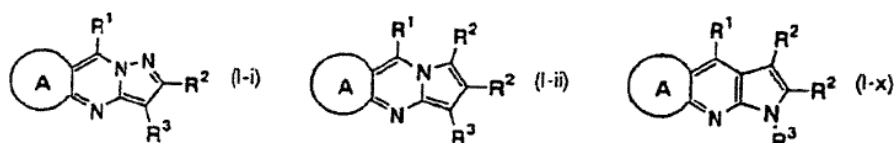
- (e) CF₃,
- (f) OCF₃,
- (g) ciano,
- (h) nitro,
- 5 (j) NR⁹R¹⁰,
- (k) OR¹¹,
- (l) SH,
- (m) S(O)_nR¹², con la excepción de feniltio,
- (n) COR¹¹,
- 10 (o) COOR¹¹,
- (p) CONR⁹R¹⁰,
- (q) NR⁸COR¹¹,
- (r) NR⁸COOR¹¹,
- (s) NR⁸CONR⁹R¹⁰,
- 15 (t) anillo mono o bicarbocíclico C3-10,
- (u) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s)
- (v) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁹R¹⁰, OR¹¹, =N-OR¹¹, SH, S(O)_nR¹², COR¹¹, COOR¹¹, CONR⁹R¹⁰, NR⁸COR¹¹, NR⁸COOR¹¹, NR⁸CONR⁹R¹⁰, anillo mono o bicarbocíclico C3-10 y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s).
- 20 con la condición de que cuando R¹ en la fórmula (I-i) es OR⁶, entonces R³ no es fenilo sustituido con 1 átomo de halógeno, fenilo sustituido con 1 trifluorometilo y fenilo sustituido con trifluorometilo y nitro, una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo, con la condición de que el compuesto 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina esté excluido;
- 25 (2) un procedimiento para la preparación de los mismos y
- (3) una composición farmacéutica que los comprende como antagonista del receptor CRF.
- En la memoria descriptiva, alquilo C1-4 significa metilo, etilo, propilo, butilo y grupos isoméricos de los mismos.
- En la memoria descriptiva, alquilo C1-8 significa metilo, etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo, heptilo, octilo y grupos isoméricos de los mismos.
- 30 En la memoria descriptiva, alquilo C1-15 significa metilo, etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo, heptilo, octilo, nonilo, decilo, undecilo, dodecilo, tridecilo, tetradecilo, pentadecilo y grupos isoméricos de los mismos.
- En la memoria descriptiva, alcoxilo C1-4 significa metoxilo, etoxilo, propoxilo, butoxilo y grupos isoméricos de los mismos.
- En la memoria descriptiva, alqueno C2-4 significa vinilo, propenilo, butenilo y grupos isoméricos de los mismos.
- 35 En la memoria descriptiva, alqueno C2-8 significa etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo, heptilo, octilo que tienen 1 doble enlace y grupos isoméricos de los mismos. Por ejemplo, vinilo, propenilo, butenilo, pentenilo, hexenilo, heptenilo, octenilo.
- En la memoria descriptiva, alqueno C2-15 significa etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo, heptilo, octilo, nonilo, decilo, undecilo, dodecilo, tridecilo, tetradecilo, pentadecilo que tienen 1 doble enlace y grupos isoméricos de los mismos.
- 40 Por ejemplo, vinilo, propenilo, butenilo, pentenilo, hexenilo, heptenilo, octenilo, nonenilo, decenilo, undecenilo, dodecenilo, tridecenilo, tetradecenilo, pentadecenilo.
- En la memoria descriptiva alquino C2-4 significa etinilo, propinilo, butinilo y grupos isoméricos de los mismos.

- En la memoria descriptiva, alquino C2-8 significa etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo, heptilo, octilo que tienen 1 triple enlace y grupos isoméricos de los mismos. Por ejemplo, etino, propino, butino, pentino, hexino, heptino, octino.
- 5 En la memoria descriptiva, alquino C2-15 significa etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo, heptilo, octilo, nonilo, decilo, undecilo, dodecilo, tridecilo, tetradecilo, pentadecilo que tienen 1 triple enlace y grupos isoméricos de los mismos. Por ejemplo, etino, propino, butino, pentino, hexino, heptino, octino, nonino, decino, undecino, dodecino, tridecino, tetradecino, pentadecino.
- En la memoria descriptiva, átomo de halógeno es flúor, cloro, bromo y yodo.
- 10 En la memoria descriptiva, alcoxi C1-4-alquilo (C1-4) significa metilo, etilo, propilo, butilo y grupos isoméricos de los mismos sustituidos con uno de metoxilo, etoxilo, propoxilo, butoxilo y grupos isoméricos de los mismos.
- En la memoria descriptiva, anillo carbocíclico C4-6 es arilo carbocíclico C4-6 o completa o parcialmente saturado del mismo. Por ejemplo, ciclobutano, ciclopentano, ciclohexano, ciclopenteno, ciclohexeno, ciclopentadieno, ciclohexadieno, benceno.
- 15 En la memoria descriptiva, anillo carbocíclico C5-6 es arilo carbocíclico C5-6 o completa o parcialmente saturado del mismo. Por ejemplo, ciclopentano, ciclohexano, ciclopenteno, ciclohexeno, ciclopentadieno, ciclohexadieno, benceno.
- En la memoria descriptiva, anillo mono o bicarbocíclico C3-10 es arilo mono o bicarbocíclico C3-10 o completa o parcialmente saturado del mismo. Por ejemplo, ciclopropano, ciclobutano, ciclopentano, ciclohexano, cicloheptano, ciclopenteno, ciclohexeno, ciclopentadieno, ciclohexadieno, benceno, pentaleno, indeno, naftaleno, azuleno, perhidropentaleno, indano, perhidroindeno, tetrahidronaftaleno, perhidronaftaleno, perhidroazuleno.
- 20 En la memoria descriptiva, anillo mono o bicarbocíclico C3-15 es arilo mono o bicarbocíclico C3-15 o completa o parcialmente saturado del mismo o anillo bicarbocíclico con puente. Por ejemplo, ciclopropano, ciclobutano, ciclopentano, ciclohexano, cicloheptano, ciclopenteno, ciclohexeno, ciclopentadieno, ciclohexadieno, benceno, pentaleno, indeno, naftaleno, azuleno, heptaleno, perhidropentaleno, indano, perhidroindeno, tetrahidronaftaleno, perhidronaftaleno, perhidroazuleno, perhidroheptaleno, biciclo[3,1,1]heptano.
- 25 En la memoria descriptiva, anillo mono o bicarbocíclico C5-10 es arilo mono o bicarbocíclico C5-10 o completa o parcialmente saturado del mismo. Por ejemplo, ciclopentano, ciclohexano, cicloheptano, ciclopenteno, ciclohexeno, ciclohepteno, ciclopentadieno, ciclohexadieno, cicloheptadieno, benceno, pentaleno, indeno, naftaleno, azuleno, perhidropentaleno, indano, perhidroindeno, tetrahidronaftaleno, perhidronaftaleno, perhidroazuleno.
- 30 En la memoria descriptiva, anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene al menos un nitrógeno, oxígeno y azufre es arilo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene al menos un nitrógeno, oxígeno y azufre o completa o parcialmente saturado del mismo. Por ejemplo, azetidina, pirrolidina, pirrolina, pirrol, tetrahydrofurano, dihydrofurano, furano, tetrahydrotiofeno, dihydrotiofeno, tiofeno, piperidina, dihidropiridina, piridina, tetrahydropirano, dihydropirano, pirano, tetrahydrotiopirano, dihydrotiopirano, tiopirano.
- 35 En la memoria descriptiva, anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre es arilo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre o completa o parcialmente saturado del mismo. Por ejemplo, pirrol, imidazol, pirazol, piridina, pirazina, pirimidina, piridazina, furano, pirano, tiofeno, tiaina (tiopirano), oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, pirrolina, pirrolidina, piperidina, imidazolina, imidazolidina, pirazolina, pirazolidina, piperazina, perhidropirimidina, perhidropiridazina, dihydrofurano, tetrahydrofurano, tetrahydropirano, dihydrotiofeno, tetrahydrotiofeno, tetrahydrotiaina, morfolina, tiomorfolina.
- 40 En la memoria descriptiva, anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) es arilo mono biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) o completa o parcialmente saturado del mismo. Un arilo mono biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) es, por ejemplo, pirrol, imidazol, pirazol, triazol, tetrazol, piridina, pirazina, pirimidina, piridazina, azequina, diazequina, furano, pirano, oxepina, tiofeno, tiaina (tiopirano), tiepina, oxazol, isoxazol, oxadiazol, oxazina, oxadiazina, oxazepina, oxadiazepina, tiazol, isotiazol, tiadiazol, tiazina, tiadiacina, tiazepina, tiadiazepina, indol, isoindol, indolizina, benzofurano, isobenzofurano, benzotiofeno, isobenzotiofeno, indazol, quinolina, isoquinolina, quinolizina, ftalazina, naftiridina, quinoxalina, quinazolina, cinnolina, benzoxazol, benzoxadiazol, benzotiazol, bencimidazol, benzofurazano, benzotiadiazol, benzotriazol.
- 45 En la memoria descriptiva, anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) es arilo mono biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) o completa o parcialmente saturado del mismo. Un arilo mono biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) es, por ejemplo, pirrol, imidazol, pirazol, triazol, tetrazol, piridina, pirazina, pirimidina, piridazina, azequina, diazequina, furano, pirano, oxepina, tiofeno, tiaina (tiopirano), tiepina, oxazol, isoxazol, oxadiazol, oxazina, oxadiazina, oxazepina, oxadiazepina, tiazol, isotiazol, tiadiazol, tiazina, tiadiacina, tiazepina, tiadiazepina, indol, isoindol, indolizina, benzofurano, isobenzofurano, benzotiofeno, isobenzotiofeno, indazol, quinolina, isoquinolina, quinolizina, ftalazina, naftiridina, quinoxalina, quinazolina, cinnolina, benzoxazol, benzoxadiazol, benzotiazol, bencimidazol, benzofurazano, benzotiadiazol, benzotriazol.
- 50 El arilo mono biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) completa o parcialmente saturado mencionado anteriormente es, por ejemplo, aziridina, azetina, azetidina, pirrolina, pirrolidina, imidazolina, imidazolidina, pirazolina, pirazolidina, triazolina, triazolidina, tetrazolina, tetrazolidina, piperidina, piperazina, dihidropiridina, tetrahydropiridina, dihydropirazina, tetrahydropirazina, dihydropirimidina, tetrahydropirimidina, perhidropirimidina, dihydropirimidina, dihydropiridazina, tetrahydropiridazina, perhidropiridazina, dihydroazepina,
- 55

- 5 tetrahidroazepina, perhidroazepina, dihidrodiazepina, tetrahidrodiazepina, perhidrodiazepina, oxirano, oxetano, dihidrofurano, tetrahidrofurano, dihidropirano, tetrahidropirano, dihidrooxepina, tetrahidrooxepina, perhidrooxepina, tiirano, tietano, dihidrotiofeno, tetrahidrotiofeno, dihidrotiaína (dihidrotiopirano), tetrahidrotiaína (tetrahidrotiopirano), dihidrotiepina, tetrahidrotiepina, perhidrotiepina, oxazolina (dihidrooxazol), oxazolidina (tetrahidrooxazol), dihidroisoxazol, tetrahidroisoxazol, oxadiazolina (dihidrooxadiazol), oxadiazolidina (tetrahidrooxadiazol), tiazolina (dihidrotiazol), tiazolidina (tetrahidrotiazol), dihidroisotiazol, tetrahidroisotiazol, morfolina, tiomorfolina, indolina, isoindolina, dihidrobenzofurano, perhidrobenzofurano, dihidroisobenzofurano, perhidroisobenzofurano, dihidrobenzotiofeno, perhidrobenzotiofeno, dihidroisobenzotiofeno, perhidroisobenzotiofeno, dihidroindazol, perhidroindazol, dihidroquinolina, tetrahidroquinolina, perhidroquinolina, dihidroisoquinolina, tetrahidroisoquinolina, perhidroisoquinolina, dihidroftalazina, tetrahidroftalazina, perhidroftalazina, dihidronaftiridina, tetrahidronaftiridina, perhidronaftiridina, dihidroquinoxalina, tetrahidroquinoxalina, perhidroquinoxalina, dihidroquinazolina, tetrahidroquinazolina, perhidroquinazolina, dihidrocinnolina, tetrahidrocinnolina, perhidrocinnolina, dihidrobenzoxazol, perhidrobenzoxazol, dihidrobenzotiazol, perhidrobenzotiazol, dihidrobencimidazol, perhidrobencimidazol, dioxolano, dioxano, dioxazina, dioxaindano, cromano, isocromano.
- 10
- 15 En la memoria descriptiva, anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) es arilo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) o completa o parcialmente saturado del mismo. Un arilo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) es, por ejemplo, pirrol, imidazol, pirazol, triazol, tetrazol, piridina, pirazina, pirimidina, piridazina, azepina, diazepina, furano, pirano, oxepina, tiofeno, tiaína (tiopirano), tiepina, oxazol, isoxazol, oxadiazol, oxazina, oxadiazina, oxazepina, oxadiazepina, tiazol, isotiazol, tiadiazol, tiazina, tiadiacina, tiazepina, tiadiazepina, indol, isoindol, indolizina, benzofurano, isobenzofurano, benzotiofeno, isobenzotiofeno, indazol, quinolina, isoquinolina, quinolizina, ftalazina, naftiridina, quinoxalina, quinazolina, cinnolina, benzoxazol, benzoxadiazol, benzotiazol, bencimidazol, benzazepina, benzodiazepina, benzotriazol, benzoxazepina, benzoxadiazepina, benzotiazepina, benzotiadiazol, benzotiadiazepina, benzofurazano.
- 20
- 25 El arilo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) completa o parcialmente saturado es, por ejemplo, aziridina, azetina, azetidina, pirrolina, pirrolidina, imidazolina, imidazolidina, pirazolina, pirazolidina, triazolina, triazolidina, tetrazolina, tetrazolidina, piperidina, piperazina, dihidropiridina, tetrahidropiridina, dihidropirazina, tetrahidropirazina, dihidropirimidina, tetrahidropirimidina, perhidropirimidina, dihidropiridazina, tetrahidropiridazina, perhidropiridazina, dihidroazepina, tetrahidroazepina, perhidroazepina, dihidrodiazepina, tetrahidrodiazepina, perhidrodiazepina, oxirano, oxetano, dihidrofurano, tetrahidrofurano, dihidropirano, tetrahidropirano, dihidrooxepina, tetrahidrooxepina, perhidrooxepina, tiirano, tietano, dihidrotiofeno, tetrahidrotiofeno, dihidrotiaína (dihidrotiopirano), tetrahidrotiaína (tetrahidrotiopirano), dihidrotiepina, tetrahidrotiepina, perhidrotiepina, oxazolina (dihidrooxazol), oxazolidina (tetrahidrooxazol), dihidroisoxazol, tetrahidroisoxazol, oxadiazolina (dihidrooxadiazol), oxadiazolidina (tetrahidrooxadiazol), tiazolina (dihidrotiazol), tiazolidina (tetrahidrotiazol), dihidroisotiazol, tetrahidroisotiazol, morfolina, tiomorfolina, indolina, isoindolina, dihidrobenzofurano, perhidrobenzofurano, dihidroisobenzofurano, perhidroisobenzofurano, dihidrobenzotiofeno, perhidrobenzotiofeno, dihidroisobenzotiofeno, perhidroisobenzotiofeno, dihidroindazol, perhidroindazol, dihidroquinolina, tetrahidroquinolina, perhidroquinolina, dihidroisoquinolina, tetrahidroisoquinolina, perhidroisoquinolina, dihidroftalazina, tetrahidroftalazina, perhidroftalazina, dihidronaftiridina, tetrahidronaftiridina, perhidronaftiridina, dihidroquinoxalina, tetrahidroquinoxalina, perhidroquinoxalina, dihidroquinazolina, tetrahidroquinazolina, perhidroquinazolina, dihidrocinnolina, tetrahidrocinnolina, perhidrocinnolina, dihidrobenzoxazol, perhidrobenzoxazol, dihidrobenzotiazol, perhidrobenzotiazol, dihidrobencimidazol, perhidrobencimidazol, dihidrobenzazepina, tetrahidrobenzazepina, dihidrobenzodiazepina, tetrahidrobenzodiazepina, dihidrobenzoxazepina, tetrahidrobenzoxazepina, dioxolano, dioxano, dioxazina, dioxaindano, cromano, isocromano.
- 30
- 35
- 40
- 45 En la memoria descriptiva, anillo mono o biheterocíclico de 5-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) es arilo mono o biheterocíclico de 5-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) o completa o parcialmente saturado del mismo. Un arilo mono o biheterocíclico de 5 a 10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) es, por ejemplo, pirrol, imidazol, pirazol, triazol, tetrazol, piridina, pirazina, pirimidina, piridazina, azepina, diazepina, furano, pirano, oxepina, tiofeno, tiaína (tiopirano), tiepina, oxazol, isoxazol, oxadiazol, oxazina, oxadiazina, oxazepina, oxadiazepina, tiazol, isotiazol, tiadiazol, tiazina, tiadiacina, tiazepina, tiadiazepina, indol, isoindol, indolizina, benzofurano, isobenzofurano, benzotiofeno, isobenzotiofeno, indazol, quinolina, isoquinolina, quinolizina, ftalazina, naftiridina, quinoxalina, quinazolina, cinnolina, benzoxazol, benzoxadiazol, benzotiazol, bencimidazol, benzofurazano, benzotiadiazol, benzotriazol.
- 50
- 55 El arilo mono o biheterocíclico de 5-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) completa o parcialmente saturado anterior es, por ejemplo, pirrolina, pirrolidina, imidazolina, imidazolidina, pirazolina, pirazolidina, triazolina, triazolidina, tetrazolina, tetrazolidina, piperidina, piperazina, dihidropiridina, tetrahidropiridina, dihidropirazina, tetrahidropirazina, dihidropirimidina, tetrahidropirimidina, perhidropirimidina, dihidropiridazina, tetrahidropiridazina, perhidropiridazina, dihidroazepina, tetrahidroazepina, perhidroazepina, dihidrodiazepina, tetrahidrodiazepina, perhidrodiazepina, oxirano, oxetano, dihidrofurano, tetrahidrofurano, dihidropirano, tetrahidropirano, dihidrooxepina, tetrahidrooxepina, perhidrooxepina, tiirano, tietano, dihidrotiofeno, tetrahidrotiofeno, dihidrotiaína (dihidrotiopirano), tetrahidrotiaína (tetrahidrotiopirano), dihidrotiepina, tetrahidrotiepina, perhidrotiepina,
- 60

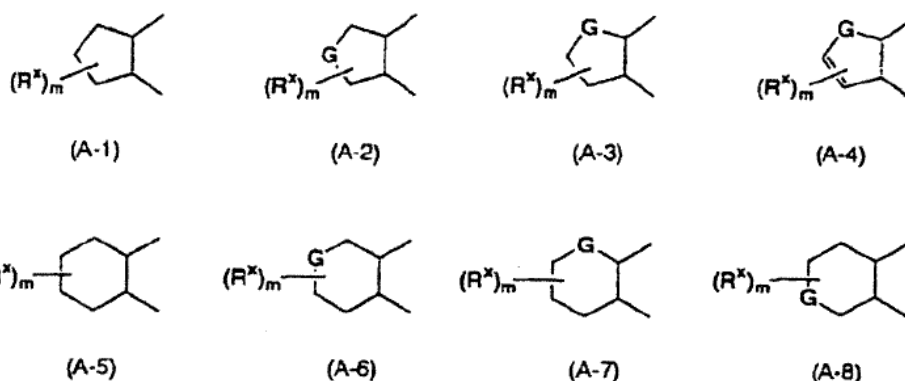
5 oxazolina (dihidrooxazol), oxazolidina (tetrahidrooxazol), dihidroisoxazol, tetrahidroisoxazol, oxadiazolina (dihidrooxadiazol), oxadiazolidina (tetrahidrooxadiazol), tiazolina (dihidrotiazol), tiazolidina (tetrahidrotiazol), dihidroisotiazol, tetrahidroisotiazol, morfolina, tiomorfolina, indolina, isoindolina, dihidrobenzofurano, perhidrobenzofurano, dihidroisobenzofurano, perhidroisobenzofurano, dihidrobenzotiofeno, perhidrobenzotiofeno, dihidroisobenzotiofeno, perhidroisobenzotiofeno, dihidroindazol, perhidroindazol, dihidroquinolina, tetrahidroquinolina, perhidroquinolina, dihidroisoquinolina, tetrahidroisoquinolina, perhidroisoquinolina, dihidroftalazina, tetrahidroftalazina, perhidroftalazina, dihidronaftiridina, tetrahidronaftiridina, perhidronaftiridina, dihidroquinoxalina, tetrahidroquinoxalina, perhidroquinoxalina, dihidroquinazolina, tetrahidroquinazolina, perhidroquinazolina, dihidrocinnolina, tetrahidrocinnolina, perhidrocinnolina, dihidrobenzoxazol, perhidrobenzoxazol, dihidrobenzotiazol, perhidrobenzotiazol, dihidrobencimidazol, perhidrobencimidazol, dioxolano, dioxano, dioxazina, dioxaindano, cromano, isocromano.

Son preferibles los compuestos de fórmulas (I-i), (I-ii) y (I-x).



En el compuesto de fórmulas (I-i), (I-ii) y (I-x) de la presente invención

15 es



en los que G es O, S o NH; R^x es alquilo C1-4, alcoxilo C1-4, átomo de halógeno o CF₃; m es 0-3.

En el compuesto de fórmulas (I-i), (I-ii) o (I-x) de la presente invención, el R¹ preferible es

- 20 (i) alquilo C1-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁴,
 (ii) alqueno C2-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁴,
 (iii) alquilo C2-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁴,
 (iv) NR⁴R⁵,
 (v) OR⁶,
 (vi) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁵,
 25 o
 (vii) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁵.

Una combinación preferible de R⁴ y R⁵ en NR⁴R⁵ del R¹ preferible anterior es

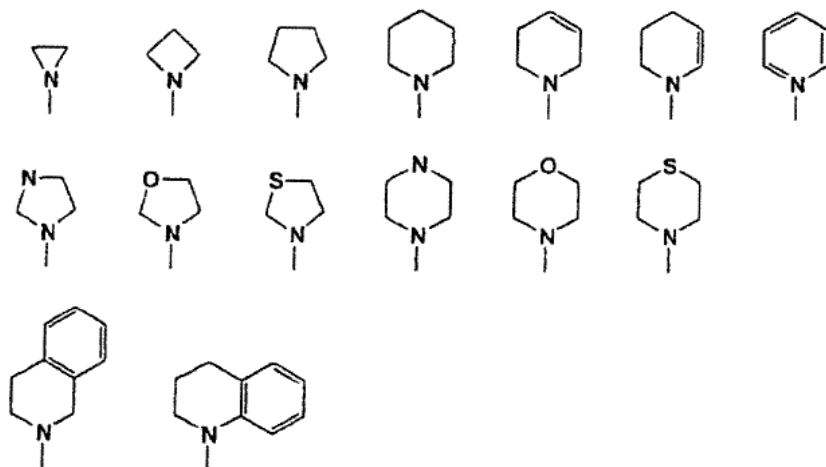
(a) R^4 es (i) hidrógeno y R^5 es (ii) alquilo C1-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iii) alqueniilo C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iv) alquinilo C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18} o (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18} o

(b) R^4 es (ii) alquilo C1-5 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iii) alqueniilo C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iv) alquinilo C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} o (v-1) anillo monocarbocíclico C3-6 y R^5 es (ii) alquilo C1-5 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iii) alqueniilo C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iv) alquinilo C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18} o (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18} .

Es preferible que el anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{15} del R^1 preferible anterior, se une a través del átomo de nitrógeno en el anillo. Es decir el grupo:



que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{15} , y este grupo es un anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene necesariamente un nitrógeno y además que contiene opcionalmente un nitrógeno, oxígeno o azufre. De manera concreta, están los siguientes anillos heterocíclicos que no están sustituidos o están sustituidos con 1-5 R^{15} .



Como compuestos específicos de la presente invención, están los compuestos descritos en los ejemplos a continuación en el presente documento y una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos.

A menos que se especifique lo contrario, se incluyen todos los estereoisómeros en la presente invención. Por ejemplo, alquilo, alcoxilo, alquileo y alquinilo incluyen isómeros lineales y ramificados. Se incluyen en la presente invención los isómeros basados en doble enlace, anillo, anillo condensado (E, Z, cis, trans), isómeros que resultan de la presencia de carbono(s) asimétrico(s) (configuración-R, configuración-S, configuración- α , configuración- β , enantiómeros, diastereoisómeros), compuestos ópticamente activos que tienen rotación óptica (configuración D, L, d, l), compuestos polares obtenidos mediante separaciones cromatográficas (compuesto altamente polar, compuesto menos polar), compuestos de equilibrio, las mezclas que existen en razón libre, mezclas racémicas.

[Sal]

El compuesto de la presente invención de fórmula (I) puede convertirse en una sal farmacéuticamente aceptable correspondiente mediante métodos conocidos. En la presente invención, las sales farmacéuticamente aceptables son sales de metal alcalinos, sales de metales alcalinotérreos, sales de amonio, sales de amina, sales de adición de ácido.

Son preferibles sales solubles en agua y no tóxicas. Sales apropiadas son, sales de metales alcalinos, tales como

potasio, sodio; sales de metales alcalinotérreos, tales como calcio, magnesio; sales de amonio, aminas orgánicas farmacéuticamente aceptables, tales como tetrametilamonio, trietilamina, metilamina, dimetilamina, ciclopentilamina, bencilamina, fenetilamina, piperidina, monoetanolamina, dietanolamina, tris(hidroximetil)metilaminometano, lisina, arginina, N-metil-D-glucamina. Es preferible una sal de metal alcalino.

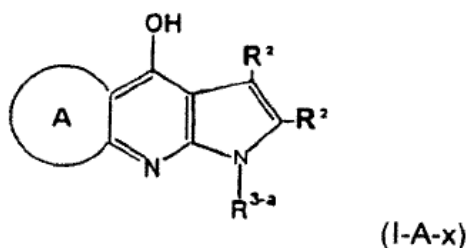
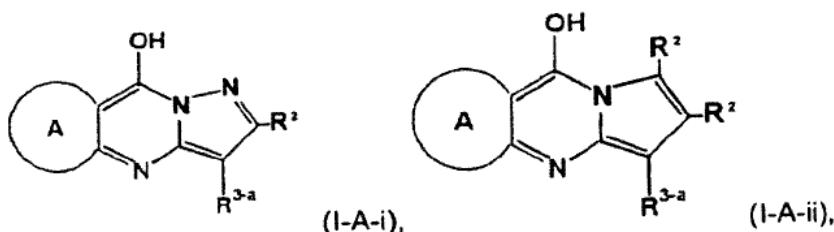
5 Son preferibles sales de adición de ácido solubles en agua y no tóxicas. Sales de adición de ácido apropiadas son, sales de ácidos inorgánicos, tales como clorhidrato, bromhidrato, sulfato, fosfato, nitrato; sales de ácido orgánico, tal como acetato, trifluoroacetato, lactato, tartrato, oxalato, fumarato, maleato, citrato, benzoato, metanosulfonato, etanosulfonato, bencenosulfonato, toluenosulfonato, isetionato, glucuronato, gluconato.

10 El compuesto de fórmula (I) de la presente invención y sales del mismo pueden convertirse en los hidratos correspondientes mediante medios convencionales.

Preparación del compuesto de la presente invención

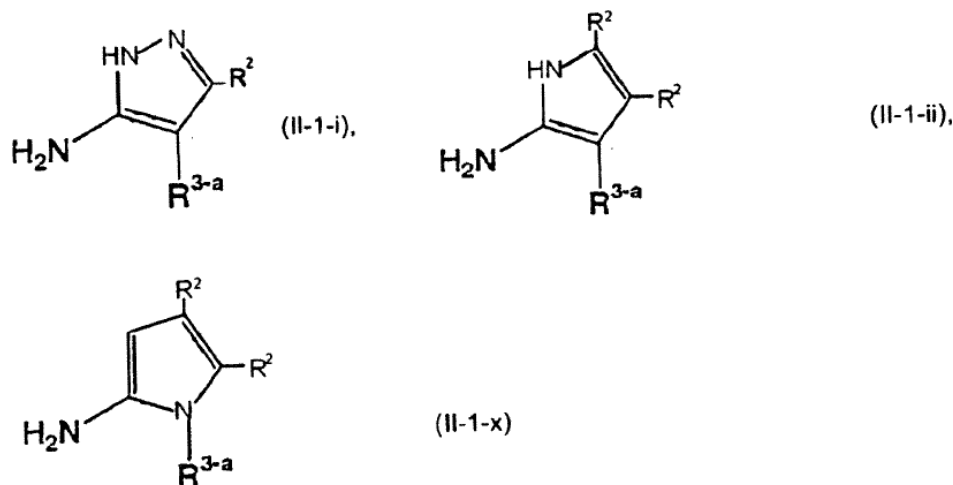
El presente compuesto de fórmulas (I-i), (I-ii) y (I-x) puede prepararse, por ejemplo, mediante el siguiente método.

(A) En el compuesto de fórmulas (I-i), (I-ii) y (I-x), el compuesto en el que R^1 es OH, y R^2 y R^3 no es OH, ciano, =N-OR¹¹ o un grupo que contiene OH, ciano o =N-OR¹¹, ése es el compuesto de fórmulas (I-A-i), (I-A-ii) y (I-A-x)



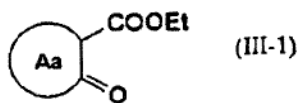
en las que R^{3-a} significa lo mismo que R^3 , con la condición de que no sea OH, ciano, =N-OR¹¹ o un grupo que contiene OH, ciano o =N-OR¹¹; los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento;

20 puede prepararse haciendo reaccionar el compuesto de fórmulas (II-1-i), (II-1-ii) o (II-1-x)



en las que todos los símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento;

con el compuesto de fórmula (III-1)



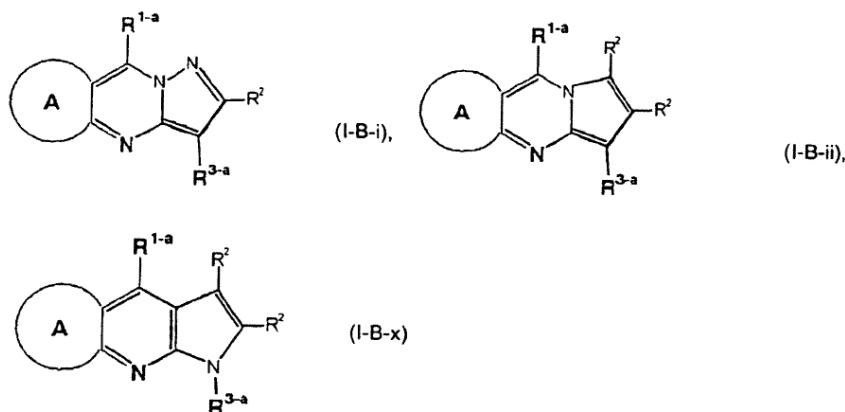
en la que el anillo A^a es un anillo heterocíclico de 4 a 6 miembros o anillo carbocíclico C4-6 saturado o parcialmente saturado, Et es etilo, los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento;

5 o sucesivamente, sometiéndose a reacción oxidativa.

Se conoce la reacción anterior del compuesto de fórmula (II) y el compuesto de fórmula (III), por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo ácido acético) a desde temperatura ambiente hasta temperatura de reflujo.

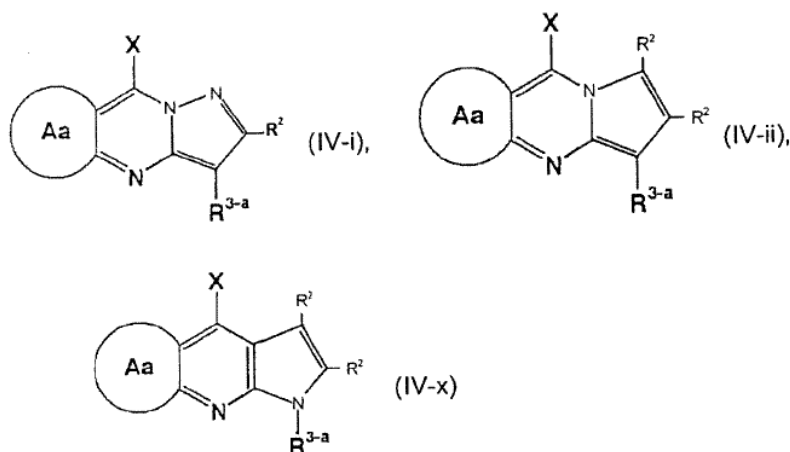
10 Se conoce la reacción oxidativa, por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo difenil éter), usando un catalizador de metal (por ejemplo paladio en carbono, paladio, hidróxido de paladio, acetato de paladio, negro de paladio), a 0°C~250°C.

15 (B) En el compuesto de fórmulas (I-i), (I-ii) y (I-x), el compuesto en el que R¹ no es OH, ni ciano, =N-OR⁶ o un grupo que contiene ciano o =N-OR¹¹, y anillo mono o bicarbocíclico C3-10, anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s), R² y R³ no es OH, ciano, =N-OR¹¹ o un grupo que contiene OH, ciano o =N-OR¹¹, éste es el compuesto de fórmulas (I-B-i), (I-B-ii) y (I-B-x)



20 en las que R^{1-a} significa lo mismo que R¹, con la condición de que no es OH, ni ciano, =N-OR⁶ o un grupo que contiene ciano o =N-OR¹¹, y anillo mono o bicarbocíclico C3-10, anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s); los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento;

puede prepararse haciendo reaccionar el compuesto de fórmulas (IV-i), (IV-ii) o (IV-x)



en las que X es átomo de halógeno, los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente

documento;

con el compuesto de fórmula (V-1)



- 5 en la que R^{1-ab} significa lo mismo que R¹, con la condición de que no es OH, ni ciano, =N-OR⁶ o un grupo que contiene ciano o =N-OR⁶, y anillo mono o bicarbocíclico C3-10, anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s);

o sucesivamente, sometido a reacción oxidativa, o

con el compuesto de fórmula (V-2)



- 10 en la que R^{1-ac} es anillo mono o bicarbocíclico C3-10, anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s);

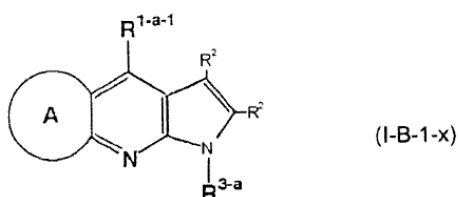
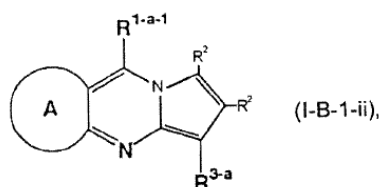
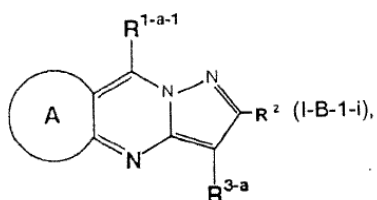
o sucesivamente, sometido a reacción oxidativa.

- 15 Se conoce la reacción anterior del compuesto de fórmula (IV-i), (IV-ii) y (IV-x) y el compuesto de fórmula (V-1), por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo alcohol isopropílico, tolueno, etanol, tetrahidrofurano) o sin disolvente, opcionalmente en presencia de una base (por ejemplo, hidróxido de sodio, etóxido de sodio) a 0~200°C.

- 20 Se conoce la reacción anterior del compuesto de fórmulas (IV-i), (IV-ii) y (IV-x) y el compuesto de fórmula (V-2), por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo dimetoxietano, dimetilformamida), en presencia de un catalizador (por ejemplo acetato de paladio) usando un compuesto de fosfina (por ejemplo trifenilfosfina) a 20°C ~temperatura de reflujo.

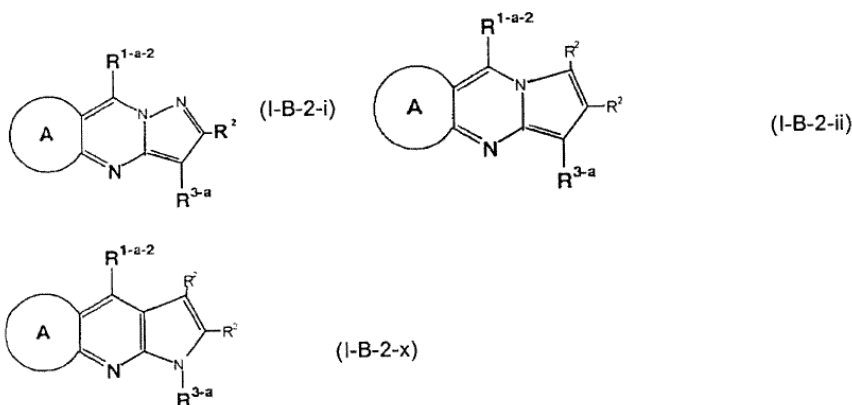
La reacción oxidativa se lleva a cabo mediante el método anterior.

Por otro lado, en el compuesto de fórmulas (I-B-i), (I-B-ii) y (I-B-x) el compuesto en el que R^{1-a} es alquilo C1-4 sustituido con 1-2 CR⁶ o CONR⁴R⁵, éste es el compuesto (I-B-1-i), (I-B-1-ii) o (I-B-1-x)



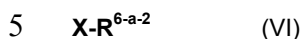
- 25 en el que R^{1-a-1} es alquilo C1-4 sustituido con 1-2 OR⁶ o CONR⁴R⁵ y los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento;

puede prepararse también sometiendo a una reacción reductora el compuesto de fórmulas (I-B-2-i), (I-B-2-ii) y (I-B-2-x)



en las que R^{1-a-2} es alquilo C1-4 sustituido con 1-2 $COOR^6$ y los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento;

o tras la reacción reductora, haciéndose reaccionar con el compuesto de fórmula (VI)



en la que R^{6-a-2} es (i) alquilo C1-10, (ii) alqueno C2-10, (iii) alquino C2-10, (iv) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que está sustituido con 1-5 R^{18} o no sustituido, (v) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que está sustituido con 1-5 R^{18} o no sustituido, o (vi) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 de los grupo(s) seleccionados de anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que está sustituido con 1-5 R^{18} o no sustituido y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que está sustituido con 1-5 R^{18} o no sustituido;

o con el compuesto fórmula (VII)



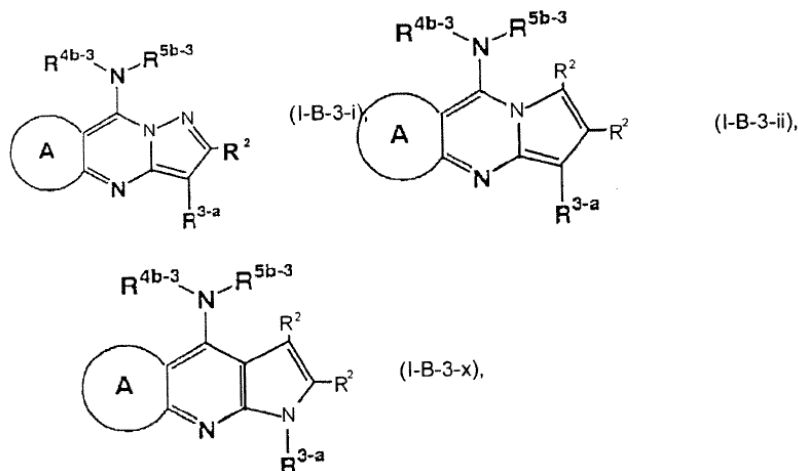
en la que todos los símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento.

15 Se conoce la reacción reductora, por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo dietil éter, cloruro de metileno, tolueno), usando un agente reductor (por ejemplo hidruro de diisopropilaluminio) a $-78^{\circ}C \sim 50^{\circ}C$.

Se conoce la reacción del compuesto (VI) y el compuesto tras la reacción reductora del compuesto de fórmulas (I-B-2-i), (I-B-2-ii) o (I-B-2-x) por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo dimetilformamida), usando una base (por ejemplo hidruro de sodio) a $0^{\circ}C \sim 50^{\circ}C$.

20 Se conoce la reacción del compuesto (VII) y el compuesto tras la reacción reductora del compuesto de fórmulas (I-B-2-i), (I-B-2-ii) o (I-B-2-x), por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo metanol, etanol, isopropanol) a $0^{\circ}C \sim 100^{\circ}C$.

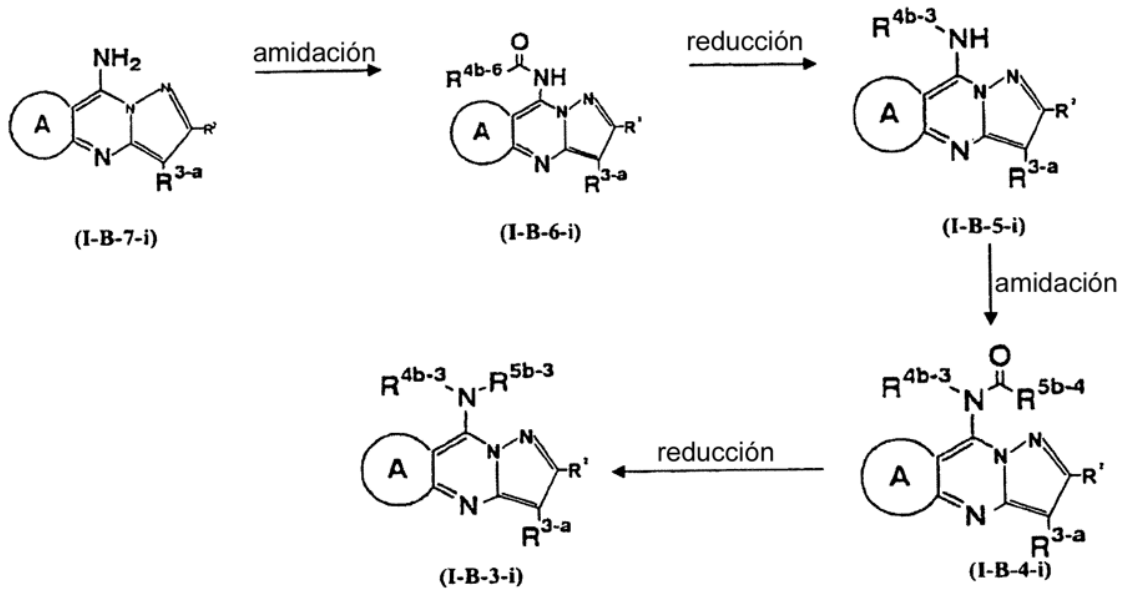
25 Por otro lado, en el compuesto de fórmula (I-B-i), (I-B-ii) o (I-B-x) el compuesto en el que R^1 es NR^4R^5 y R^4 y R^5 cada uno independientemente, es alquilo C1- 15 que está sustituido con 1-5 R^{17} o no sustituido, y R^2 y R^3 no son OH, ciano, $=N-OR^{11}$ o un grupo que contiene OH, ciano o $=N-OR^{11}$, ése es el compuesto (I-B-3-i), (I-B-3-ii) o (I-B-3-x)



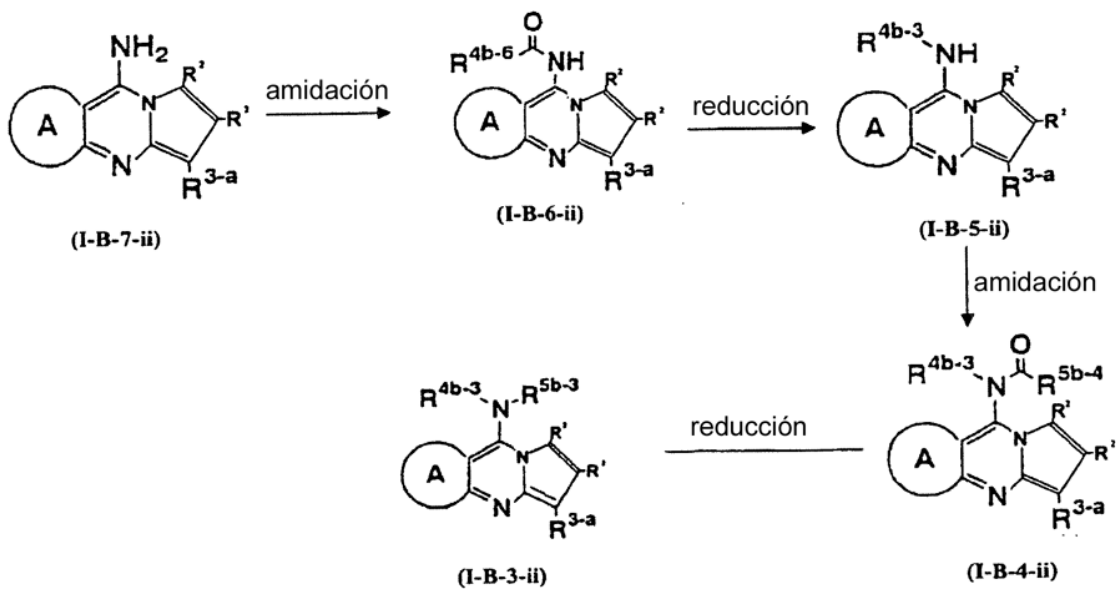
en el que R^{4b-3} y R^{5b-3} cada uno independientemente, es alquilo C1-15 que está sustituido con 1-5 R^{17} o no sustituido y los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento;

puede prepararse también según el esquema (1)(i), (1)(ii) y (1)(x).

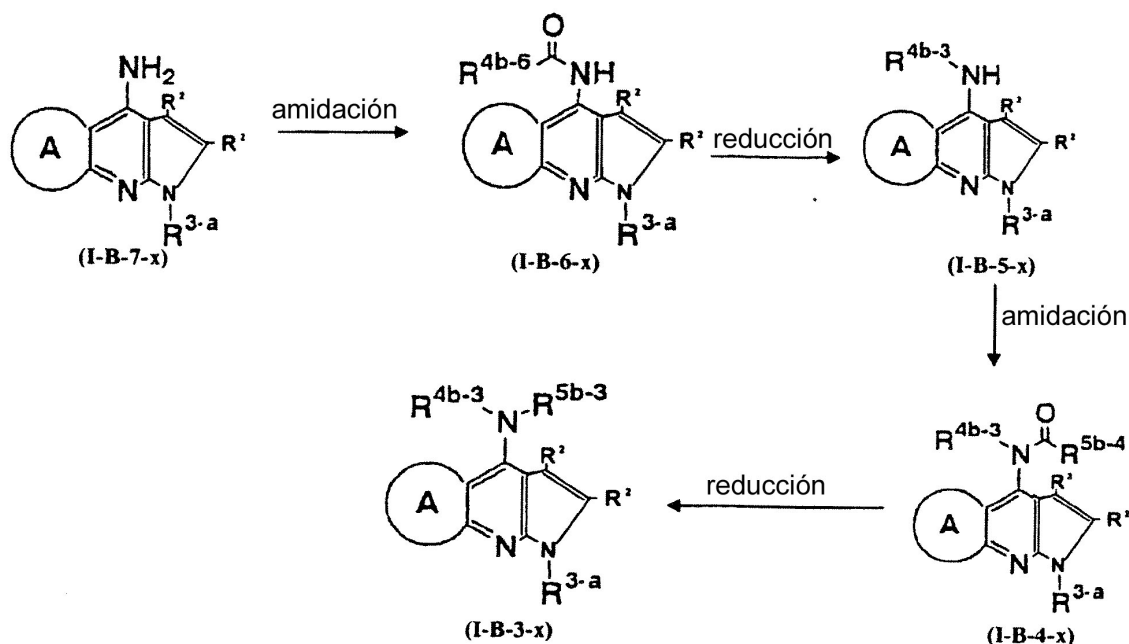
Esquema (1) (i)



Esquema (1) (ii)



Esquema (1)(x)

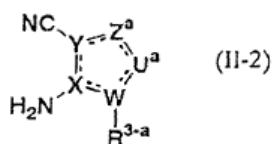


En el esquema(1)(i), (1)(ii) y (1)(x) R^{4b-6} es alquilo C1-14 que está sustituido con 1-5 R¹⁷ o no sustituido, R^{5b-4} es alquilo C1-14 que está sustituido con 1-5 R¹⁷ o no sustituido y los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento.

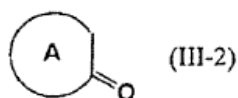
- 5 Se conoce la reacción de amidación, por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo cloroformo, cloruro de metileno, dietil éter, tetrahidrofurano) o sin disolvente, usando un haluro de acilo (por ejemplo cloruro de oxalilo o cloruro de tionilo, etc.) a -20°C~temperatura de reflujo, y entonces el derivado de haluro de acilo obtenido puede hacerse reaccionar con amina, en un disolvente orgánico (por ejemplo cloroformo, cloruro de metileno, dietil éter, tetrahidrofurano), en presencia de una amina terciaria (por ejemplo piridina, trietilamina, dimetilanimilina, dimetilaminopiridina) a 0-40°C. Puede llevarse a cabo la reacción bajo un gas inerte (por ejemplo argón, nitrógeno) para evitar agua con el fin de obtener un resultado preferible.

Se conoce la reacción reductora, por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo tetrahidrofurano), usando un agente reductor (por ejemplo complejo de borano-dimetilsulfuro, hidruro de aluminio y litio) a 0°C~temperatura de reflujo.

- 15 El compuesto de fórmulas (I-B-7-i), (I-B-7-ii) y (I-B-7-x) puede prepararse haciéndose reaccionar el compuesto de fórmula (II-2)



en la que todos los símbolos son como tal se definen a continuación en el presente documento;
con un compuesto de fórmula (III-2)



20

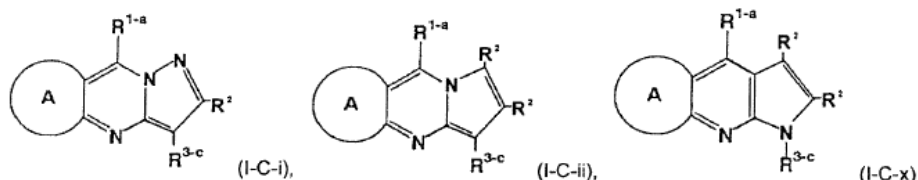
en la que todos los símbolos son tal como se definen a continuación en el presente documento;

o sucesivamente, sometiéndose a reacción oxidativa.

Se conoce la reacción anterior del compuesto de fórmula (II-2) y el compuesto de fórmula (III-2), por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo benceno, tolueno) usando un ácido (por ejemplo ácido p-toluenosulfónico o hidrato del mismo) a desde temperatura ambiente hasta temperatura de reflujo, y sucesivamente, en un disolvente orgánico (por ejemplo tetrahidrofurano), usando una base (por ejemplo isopropilamida de litio) a -10~50°C.

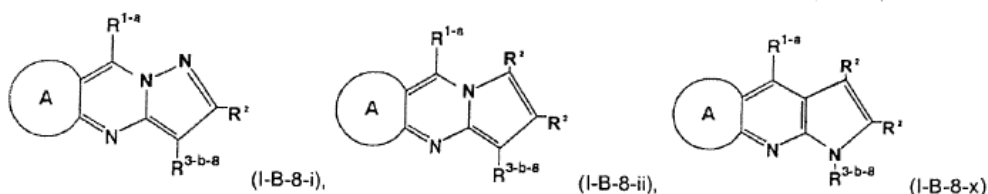
5

(C) En el compuesto de fórmulas (I-i), (I-ii) y (I-x) el compuesto en el que al menos uno de R^2 y R^3 es OH o un grupo que contiene OH, ése es el compuesto de fórmulas (I-C-i), (I-C-ii) o (I-C-x)



10 en las que R^{3-C} significa lo mismo que R^3 , con la condición de que al menos uno de ellos es OH o un grupo que contiene OH y los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento;

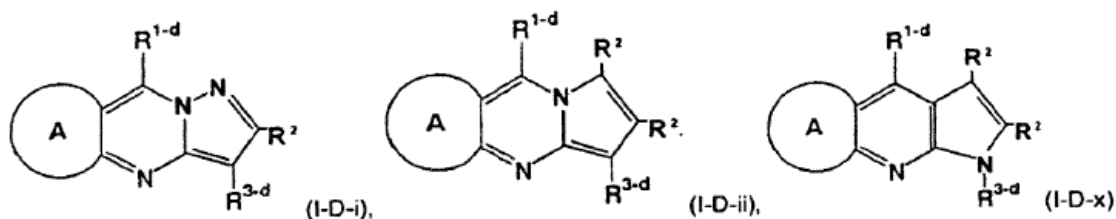
puede prepararse también sometiéndolo a desmetilación del compuesto en el que al menos uno de R^2 y R^3 es metoxilo o un grupo que contiene metoxilo en el compuesto de fórmulas (I-B-8-i), (I-B-8-ii) o (I-B-8-x)



15 en las que cada R^2 y R^{3-b-8} significa lo mismo que R^2 y R^3 , con la condición de que al menos uno de ellos es metoxilo o un grupo que contiene metoxilo y los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento.

Se conoce la reacción de desmetilación, por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo cloruro de metileno, acetato de etilo, cloroformo), usando ácido de Lewis (por ejemplo tribromuro de boro), a -80°C~80°C.

20 (D) En el compuesto de fórmulas (I-i), (I-ii) y (I-x) el compuesto en el que al menos uno de R^1 , R^2 y R^3 es un grupo que contiene $=N-OR^6$ o $=N-OR^{11}$, ése es el compuesto de fórmulas (I-D-i), (I-D-ii) o (I-D-x)

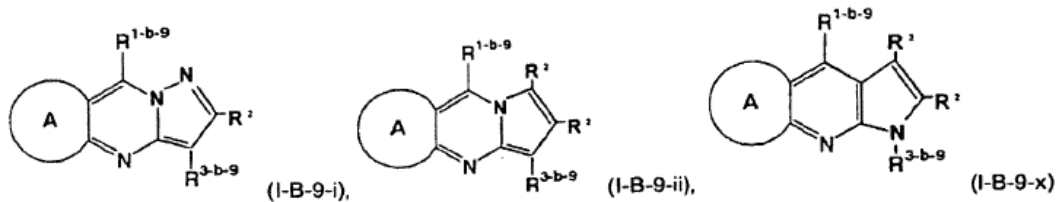


en las que cada R^{1-d} , y R^{3-d} significa lo mismo que R^1 , y R^3 , con la condición de que

25 al menos uno de ellos es un grupo que contiene $=N-OR^6$ o $=N-OR^{11}$ y los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento;

puede prepararse

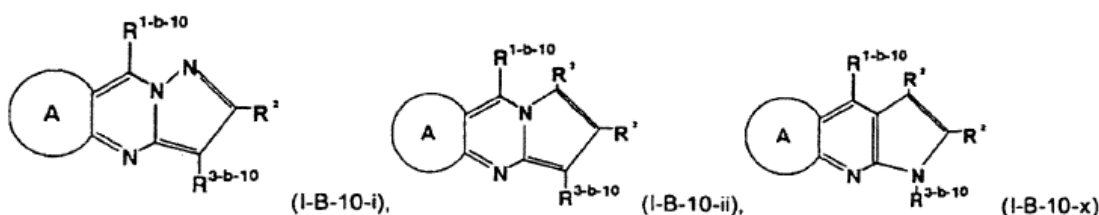
(1) sometiéndolo a desacetilación el compuesto en el que al menos uno de R^1 , R^2 y R^3 es un grupo que contiene $-CH(O\text{-alquilo } C1-4)_2$ en el compuesto de fórmulas (I-B-9-i), (I-B-9-ii) o (I-B-9-x)



en las que cada R^{1-b-9} , R^2 y R^{3-b-9} significa lo mismo que R^1 , R^2 y R^3 , con la condición de que al menos uno de ellos es un grupo que contiene $-\text{CH}(\text{O}-\text{alquilo C1-4})_2$ y los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento;

5 sucesivamente, a una reacción de formación de oxima, o

(2) sometiendo a reacción oxidativa el compuesto en el que R^{1-a} es un grupo que contiene OH en el compuesto de fórmulas (I-B-10-i), (I-B-10-ii) y (I-B-10-x)



10 en las que cada R^{1-b-10} , R^2 y R^{3-b-10} significa lo mismo que R^1 , R^2 y R^3 , con la condición de que R^{1-b-10} es OH o al menos uno de R^2 y R^{3-b-10} es un grupo que contiene OH y los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento;

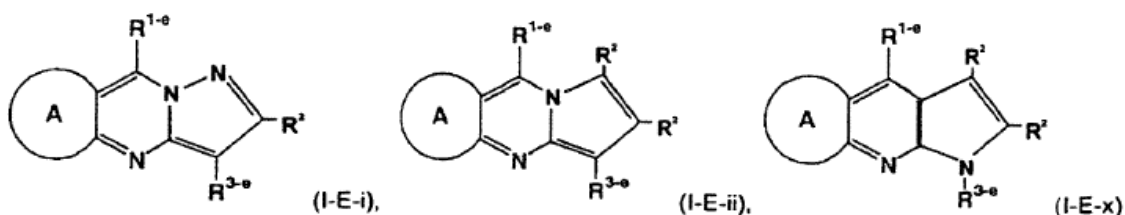
sucesivamente, a una reacción de formación de oxima.

Se conoce la reacción de desacetilación, por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo ácido acético, dioxano), usando un ácido (por ejemplo ácido clorhídrico, ácido sulfúrico) a 0~100°C.

15 Se conoce la reacción oxidativa, por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo cloruro de metileno) o sin disolvente, en presencia de una base (por ejemplo trietilamina, diisopropilamina), usando dimetilsulfóxido y complejo de trióxido de azufre-piridina, dicitclohexilcarbodiimida o cloruro de oxalilo a 0~50°C.

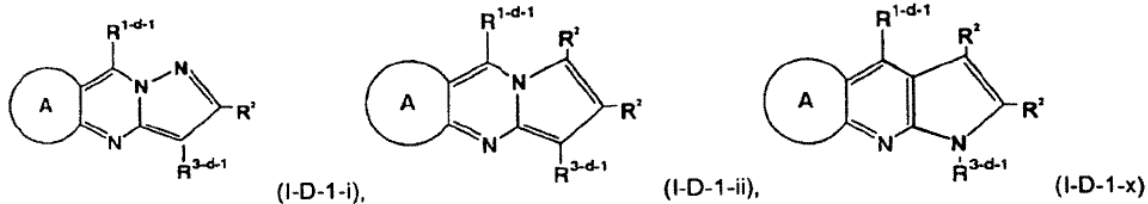
Se conoce la reacción de formación de oxima, por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo piridina), usando $\text{H}_2\text{N}-\text{O}-\text{R}^6$ o $\text{H}_2\text{N}-\text{O}-\text{R}^{11}$, a 0~50°C.

20 (E) En el compuesto de fórmulas (I-i), (I-ii) y (I-x), el compuesto en el que al menos uno de R^1 , R^2 y R^3 es ciano o un grupo que contiene ciano, ése es el compuesto de fórmula (I-E-i), (I-E-ii) y (I-E-x)



25 en las que cada R^{1-e} , R^2 y R^{3-e} significa lo mismo que R^1 , R^2 y R^3 , con la condición de que al menos uno de R^{1-e} , R^2 y R^{3-e} es ciano o un grupo que contiene ciano y los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento;

puede prepararse sometiendo a una reacción de deshidratación el compuesto en el que al menos uno de R^1 , R^2 y R^3 es un grupo que contiene $=\text{N}-\text{OH}$ en el compuesto de fórmulas (I-D-i), (I-D-ii) y (I-D-x)

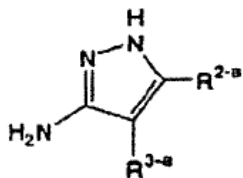


en las que cada R^{1-d-1} , R^2 y R^{3-d-1} significa lo mismo que R^1 , R^2 y R^3 , con la condición de que al menos uno de R^{1-d-1} , R^2 y R^{3-d-1} es un grupo que contiene =N-OH y los otros símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento.

- 5 Se conoce la reacción de deshidratación, por ejemplo, se lleva a cabo en un disolvente orgánico (por ejemplo cloruro de metileno), en presencia de una base (por ejemplo trietilamina, diisopropilamina), usando ácido trifluorometanosulfónico anhidro o clorocarbonato de triclorometilo a 0~50°C.

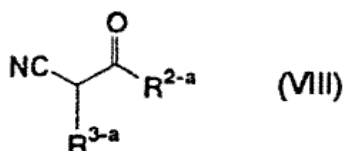
El compuesto de fórmula (IV) puede prepararse sometiendo a una reacción de halogenación el compuesto de fórmula (I-A).

- 10 Pueden conocerse los compuestos de fórmula (II), (III), (V), (VI) y (VII) *per se*, o pueden prepararse mediante métodos conocidos. Por ejemplo, entre el compuesto de fórmula (II)



en la que R^{2-a} significa lo mismo que R^2 , con la condición de que no es OH, ciano, =N-OR¹¹ o un grupo que contiene OH, ciano o =N-OR¹¹, y R^{3-a} es tal como se definió anteriormente en el presente documento;

- 15 puede prepararse reaccionando el compuesto de fórmula (VIII)



en la que todos los símbolos son tal como se definieron anteriormente en el presente documento;

- 20 con hidradina. Además, en el compuesto de fórmula (III), éster etílico del ácido ciclopentanon-2-carboxílico está disponible comercialmente. En el compuesto de fórmula (VI), 1-ciano-1-(2-metil-4-metoxifenil)propan-2-ona se describe en el documento de Bioorganic & Med. Chem., 8, 181-189 (2000).

Y los materiales de partida y reactivos en la presente invención pueden conocerse *per se* o pueden prepararse mediante métodos conocidos.

- 25 En cada reacción en la presente memoria descriptiva, los productos de reacción pueden purificarse mediante técnicas de purificación convencionales, por ejemplo mediante destilación a presión reducida o atmosférica, mediante cromatografía de líquidos de alta resolución, mediante cromatografía de capa fina o mediante cromatografía en columna usando gel de sílice o silicato de magnesio; o mediante lavado o recristalización. La purificación puede llevarse a cabo tras cada reacción o tras una serie de reacciones.

Breve descripción de los dibujos

- 30 La figura 1 muestra un gráfico del tiempo dedicado en las ramificaciones abiertas de ratas a las que se les administró 1, 3, 10 y 30 mg/kg del presente compuesto.

La figura 2 muestra un gráfico del número de entradas en las ramificaciones abiertas de ratas a las que se les administró 1, 3, 10 y 30 mg/kg del presente compuesto.

Actividades farmacológicas

El compuesto de la presente invención de fórmula (I) presenta actividad antagonística del receptor CRF, por ejemplo, se confirmó tal efecto del compuesto de la presente invención mediante las siguientes pruebas.

(1) Ensayo de unión

[Preparación de la membrana celular]

5 Tras cultivar la línea celular que expresa el receptor CRF1 humano (línea celular expresada: células CHO-K1) hasta alcanzar confluencia, se recogieron las células con un raspador. Se lavaron dos veces las células recogidas con PBS antes de suspenderse en tampón de ensayo de unión (Tris-HCl (50 mM, pH 7,0), EDTA (2 mM, pH 8,0), MgCl₂ (10 mM)) enfriado con hielo. Se homogenizaron las células suspendidas con un homogenizador del tipo Downs y se sometieron a centrifugación a 10.000 g para recoger la fracción de membrana. Se resuspendió la fracción de
10 membrana de células recogida con una cantidad pequeña del tampón de ensayo de unión, y se diluyó adicionalmente con dicho tampón hasta 1 mg/ml. Por tanto, se usó la fracción de membrana obtenida para el ensayo de unión.

[Ensayo de unión]

15 Se añadieron cincuenta µl de CRF h/r [¹²⁵I] preparado hasta 0,5 nM con tampón de ensayo de unión a tubos de 1,5 ml de silicona. Se añadió a los tubos 1 µl de compuestos diluidos en múltiplos apropiados, DMSO (para uso de unión total), o disolución CRF h/r (100 µM, para el uso de unión no específica), respectivamente. Se añadieron a los tubos muestras de 50 µl cada una de la preparación de fracción de membrana para iniciar la reacción (concentración final de CRF h/r [¹²⁵I]: 0,25 nM), entonces se incubaron las mezclas durante 2 horas a temperatura ambiente. Tras la finalización de la reacción, se sometieron los tubos a centrifugación a 15.000 g para recoger la fracción de
20 membrana. Se descartó el sobrenadante y se enjuagó el sedimento con PBS (-) enfriado que contiene Triton X-100 al 0,01%. Se midieron los valores de radioactividad de los tubos respectivos con un contador γ.

Se derivó la unión específica restando el valor de unión no específico de cada valor de unión.

Los resultados indicaban que estos compuestos de la invención presentaban afinidad potente en el receptor CRF1 (CI₅₀: < 1 µM).

25 (2) Una medición de una actividad antiansiedad usando el laberinto en cruz elevado

Dos ramificaciones (abierta y cerrada) de igual ancho y longitud (50 cm x 10 cm), que se cruzan en ángulo recto para formar un laberinto en cruz, se elevaron hasta una altura de 50 cm por encima del nivel del suelo. La ramificación cerrada tenía una pared de 40 cm. Se mantuvo la iluminación en ambos extremos de la ramificación
30 abierta con iluminación constante. Treinta minutos tras la administración de diversas dosis de compuestos de prueba (5 ml/kg), se colocaron ratas SD macho en el centro del laberinto en cruz. El tiempo dedicado en las ramificaciones abiertas y se midió el número de entradas en los respectivos brazos en el plazo de un periodo de 5 minutos. El personal de investigación para medir los índices se colocó en una ubicación fija durante el transcurso del experimento.

35 Se muestra el resultado en las figuras 1 y 2. Estas figuras indican que el tiempo dedicado en las ramificaciones abiertas se extendió significativamente y aumentó el número de entradas en las ramificaciones abiertas significativamente mediante una administración de 3 y 10 mg/kg del compuesto del ejemplo 2(78) de la presente invención, que ha mostrado un efecto de antiansiedad.

[Toxicidad]

40 La toxicidad de los compuestos de la presente invención es muy baja y por tanto, se confirma que estos compuestos son seguros para su uso como medicamento.

Aplicabilidad industrial

[Aplicación a productos farmacéuticos]

45 Los compuestos de la presente invención de las fórmulas (I-i), (I-ii) y (I-x) son útiles, con el fin de que presenten actividad antagonística del receptor CRF, para la prevención y/o el tratamiento de enfermedades inducidas por secreción extraordinaria de CRF, por ejemplo, depresión, depresión de episodio único, depresión recurrente, depresión puerperal, depresión inducida por malos tratos a menores, ansiedad, trastornos relacionados con la ansiedad (por ejemplo trastorno de pánico, fobia particular, miedo de caerse, fobia social, trastorno obsesivo compulsivo), trastorno emocional, trastorno bipolar, trastorno de estrés postraumático, úlcera péptica, diarrea, estreñimiento, síndrome del intestino irritable, enfermedad inflamatoria del intestino (colitis ulcerosa, enfermedad de Crohn), alteración gastrointestinal inducida por estrés, vómito nervioso, trastorno alimenticio (por ejemplo anorexia nerviosa, bulimia nerviosa), obesidad, trastorno del sueño inducido por estrés, trastorno del sueño inducido por dolor de fibra muscular, inmunosupresión inducida por estrés, cefalea inducida por estrés, fiebre inducida por estrés, dolor inducido por estrés, estrés posoperatorio, artritis reumatoide, osteoartritis, osteoporosis, psoriasis, disfunción

5 tiroidea, uveítis, asma, trastorno inducido por hormona antidiarreica inapropiada, dolor, inflamación, enfermedad alérgica, lesión de la cabeza, lesión de la médula espinal, lesión neuronal isquémica, lesión neuronal por toxicidad, enfermedad de Cushing, convulsiones, espasmos, espasmos musculares, epilepsia, enfermedad isquémica, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Huntington, incontinencia urinaria, enfermedad de Alzheimer, demencia senil tipo Alzheimer, demencia vascular, esclerosis lateral amiotrófica, hipoglucemia, enfermedad relacionadas al corazón o cardiovascular (hipertensión, taquicardia, insuficiencia cardíaca congestiva), drogadicción o síndrome de dependencia al alcohol.

10 Para el propósito descrito anteriormente, los compuestos de fórmulas (I-i), (I-ii) y (I-x) de la presente invención, sales no tóxicas de los mismos, sales de adición de ácido de los mismos o hidratos de los mismos puede administrarse de manera normal sistémicamente o por vía tópica, habitualmente por administración oral o parenteral.

15 Las dosis que van a administrarse se determinan dependiendo de, por ejemplo, la edad, el peso corporal, el síntoma, el efecto terapéutico deseado, la vía de administración, y la duración del tratamiento, etc. En el adulto humano, las dosis por persona en un momento son generalmente de desde 1 mg hasta 1000 mg, por administración oral, hasta varias veces al día, y desde 0,1 mg hasta 100 mg, por administración parenteral, preferiblemente administración intravenosa, hasta varias veces al día, o administración continua entre 1 y 24 horas por día en la vena.

Como se mencionó anteriormente, las dosis que van a usarse dependen de diversas condiciones. Por tanto, hay casos en los que pueden usarse dosis inferiores a o superiores a los intervalos especificados anteriormente.

20 Los compuestos de la presente invención pueden administrarse en forma de, por ejemplo, composiciones sólidas, composiciones líquidas u otras composiciones para administración oral, inyecciones, linimentos o supositorios para administración parenteral.

Las composiciones sólidas para administración oral incluyen comprimidos, píldoras, cápsulas, gránulos y polvos dispersables. Las cápsulas incluyen cápsulas duras y cápsulas blandas.

25 En tales formas sólidas, uno o más de los compuestos activos pueden mezclarse con vehículos, tales como lactosa, manitol, glucosa, celulosa microcristalina, almidón; aglutinantes, tales como hidroxipropilcelulosa, polivinilpirrolidona o aluminato metasilicato de magnesio; disgregantes, tales como glicolato de calcio de celulosa; lubricantes, tales como estearato de magnesio; agentes estabilizantes y adyuvantes de disolución, tales como ácido glutámico o ácido aspártico; y prepararse según métodos muy conocidos en la práctica farmacéutica normal. Las formas sólidas pueden recubrirse, si se desea, con agentes de recubrimiento, tales como azúcar, gelatina, hidroxipropilcelulosa o ftalato de hidroxipropilmetilcelulosa; o recubrirse con dos o más películas. Y adicionalmente, el recubrimiento puede incluir contención dentro de las cápsulas de materiales con capacidad de absorción tales como gelatina.

30 Las formas líquidas para administración oral incluyen disoluciones, suspensiones y emulsiones, jarabes y elixires farmacéuticamente aceptables. En tales formas, uno o más de los compuestos activos pueden disolverse, suspenderse o emulsionarse en el/los diluyente(s) usado(s) comúnmente en la técnica, tal como agua purificada, etanol o una mezcla de los mismos. Además tales formas líquidas pueden comprender también algunos aditivos, tales como agentes humectantes, agentes de suspensión, agentes emulsionantes, agentes edulcorantes, agentes aromatizantes, aromas, agentes de tamponamiento o conservantes.

35 Las inyecciones para administración parenteral incluyen acuosas estériles, suspensiones, emulsiones y formas sólidas que se disuelven o suspenden en disolvente(s) para inyección inmediatamente antes de su uso. En las inyecciones, uno o más de los compuestos activos pueden disolverse, suspenderse o emulsionarse en el/los disolvente(s). Los disolventes pueden incluir agua destilada para inyección, solución salina fisiológica, aceite vegetal, propilenglicol, polietilenglicol, alcohol, por ejemplo etanol, o una mezcla de los mismos. Las inyecciones pueden comprender algunos aditivos, tales como agentes estabilizantes, adyuvantes de disolución, tales como ácido glutámico, ácido aspártico o POLYSORBATE80 (marca registrada); agentes de suspensión, agentes emulsionantes, agentes calmantes, agentes de tamponamiento, conservantes. Pueden esterilizarse en una etapa final, o pueden prepararse y compensarse según métodos estériles. También pueden fabricarse en forma de formas sólidas estériles, por ejemplo, productos liofilizados, que pueden disolverse en agua estéril o algún otro diluyentes para inyección inmediatamente antes de su uso.

40 Otras formas de administración parenteral incluyen líquidos para uso externo, pomadas y linimentos endérmicos, inhalaciones, pulverizaciones, supositorios y óvulos para administración vaginal que comprenden uno o más de los compuestos activos y pueden prepararse mediante métodos conocidos *per se*. Las pulverizaciones pueden comprender sustancias adicionales además de los diluyentes, tales como agentes estabilizantes, tales como sulfato de sodio; tampones isotónicos, tales como cloruro de sodio, citrato de sodio o ácido cítrico. Para la preparación de tales pulverizadores, por ejemplo, puede usarse el método descrito en las patentes estadounidenses n.º 2.868.691 ó 45 3.095.355.

Mejor modo para llevar a cabo la invención

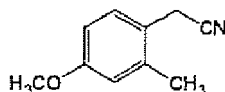
Los siguientes ejemplos de referencia y ejemplos ilustran, pero no limitan la presente invención.

Los disolventes entre paréntesis muestran los disolventes de desarrollo y de elución y las razones de los disolventes usados son en volumen en separaciones cromatográficas y CCF.

Los datos de RMN se muestran con el disolvente usado en las mediciones, entre paréntesis.

5 Ejemplo de referencia 1

2-Metil-4-metoxifenilacetonitrilo



- 10 Bajo una atmósfera de argón, se añadió una mezcla de N-bromosuccinimida (17,8 g) y 2,2'-azobisisobutironitrilo (492 mg) a una disolución de 1,2-dimetil-4-metoxibenceno (13,6 g) en tetracloruro de carbono (200 ml). Se sometió la mezcla a reflujo durante 6,5 horas. Se enfrió la mezcla de reacción con un baño de hielo. Se retiró la materia insoluble mediante filtración y se lavó con tetracloruro de carbono. Se concentró el filtrado combinado. Se disolvió el residuo en N, N-dimetilformamida (100 ml) y se añadió cianuro de sodio (9,86 g) a la mezcla. Se agitó la mezcla durante la noche a temperatura ambiente. Se vertió la mezcla de reacción en agua y se extrajo la mezcla con dietil éter. Se lavó la fase orgánica con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (acetato de etilo:n-hexano = 1:6 → 1:4) para dar el compuesto del título (11,78 g) que tiene los siguientes datos físicos.

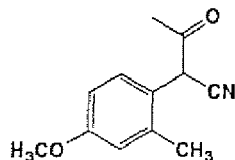
- 15

CCF: Rf 0,20 (n-hexano:acetato de etilo = 9:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,24 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 6,78-6,72 (m, 2H), 3,79 (s, 3H), 3,60 (s, 2H), 2,32 (s, 3H).

Ejemplo de referencia 2

20 1-Ciano-1-(2-metil-4-metoxifenil)propan-2-ona

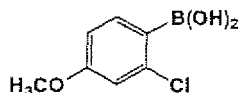


- 25 Bajo una atmósfera de argón, se le añadió a una disolución del compuesto preparado en el ejemplo de referencia 1 (11,7 g) en acetato de etilo (60 ml), sodio metálico (2,3 g) en números. Se agitó la mezcla durante 2 horas a 50°C. Se añadió acetato de etilo (40 ml) a la mezcla de reacción y se sometió la mezcla a reflujo durante 2,5 horas y entonces se agitó durante la noche a temperatura ambiente. Se recogió la materia precipitada mediante filtración y se lavó con dietil éter. Se disolvió el cristal obtenido en agua (300 ml). Se ajustó la disolución a pH 4 añadiendo ácido clorhídrico 2 N y se extrajo con acetato de etilo. Se secó la fase orgánica sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró para dar el compuesto del título (12,06 g) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,45 (n-hexano:acetato de etilo = 1:1).

30 Ejemplo de referencia 3

Ácido 2-cloro-4-metoxiborónico



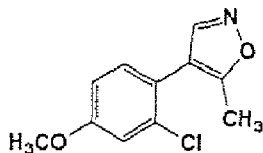
- 35 Se enfrió una disolución de 3-cloro-4-bromoanisol (2,14 g) en tetrahidrofurano anhidro (10 ml) a -78°C. Se añadió gota a gota n-butil-litio / hexano 1,56 M (6,5 ml) a la disolución y se agitó la mezcla durante 30 minutos. Se añadió gota a gota borato de triisopropilo (2,3 ml) a la mezcla de reacción y se agitó la mezcla durante 2 horas a -78°C. Se añadió una disolución acuosa saturada de cloruro de amonio a la mezcla de reacción y se extrajo la mezcla con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró. Se lavó el sólido obtenido con t-butilmetil éter (4 ml), se filtró y se secó sobre para dar el compuesto del título (681 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,55 (cloruro de metileno:metanol = 19:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,22 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,93 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,86 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 3,79 (s, 3H).

Ejemplo de referencia 4

5 4-(2-Cloro-4-metoxifenil)-5-metilisoxazol



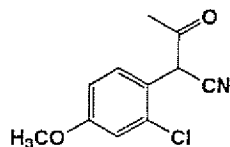
10 A una suspensión del compuesto preparado en el ejemplo de referencia 3 (644 mg), 4-yodo-5-metilisoxazol (658 mg) y bicarbonato de sodio (791 mg) en dimetoxietano (2,5 ml) / agua (2,5 ml), se le añadió tetrakis(trifenilfosfina)paladio (36 mg). Se agitó la mezcla durante 16 horas a 80°C. A la mezcla de reacción que se enfrió hasta temperatura ambiente, se le añadieron agua y acetato de etilo. Se retiró la materia insoluble mediante filtración. Se separó la fase orgánica del filtrado, se lavó con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 19:1 → 15:1) para dar el compuesto del título (637 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,44 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,29 (sa, 1H), 7,16 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,04 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,87 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 2,41 (sa, 3H).

Ejemplo de referencia 5

1-Ciano-1-(2-cloro-4-metoxifenil)propan-2-ona



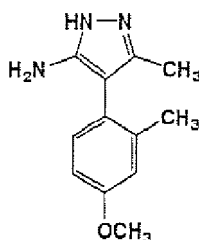
20 A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo de referencia 4 (623 mg) en metanol (2,8 ml), se le añadió metóxido de sodio / metanol 1,5 M (2,8 ml) y se agitó la mezcla durante 4 horas. Se diluyó la mezcla de reacción con agua y se lavó con hexano / t-butilmetil éter (10 ml; 1:1). Se ajustó la fase acuosa a pH 5 añadiendo ácido clorhídrico 4 N (1 ml) y se extrajo con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con una disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró para dar el compuesto del título (497 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,13 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

25 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,38 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,00 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,11 (s, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,29 (s, 3H).

Ejemplo de referencia 6

30 5-Amino-3-metil-4-(2-metil-4-metoxifenil)pirazol



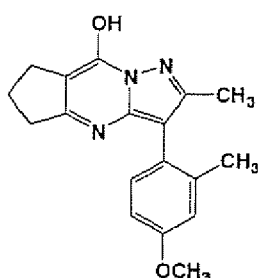
5 A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo de referencia 2 (8,63 g) en tolueno (200 ml), se le añadieron ácido acético (8,0 ml) y hidrazina monohidratada (4,5 ml). Se sometió la mezcla a reflujo durante 5,5 horas y se agitó durante la noche a temperatura ambiente. Se concentró la mezcla de reacción. Se añadió ácido clorhídrico 6 N al residuo y se extrajo la disolución con acetato de etilo / n-hexano (30 ml / 30 ml). Se basificó la fase acuosa añadiendo amoniaco acuoso concentrado y se extrajo con acetato de etilo. Se secó la fase orgánica sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró para dar el compuesto del título (8,38 g) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,30 (cloroformo:metanol = 9:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,08 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 6,84 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 6,77 (dd, J = 8,0, 2,5 Hz, 1H), 4,10 (sa, 3H), 3,83 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,07 (s, 3H).

Ejemplo 1

8-Hidroxi-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



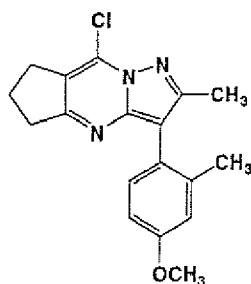
15 A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo de referencia 6 (500 mg) en ácido acético (3 ml), se le añadió ciclopentanona-2-carboxilato de etilo (0,40 ml) y se sometió la mezcla a reflujo durante 3 horas. Tras enfriar la mezcla de reacción hasta temperatura ambiente, se añadió dietil éter / n-hexano (10 ml; 2:1) a la mezcla. Se recogió el cristal precipitado mediante filtración y se lavó el cristal con dietil éter / n-hexano (10 ml; 2:1), se secó sobre para dar el compuesto del título (480 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,47 (cloroformo:metanol = 9:1);

20 RMN (300 MHz, DMSO-d₆): δ 11,90 (sa, 1H), 7,10 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 6,93 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 8,0, 3,0 Hz, 1H), 3,78 (s, 3H), 2,81 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,66 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,07 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 2,03 (m, 2H).

Ejemplo de referencia 7

8-Cloro-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



25 A una suspensión del compuesto preparado en el ejemplo 1 (400 mg) en tolueno (4 ml), se le añadieron oxiclورو de fósforo (0,60 ml) y dietilanilina (0,25 ml). Se sometió la mezcla a reflujo durante 1 hora. Se enfrió la mezcla de reacción y se vertió en una solución acuosa enfriada de bicarbonato de sodio. Se agitó la mezcla durante 10 minutos para degradar el exceso de oxiclورو de fósforo. Se extrajo la mezcla de reacción con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (acetato de etilo:n-hexano = 1:3 → 1:2) para dar el compuesto del título (411 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

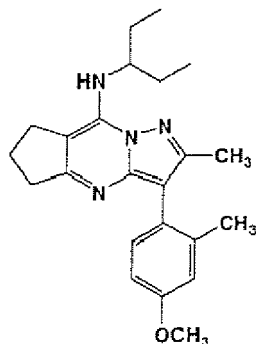
30

CCF: Rf 0,52 (n-hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,5, 2,5 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,09-3,00 (m, 4H), 2,40 (s, 3H), 2,23 (m, 2H), 2,15 (s, 3H).

Ejemplo 2

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



- 5 Se agitó una mezcla del compuesto preparado en el ejemplo de referencia 7 (150 mg) y 3-pentilamina (0,6 ml) durante 1 hora a 140°C. Se enfrió la mezcla de reacción y se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice (acetato de etilo:n-hexano = 1:3) para dar el compuesto del título (169 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,57 (n-hexano:acetato de etilo =1:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 8,5, 3,0 Hz, 1H), 6,21 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,81 (m, 1H), 3,08 (t, J = 7,0 Hz, 2H), 2,89 (t, J = 8,0 Hz, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,14 (m, 2H), 1,69 (m 4H), 1,02 (m, 6H).

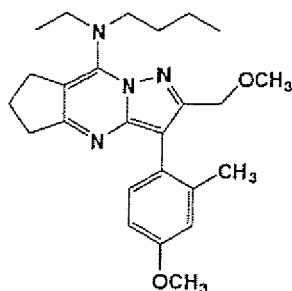
Ejemplo 2(1) - 2(365)

- 15 Se obtuvieron los siguientes compuestos, usando un compuesto correspondiente en lugar de 1,2-dimetil-4-metoxibenceno, mediante el mismo procedimiento que una serie de reacciones Ejemplo de referencia 1 → Ejemplo de referencia 2 → Ejemplo de referencia 6 → Ejemplo 1 usando un compuesto correspondiente en lugar de ciclopentanona-2-carboxilato de etilo → Ejemplo de referencia 7 → Ejemplo 2 usando un compuesto correspondiente en lugar de 3-pentilamina, o usando el compuesto preparado en el ejemplo de referencia 5 o un compuesto correspondiente, mediante el mismo procedimiento que una serie de reacciones Ejemplo de referencia 6 → Ejemplo 1 → Ejemplo de referencia 7 → Ejemplo 2, o sucesivamente mediante un método conocido para ser una sal del compuesto.

20

Ejemplo 2(1)

8-(N-Etil-N-n-butilamino)-2-metoximetil-8-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

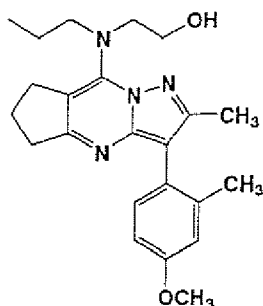


CCF: Rf 0,43 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 25 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,22 (d, J = 8,7 Hz, 1 H), 6,84 (d, J = 2,7 Hz, 1 H), 6,77 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1 H), 4,49 (m, 2 H), 3,81 (s, 3 H), 3,67 (q, J = 7,2 Hz, 2 H), 3,61 (t, J = 7,2 Hz, 2 H), 3,33 (s, 3 H), 2,97 (t, J = 7,2 Hz, 2 H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2 H), 2,19 (s, 3 H), 2,13 (m, 2 H), 1,55 (m, 2 H), 1,35 (m, 2H), 1,17 (t, J = 7,2 Hz, 3 H), 0,89 (t, J = 7,2 Hz, 3 H).

Ejemplo 2(2)

- 30 8-(N-Propil-N-(2-hidroxi-etil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

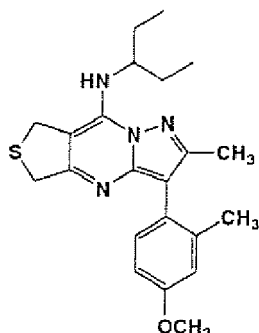


CCF: Rf 0,80 (n-hexano:acetato de etilo =1:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,14 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1 H), 6,79 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1 H), 3,90 (t, J = 4,8 Hz, 2 H), 3,83 (s, 3 H), 3,64 (m, 2 H), 3,43 (m, 2 H), 2,98 (t, J = 7,2 Hz, 2 H), 2,92 (t, J = 7,8 Hz, 2 H), 2,31 (s, 3 H), 2,17 (s, 3 H), 2,15 (m, 2 H), 1,58 (m, 2 H), 0,95 (t, J = 7,2 Hz, 3 H).

Ejemplo 2(3)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5, 7-dihidro-tieno[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

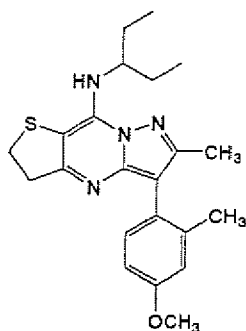


CCF: Rf 0,51 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,5, 2,5 Hz, 1H), 6,44 (d, J = 10,0 Hz, 1H), 4,32 (sa, 2H), 4,14 (sa, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,76 (m, 1H), 2,32 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,84-1,57 (m 4H), 1,03 (t, J = 7,0 Hz, 6H).

Ejemplo 2(4)

9-(3-Pentilamino)-6-metil-5-(2-metil-4-metoxifenil)-2,3-dihidro-tieno[3,2-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



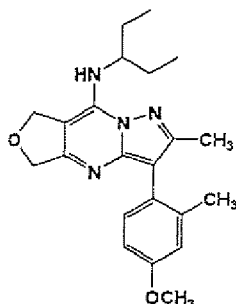
15

CCF: Rf 0,40 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,5, 3,0 Hz, 1H), 6,17 (d, J = 10,0 Hz, 1H), 3,99 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,36-3,20 (m, 4H), 2,30 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,82-1,56 (m 4H), 1,03 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

20 Ejemplo 2(5)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

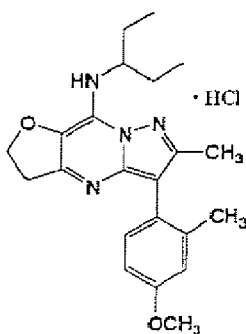


CCF: Rf 0,33 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 6,86 (d, J=2,5 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,5, 2,5 Hz, 1H), 6,32 (d, J = 10,0 Hz, 1H), 5,29 (s, 2H), 4,90 (sa, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,24 (m, 1H), 2,33 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,84-1,56 (m 4H), 1,02 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(6)

9-(3-Pentilamino)-6-metil-5-(2-metil-4-metoxifenil)-2,3-dihidro-furo[3,2-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

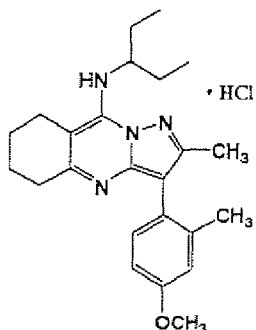


10 CCF: Rf 0,43 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,31 (sa, 1H), 7,12 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,76 (t, J = 9,0 Hz, 2H), 4,30 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,74 (t, J = 9,0 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,90-1,70 (m, 4H), 1,04 (m, 6H).

Ejemplo 2(7)

15 Clorhidrato de 9-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,6,7,8-tetrahidro-pirazolo[3,2-b]quinazolina

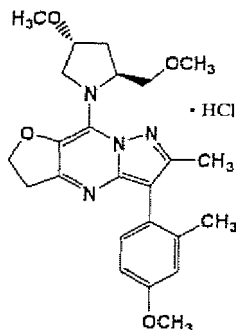


CCF: Rf 0,45 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 13,04 (sa, 1H), 7,91 (sa, 1H), 7,15 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 6,96 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 6,87 (dd, J = 8,5, 2,5 Hz, 1H), 5,65 (sa, 1H), 3,79 (s, 3H), 2,75 (m, 2H), 2,58 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,88-1,64 (m, 8H), 0,91 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(8)

6-Metil-5-(2-metil-4-metoxifenil)-9-[(2S,4R)-4-metoxi-2-metoximetilpirrolidin-1-il]-2,3-dihidro-furo[3,2-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

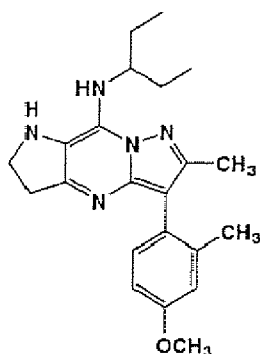


5 CCF: Rf 0,24 (n-hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, DMSO-d₆): δ 7,09 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 7,5, 2,4 Hz, 1H), 5,07 (sa, 1H), 4,66 (dt, J = 9,0, 9,0 Hz, 1H), 4,56 (dt, J = 9,0, 9,0 Hz, 1H), 4,24 (dd, J = 12,6, 3,6 Hz, 1H), 4,05 (sa, 1H), 3,85 (d, J = 12,6 Hz, 1H), 3,77 (s, 3H), 3,42 (dd, J = 10,2, 3,9 Hz, 1H), 3,33 (dd, J = 10,2, 5,1 Hz, 1H), 3,22 (dd, J = 9,0, 9,0 Hz, 2H), 3,21 (s, 3H), 3,18 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 2,30-1,95 (m, 2H).

10 Ejemplo 2(9)

9-(3-Pentilamino)-6-metil-5-(2-metil-4-metoxifenil)-2,3-dihidro-pirrolo[3,2-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

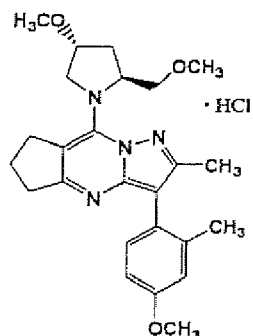


CCF: Rf 0,37 (n-hexano:acetato de etilo =1:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 5,86 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 4,07 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,58 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 3,06 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,52-1,82 (m, 4H), 1,01 (m, 6H).

Ejemplo 2(10)

Clorhidrato de 2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-8-[(2S,4R)-4-metoxi-2-metoximetilpirrolidin-1-il]-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



20

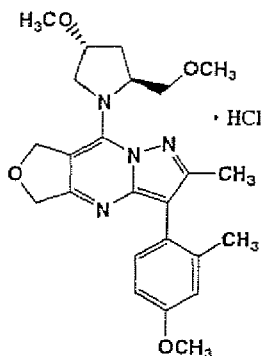
CCF: Rf 0,30 (n-hexano:acetato de etilo =1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 y 7,07 (d, J = 8,4 Hz, dos confórmeros, 1H), 6,89 y 6,87 (d, J = 2,7 Hz, dos confórmeros, 1H), 6,83 y 6,80 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, dos confórmeros, 1H), 5,65 (sa, 1H), 4,32-4,10 (m, 3H), 3,82 (s, 3H), 3,50-3,40 (m, 4H), 3,367 y 3,361 (s, dos confórmeros, 3H), 3,29 y 3,28 (s, dos confórmeros, 3H), 3,23-2,99 (m, 2H), 2,42 (m, 1H), 2,30-2,10 (m, 3H), 2,245 y 2,240 (s, dos confórmeros, 3H), 2,22 y 2,14 (s, dos confórmeros, 3H).

5

Ejemplo 2(11)

Clorhidrato de 2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-8-[(2S,4R)-4-metoxi-2-metoximetilpirrolidin-1-il]-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

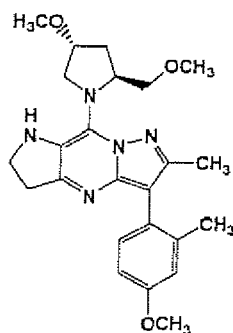


10 CCF: Rf 0,22 (n-hexano:acetato de etilo =1:1);

RMN (300 MHz, DMSO-d₆) 7,10 (sa, 1H), 6,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,1, 2,4 Hz, 1H), 5,33 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 5,25 (sa, 1H), 5,15 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 4,85 (d, J = 14,4 Hz, 1H), 4,75 (d, J = 14,4 Hz, 1H), 4,10-3,85 (m, 3H), 3,77 (s, 3H), 3,39 (dd, J = 9,9, 4,5 Hz, 1H), 3,28 (dd, J = 9,9, 5,1 Hz, 1H), 3,22 (s, 3H), 3,15 (s, 3H), 2,25 (m, 1H), 2,21 (s, 3H), 2,15-2,00 (m, 4H).

15 Ejemplo 2(12)

6-Metil-5-(2-metil-4-metoxifenil)-9-[(2S,4R)-4-metoxi-2-metoximetilpirrolidin-1-il]-2,3-dihidro-pirrolo[3,2-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

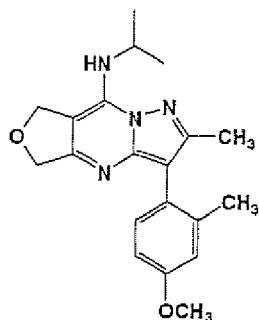


CCF: Rf 0,43 (cloroformo: metanol = 20:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 4,71 (m, 1H), 4,20 (m, 1H), 4,06 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,60 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,54 (m, 1H), 3,48 (dd, J = 4,5, 9,6 Hz, 1H), 3,39 (m, 1H), 3,34 (s, 3H), 3,28 (s, 3H), 3,09 (m, 2H), 2,24-2,40 (m, 4H), 2,18 (s, 3H), 2,01 (m, 1H).

Ejemplo 2(13)

8-Isopropilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



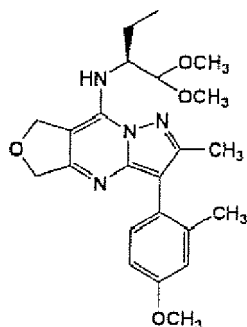
CCF: Rf 0,34 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 6,39 (d, J = 9,6 Hz, 1H), 5,32 (s, 2H), 4,90 (s, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,74 (m, 1H), 2,32 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,41 (d, J = 6,6 Hz, 6H).

5

Ejemplo 2(14)

8-[(2S)-1,1-Dimetoxibutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

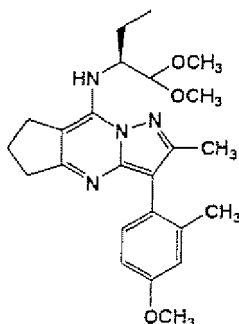


CCF: Rf 0,26 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,1, 2,4 Hz, 1H), 6,57 (da, J = 11,1 Hz, 1H), 5,36 (d, J = 9,9 Hz, 1H), 5,26 (d, J = 9,9 Hz, 1H), 4,90 (s, 2H), 4,33 (d, J = 3,9 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,50 (s, 3H), 3,48 (s, 3H), 3,39 (m, 1H), 2,32 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 1,88 (m, 1H), 1,68 (m, 1H), 1,04 (sa, 3H).

Ejemplo 2(15)

15 8-[(2S)-1,1-Dimetoxibutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



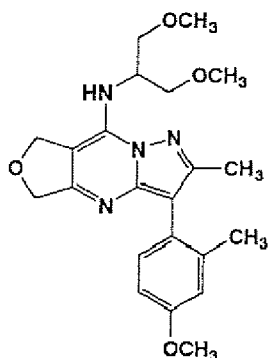
CCF: Rf 0,30 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,77 (dd, J = 8,1, 3,0 Hz, 1H), 6,47 (da, J = 11,8 Hz, 1H), 4,34 (sa, 1H), 4,01 (m, 1H), 3,81 (s, 3H), 3,49 (s, 6H), 3,19-3,00 (m, 2H), 2,89 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,13 (m, 2H), 1,86 (m, 1H), 1,65 (m, 1H), 1,04 (sa, 3H).

20

Ejemplo 2(16)

8-(1,3-Dimetoxipropan-2-il)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

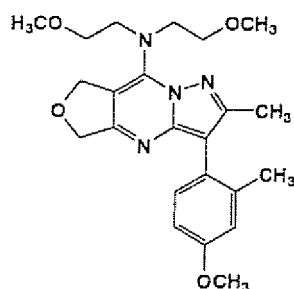


CCF: Rf 0,42 (n-hexano:acetato de etilo=1:1);

- 5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,14 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,87 (da, J = 8,1 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,1, 2,4 Hz, 1H), 5,33 (s, 2H), 4,89 (s, 2H), 3,81 (s, 3H), 3,75 (m, 1H), 3,62 (d, J = 4,8 Hz, 4H), 3,42 (s, 6H), 2,33 (s, 3H), 2,16 (s, 3H).

Ejemplo 2(17)

8-Bis(2-metoxietil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



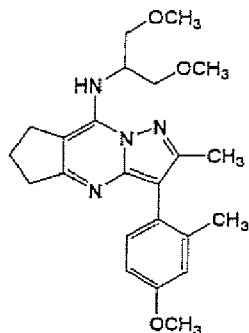
10

CCF: Rf 0,24 (n-hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 5,22 (s, 2H), 4,89 (s, 2H), 3,88 (t, J = 6,0 Hz, 4H), 3,82 (s, 3H), 3,55 (t, J = 6,0 Hz, 4H), 3,30 (s, 6H), 2,33 (s, 3H), 2,16 (s, 3H).

15 Ejemplo 2(18)

8-(1,3-Dimetoxipropan-2-il)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



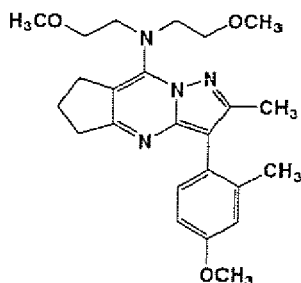
CCF: Rf 0,53 (n-hexano:acetato de etilo = 1:1);

- 20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,01 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,72 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,64 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 6,60 (d, J

= 9,9 Hz, 1H), 4,14 (m, 1H), 3,69 (s, 3H), 3,50 (d, J = 5,4 Hz, 4H), 3,30 (s, 6H), 2,99 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,76 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,18 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 2,01 (m, 2H).

Ejemplo 2(19)

8-Bis(2-metoxietil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



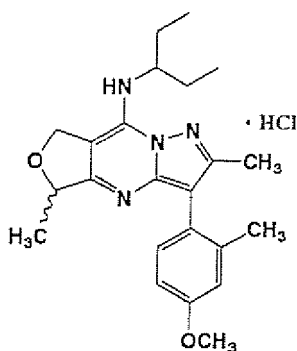
5

CCF: Rf 0,41 (n-hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 3,88 (t, J = 5,7 Hz, 4H), 3,82 (s, 3H), 3,52 (t, J = 5,7 Hz, 4H), 3,30 (s, 6H), 3,00 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,14 (m, 2H).

10 Ejemplo 2(20)

Clorhidrato de (5RS)-8-(3-pentilamino)-2,5-dimetil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

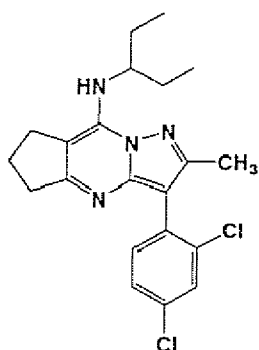


CCF: Rf 0,44 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

15 RMN (300 MHz, DMSO-d₆): δ 8,71 (sa, 1H), 7,15 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 6,93 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 6,85 (dd, J = 8,5, 2,5 Hz, 1H), 5,70 (sa, 1H), 5,25 (dd, J = 10,0, 2,0 Hz, 1H), 5,17 (d, J = 10,0 Hz, 1H), 5,11 (m, 1H), 3,79 (s, 3H), 3,26 (m, 1H), 2,26 (s, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,83-1,57 (m 4H), 1,41 (d, J = 5,5 Hz, 3H), 0,93-0,83 (m, 6H).

Ejemplo 2(21)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2,4-diclorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

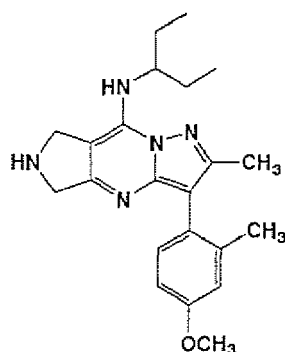


CCF: Rf 0,50 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,50 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,35 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 7,29 (dd, J = 8,5, 2,0 Hz, 1H), 6,23 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,81 (m, 1H), 3,09 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,15 (m, 2H), 1,82-1,55 (m 4H), 1,01 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(22)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-pirrolo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

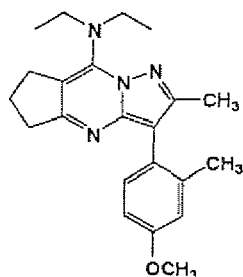


CCF: Rf 0,48 (cloroformo:metanol = 10:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 2,7, 8,1 Hz, 1H), 6,29 (d, J = 10,2 Hz, 1H), 4,43 (s, 2H), 4,10 (s, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,49 (m, 1H), 2,32 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,55-1,84 (m, 4H), 1,02 (m, 6H).

Ejemplo 2(23)

8-Dietilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



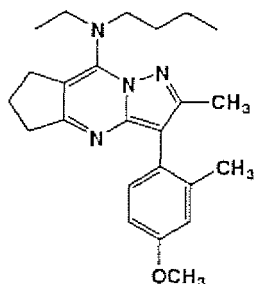
15

CCF: Rf 0,67 (n-hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,66 (q, J = 7,2 Hz, 4H), 2,99 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,13 (m, 2H), 1,18 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

20 Ejemplo 2(24)

8-(N-Etil-N-n-butilamino)-2-metil-3-(2,4-diclorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

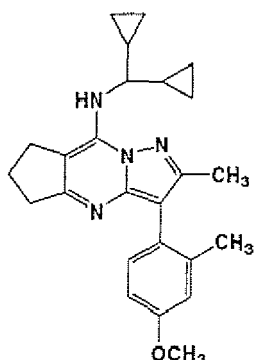


CCF: Rf 0,78 (n-hexano:acetato de etilo =1:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,17 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,4, 3,0 Hz, 1H). 3,82 (s, 3H), 3,70-3,56 (m, 4H), 2,97 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,13 (m, 2H), 1,55 (m, 2H), 1,32 (m, 2H), 1,17 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,90 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(25)

8-Diciclopropilmetilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

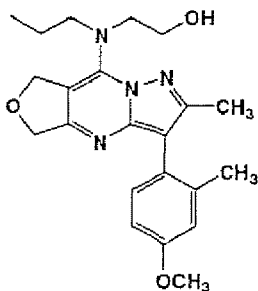


10 CCF: Rf 0,40 (n-hexano:acetato de etilo =3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 6,36 (d, J = 10,2 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,41 (m, 1H), 3,01 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,87 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,10 (m, 2H), 1,20-1,08 (m, 2H), 0,66-0,32 (m, 8H).

Ejemplo 2(26)

15 8-(N-propil-N-(2-hidroxi-etil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a] pirimidina

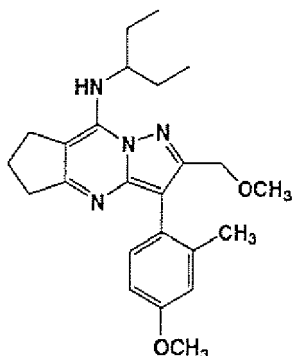


CCF: Rf 0,26 (n-hexano:acetato de etilo = 1:2);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,14 (d, J = 8,4 Hz, 1 H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1 H), 6,80 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1 H), 6,54 (sa, 1 H), 5,21 (s, 2 H), 4,89 (s, 2 H), 3,96 (ta, J = 4,8 Hz, 2 H), 3,83 (s, :3 H), 3,80 (m, 2 H), 3,29 (t, J = 7,5 Hz, 2 H), 2,33 (s, 3 H), 2,17 (s, 3 H), 1,63 (m, 2 H), 1,00 (t, J = 7,5 Hz, 3 H).

Ejemplo 2(27)

8-(3-Pentilamino)-2-metoximetil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

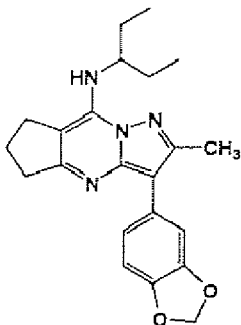


CCF: Rf 0,27 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,19 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 8,5, 2,5 Hz, 1H), 6,32 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 4,54-4,40 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,81 (m, 1H), 3,37 (s, 3H), 3,10 (t, J = 7,0 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 8,0 Hz, 2H), 2,20 (s, 3H), 2,14 (m, 2H), 1,80-1,53 (m, 4H), 1,08-0,94 (m, 6H).

Ejemplo 2(28)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(1,3-dioxaindan-5-il)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



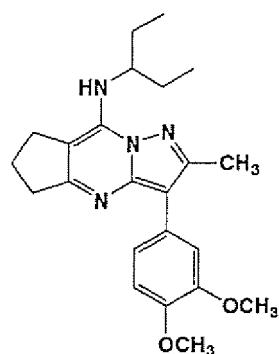
10

CCF: Rf 0,61 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,22 (d, J=1,5 Hz, 1H), 7,10 (dd, J = 1,5, 8,1 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,20 (d a, J = 10,5 Hz, 1H), 5,96 (s, 2H), 3,80 (m, 1H), 3,08 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,94 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 2,52 (s, 3H), 2,15 (m, 2H), 1,51-1,80 (m, 4H), 1,00 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

15 Ejemplo 2(29)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(3,4-dimetoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

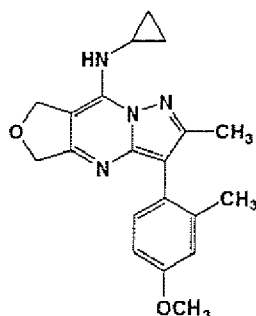


CCF: Rf 0,56 (n-hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 7,19 (dd, J = 2,1, 8,1 Hz, 1H), 6,96 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,20 (d a, J = 10,5 Hz, 1H), 3,93 (s, 3H), 3,91 (s, 3H), 3,80 (m, 1H), 3,09 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,94 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,55 (s, 3H), 2,16 (m, 2H), 1,53-1,81 (m, 4H), 1,00 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

5 Ejemplo 2(30)

8-Ciclopropilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3.4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

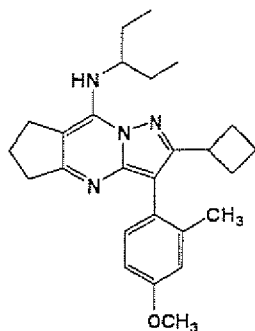


CCF: Rf 0,33 (n-hexano:acetato de etilo = 3:2);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,14 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 6,62 (sa, 1H), 5,54 (sa, 2H), 4,91 (sa, 2H), 3,82 (s, 3H), 2,89 (m, 1H), 2,30 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 0,98-0,84 (m, 4H).

Ejemplo 2(31)

8-(3-Pentilamino)-2-ciclobutil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

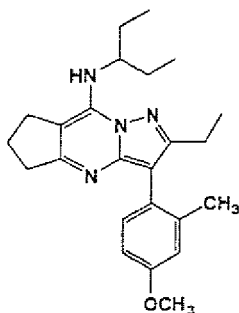


CCF: Rf 0,62 (benceno:acetato de etilo = 5:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,09 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,83 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,75 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 6,35 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,81 (m, 1H), 3,53 (m, 1H), 3,08 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,88 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,41 (m, 2H), 2,28-2,06 (m, 4H), 2,15 (s, 3H), 2,01-1,58 (m, 6H), 1,05 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 1,02 (t, J = 7,8 Hz, 3H).

Ejemplo 2(32)

8-(3-Pentilamino)-2-etil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

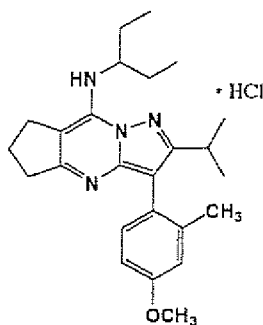


CCF: Rf 0,59 (benceno:acetato de etilo = 5:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,77 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 6,27 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,80 (m, 1H), 3,08 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,89 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,67 (m, 2H), 2,17 (s, 3H), 2,13 (m, 2H), 1,81-1,52 (m, 4H), 1,16 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 1,04 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 1,01 (t, J = 7,8 Hz, 3H).

5 Ejemplo 2(33)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-isopropil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

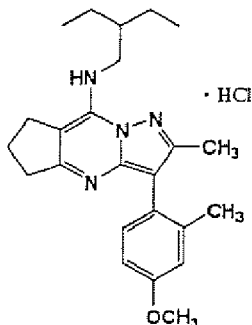


CCF: Rf 0,60 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,28 (m, 1H), 7,09 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 3,99 (m, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,49 (m, 2H), 3,12 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,99 (m, 1H), 2,28 (m, 2H), 2,20 (s, 3H), 1,85 (m, 2H), 1,74 (m, 2H), 1,24 (d, J = 6,9 Hz, 3H), 1,19 (d, J = 7,2 Hz, 3H), 1,08 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 1,06 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(34)

- 15 Clorhidrato de 8-(2-etilbutilamino)-2-metil-1-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

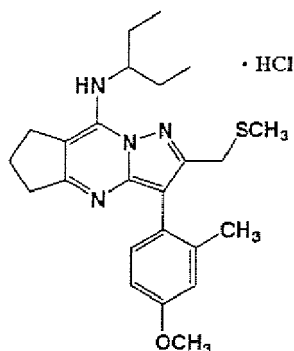


CCF: Rf 0,55 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,46 (m, 1H), 7,11 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,74 (t, J = 6,0 Hz, 2H), 3,49 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,21 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,26 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,68 (m, 1H), 1,53 (m, 4H), 1,00 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(35)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metilmetil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

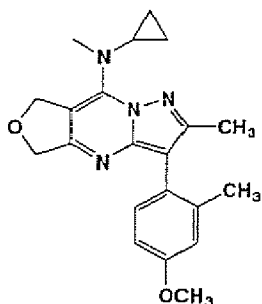


CCF: Rf 0,31 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,31 (da, J = 10,8 Hz, 1H), 7,16 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 4,00 (sa, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,70 (d, J = 13,5 Hz, 1H), 3,60 (d, J = 13,5 Hz, 1H), 3,50 (m, 2H), 3,14 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,29 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,95-1,65 (m, 4H), 1,07 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 1,05 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(36)

8-(N-Metil-N-ciclopropilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

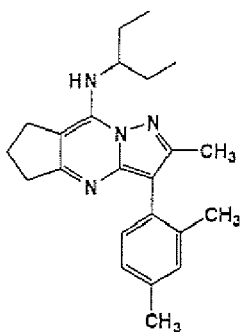


10 CCF: Rf 0,16 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,14 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 5,47 (sa, 2H), 4,90 (sa, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,45 (s, 3H), 2,80 (m, 1H), 2,33 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 0,84 (d, J = 6,0 Hz, 4H).

Ejemplo 2(37)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2,4-dimetilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1.5-a]pirimidina



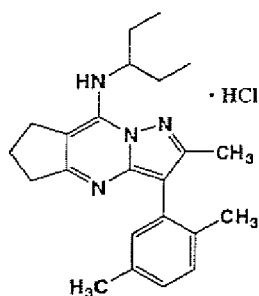
15

CCF: Rf 0,50 (benceno:acetato de etilo = 10:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,13 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,11 (sa, 1H), 7,03 (m, 1H), 6,21 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 3,80 (m, 1H), 3,08 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,89 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,13 (m, 2H), 1,56-1,82 (m, 4H), 1,02 (m, 6H).

Ejemplo 2(38)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,5-dimetilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

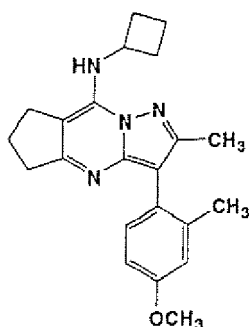


CCF: Rf 0,54 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,31 (d a, J = 10,2 Hz, 1H), 7,24 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,15 (dd a, J = 1,2, 7,5 Hz, 1H), 7,01 (sa, 1H), 3,99 (m, 1H), 3,49 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,14 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,32 (s, 3H), 2,29 (m, 2H), 2,18 (s, 3H), 1,64-1,94 (m, 4H), 1,07 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 1,06 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(39)

8-Ciclobutilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



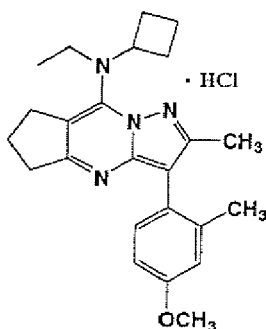
10

CCF: Rf 0,36 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,14 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,77 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 6,50 (da, J = 8,4 Hz, 1H), 4,46 (m, 1H), 3,81 (s, 3H), 3,12 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,88 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,43 (m, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,23-2,08 (m, 4H), 2,16 (s, 3H), 1,90-1,70 (m, 2H).

15 Ejemplo 2(40)

Clorhidrato de 8-(N-etil-N-ciclobutilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



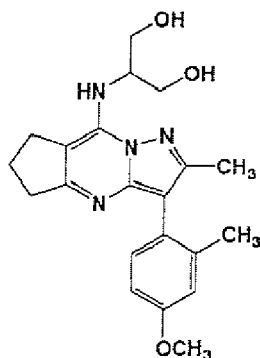
CCF: Rf 0,38 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,12 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 4,74 (m,

1H), 3,99 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,48 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,98 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,20-2,10 (m, 6H), 2,30 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 1,90-1,70 (m, 2H), 1,16 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(41)

8-(Propan-1,3-diol-2-il)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a] pirimidina



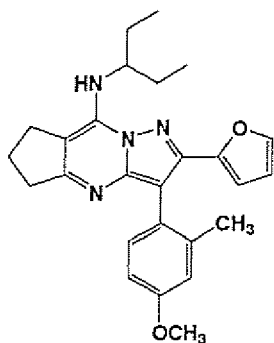
5

CCF: Rf 0,44 (cloroformo:metanol = 9:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,17 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 6,73 (d, J = 10,2 Hz, 1H), 4,12 (m, 1H), 3,98-3,83 (m, 4H), 3,82 (s, 3H), 3,05 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,87 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 2,11 (m, 2H).

10 Ejemplo 2(42)

8-(3-Pentilamino)-2-(2-furil)-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

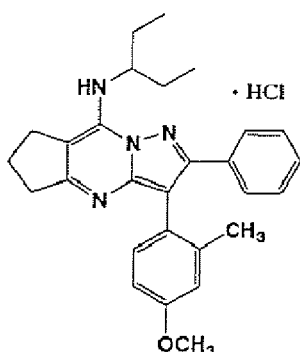


CCF: Rf 0,33 (n-hexano:acetato de etilo = 4:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,47 (m, 1H), 7,21 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 6,38-6,30 (m, 2H), 6,05 (m, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,82 (m, 1H), 3,11 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,15 (m, 2H), 2,10 (s, 3H), 1,70 (m, 4H), 1,04 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 1,01 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(43)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-fenil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

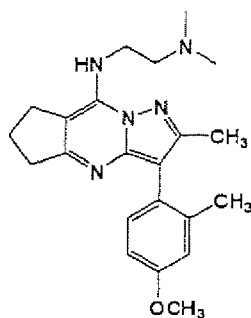


CCF: Rf 0,41 (n-hexano:acetato de etilo =4:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,59-7,54 (m, 2H), 7,45-7,19 (m, 5H), 6,88-6,82 (m, 2H), 4,04 (m, 1H), 3,85 (s, 3H), 3,55 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,17 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,32 (m, 2H), 2,05 (s, 3H), 1,97-1,55 (m, 4H), 1,10 (t, J = 6,9 Hz, 3H), 1,07 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(44)

8-(2-Dimetilaminoetil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

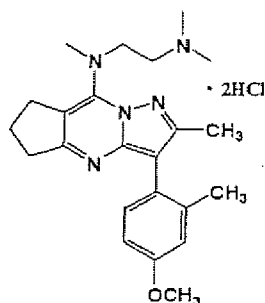


CCF: Rf 0,30 (cloruro de metileno:metanol = 19:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,77 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 6,71 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,75 (dt, J = 5,7, 6,3 Hz, 2H), 3,19 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,88 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,63 (t, J = 6,3 Hz, 2H), 2,33 (s, 6H), 2,31 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,12 (m, 2H).

Ejemplo 2(45)

15 Diclorhidrato de 8-(N-metil-N-(2-dimetilaminoetil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

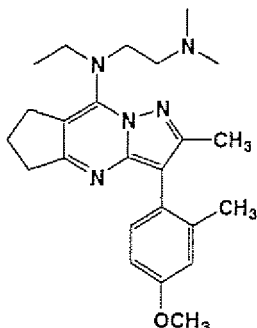


CCF: Rf 0,46 (cloruro de metileno:metanol = 9:1);

20 RMN (300 MHz, 0,5 ml de piridina-d₅ + 0,1 ml de CDCl₃): δ 7,42 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,04 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,21 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,85 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,75 (s, 3H), 3,14 (s, 3H), 3,00 (s, 6H), 2,90 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,80 (t, J = 7,5 HZ, 2H), 2,41 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 1,90 (m, 2H).

Ejemplo 2(46)

8-(N-Etil-N-(2-dimetilaminoetil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

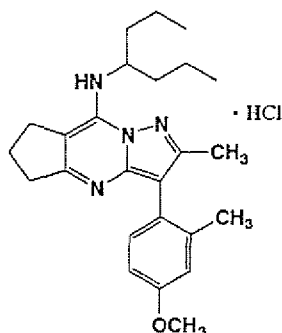


5 CCF: Rf 0,46 (cloruro de metileno; metanol = 9:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,80 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 3,64 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 2,99 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,90 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,56 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,25 (s, 6H), 2,17 (s, 3H), 2,12 (m, 2H), 1,17 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(47)

10 Clorhidrato de 8-(4-heptilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

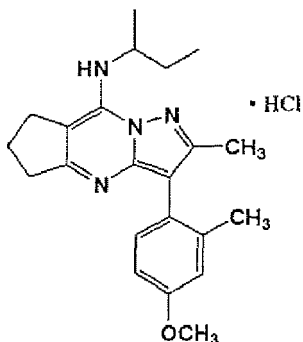


CCF: Rf 0,50 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,27 (da, J = 9,6 Hz, 1H), 7,11 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,12 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,49 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,11 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,32-2,20 (m, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,82-1,60 (m, 4H), 1,60-1,36 (m, 4H), 0,99 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,98 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(48)

Clorhidrato de 8-(2-butilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



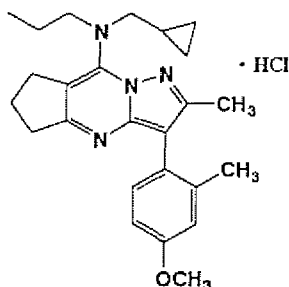
CCF: Rf 0,40 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,36 (da, J = 9,9 Hz, 1H), 7,12 y 7,11 (d, J = 8,4 Hz, dos confórmeros, 1H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,18 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,48 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,16 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,40-2,20 (m, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,19 y 2,18 (s, dos confórmeros, 3H), 1,80 (m, 2H), 1,48 y 1,47 (d, J = 6,6 Hz, dos confórmeros, 3H), 1,09 y 1,08 (t, J = 7,2 Hz, dos confórmeros, 3H).

5

Ejemplo 2(49)

Clorhidrato de 8-(N-propil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

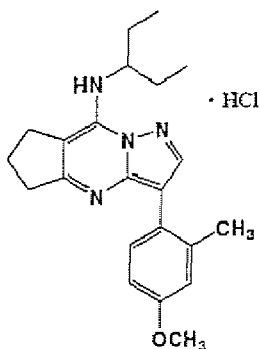


10 CCF: Rf 0,42 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,13 (m, 1H), 6,88 (sa, 1H), 6,82 (m, 1H), 3,88 (m, 2H), 3,83 (sa, 3H), 3,77 (sa, 2H), 3,37 (m, 2H), 3,06 (m, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,24 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,73 (m, 2H), 7,12 (m, 1H), 0,96 (m, 3H), 0,62 (m, 2H), 0,26 (sa, 2H).

Ejemplo 2(50)

15 Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



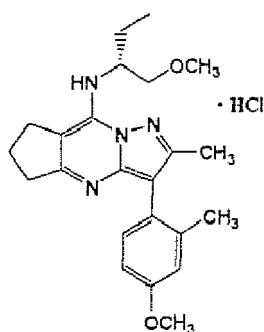
CCF: Rf 0,46 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, DMSO-d₆): δ 9,25 (m, 1H), 8,31 (s, 1H), 7,23 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,95 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,86 (dd, J = 2,4, 8,1 Hz, 1H), 3,99 (m, 1H), 3,78 (s, 3H), 3,15 (m, 2H), 3,02 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,20 (s, 3H), 2,18 (m, 2H), 1,60-1,88 (m, 4H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

20

Ejemplo 2(51)

Clorhidrato de 8-[(2R)-1-metoxibutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

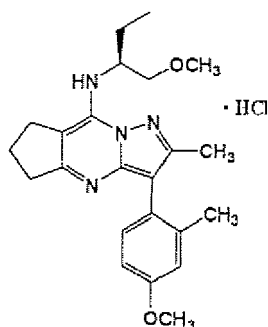


CCF: Rf 0,21 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,63 (da, J = 8,4 Hz, 1H), 7,09 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 4,19 (m, 1H), 3,81 (s, 3H), 3,65-3,53 (m, 2H), 3,45 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 3,43 y 3,41 (s, dos confórmeros, 3H), 3,26-3,01 (m, 2H), 2,30-2,20 (m, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,96-1,58 (m, 2H), 1,08 y 1,07 (t, J = 7,5 Hz, dos confórmeros, 3H).

Ejemplo 2(52)

Clorhidrato de 8-[(2S)-1-metoxibutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



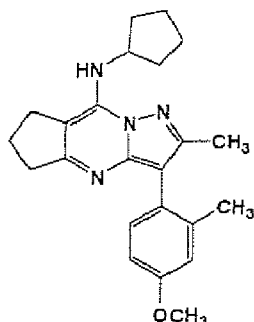
10

CCF: Rf 0,21 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,59 (da, J = 10,2 Hz, 1H), 7,11 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,19 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,66-3,53 (m, 2H), 3,48 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 3,44 y 3,42 (s, dos confórmeros, 3H), 3,26-3,02 (m, 2H), 2,30-2,20 (m, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,98-1,69 (m, 2H), 1,09 y 1,08 (t, J = 7,5 Hz, dos confórmeros, 3H).

Ejemplo 2(53)

8-Ciclopentilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



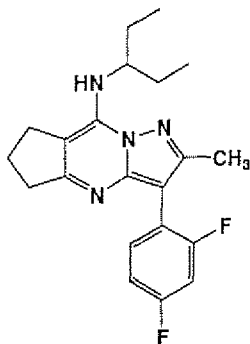
CCF: Rf 0,30 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,84 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,77 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 6,34 (da, J = 9,0 Hz, 1H), 4,38 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,15 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,89 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,17 (s, 3H),

2,18-2,00 (m, 4H), 1,95-1,65 (m, 6H).

Ejemplo 2(54)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2,4-difluorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

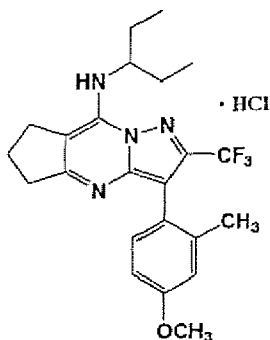


5 CCF: Rf 0,57 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,50 (ddd, J = 6,6, 8,4, 8,4 Hz, 1H), 6,86-6,99 (m, 2H), 6,23 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 3,80 (m, 1H), 3,09 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,92 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 2,39 (d, J = 1,5 Hz, 3H), 2,15 (m, 2H), 1,53-1,81 (m, 4H), 1,01 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(55)

10 Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-trifluorometil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

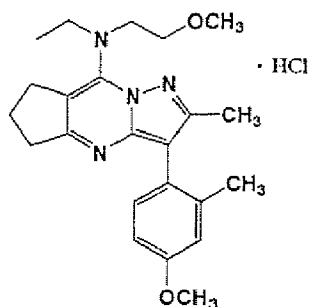


CCF: Rf 0,42 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,33 (d a, J = 10,2 Hz, 1H), 7,13 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 2,4, 8,7 Hz, 1H), 4,04 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,56 (m, 2H), 3,20 (m, 2H), 2,33 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,70-2,22 (m, 4H), 1,08 (m, 6H).

Ejemplo 2(56)

Clorhidrato de 8-(N-etil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

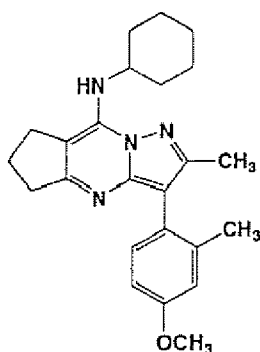


CCF: Rf 0,20 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,11 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,34-4,17 (m, 2H), 3,91 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,68 (t, J = 5,1 Hz, 2H), 3,47 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,32 (s, 3H), 3,06 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,30-2,20 (m, 2H), 2,18 (s, 3H), 1,38 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(57)

8-Ciclohexilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

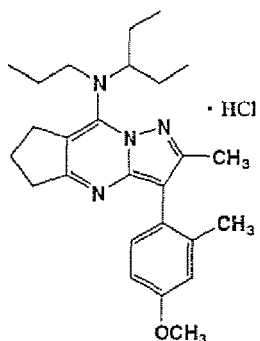


CCF: Rf 0,30 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,84 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,77 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 6,34 (da, J = 9,6 Hz, 1H), 3,81 (s, 3H), 3,80 (m, 1H), 3,10 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,88 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,18-2,00 (m, 4H), 1,90-1,80 (m, 2H), 1,75-1,60 (m, 1H), 1,50-1,20 (m, 5H).

Ejemplo 2(58)

15 Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(3-pentil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a] pirimidina



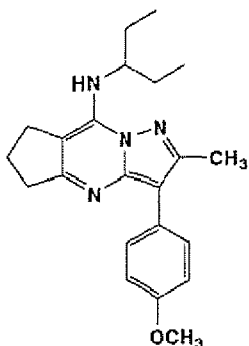
CCF: Rf 0,43 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,14 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 4,20 (m,

1H), 3,83 (s, 3H), 3,60 (m, 2H), 3,38 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,97 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,30-2,15 (m, 2H), 2,27 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 2,00-1,70 (m, 4H), 1,42 (m, 2H), 0,98 (t, J = 7,5 Hz, 6H), 0,90 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(59)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



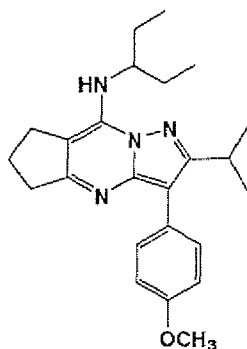
5

CCF: Rf 0,57 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,60 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 6,99 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 6,10 (d a, J = 10,5 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,81 (m, 1H), 3,08 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,94 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,53 (s, 3H), 2,15 (m, 2H), 1,53-1,82 (m, 4H), 1,00 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

10 Ejemplo 2(60)

8-(3-Pentilamino)-2-isopropil-3-(4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



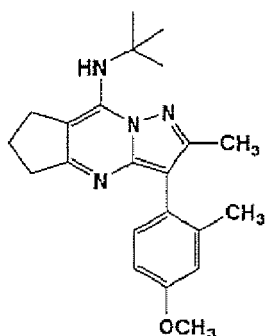
15

CCF: Rf 0,54 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 6,97 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 6,29 (d a, J = 10,5 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,80 (m, 1H), 3,32 (sept., J = 6,9 Hz, 1H), 3,07 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,13 (m, 2H), 1,63-1,83 (m, 4H), 1,33 (d, J = 6,9 Hz, 6H), 1,01 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(61)

8-t-Butilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



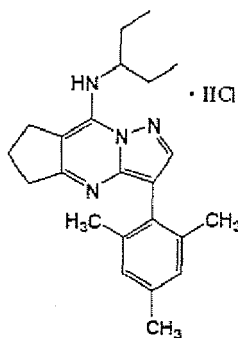
CCF: Rf 0,35 (n-hexano:acetato de etilo=3:1);

RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,15 (da, J = 8,7 Hz, 1H), 6,97 (sa, 1H), 6,85 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 3,81 (s, 3H), 3,15 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,11 (m, 2H), 1,57 (s, 9H).

5

Ejemplo 2(62)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-3-(2,4,6-trimetilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

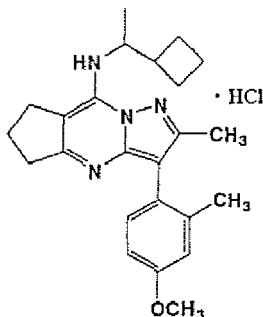


CCF: Rf 0,58 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,91 (s, 1H), 7,39 (da, J = 10,2 Hz, 1H), 6,99 (s, 2H), 4,03 (m, 1H), 3,52 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,17 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,31 (m, 2H), 2,13 (s, 6H), 1,67-1,96 (m, 4H), 1,07 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(63)

Clorhidrato de 8-(1-ciclobutiletil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



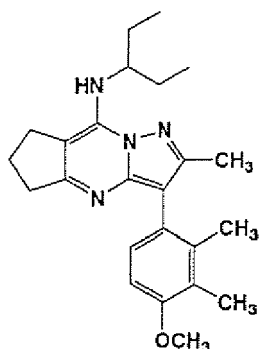
15

CCF: Rf 0,28 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, 0,5 ml de piridina- d_5 + 0,1 ml de CDCl_3): δ 7,46 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 6,80 (d, J = 10,2 Hz, 1H), 3,96 (m, 1H), 3,74 (s, 3H), 2,97 (ddd, J = 14,1, 7,2, 7,2 Hz, 2H), 2,86 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,50-2,36 (m, 1H), 2,47 (s, 3H), 2,39 (s, 3H), 2,05-1,65 (m, 8H), 1,15 (d, J = 6,3 Hz, 3H).

20 Ejemplo 2(64)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2,3-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

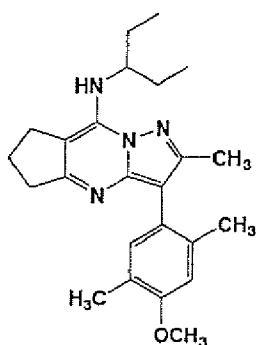


CCF: Rf 0,37 (benceno:acetato de etilo = 10:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,08 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,78 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,21 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,81 (m, 1H), 3,08 (t, J = 6,6 Hz, 2H), 2,88 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 2,13 (m, 2H), 2,10 (s, 3H), 1,56-1,82 (m, 4H), 1,03 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 1,01 (t, J = 6,9 Hz, 3H).

Ejemplo 2(65)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2,5-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

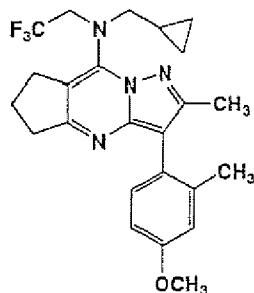


10 CCF: Rf 0,43 (benceno:acetato de etilo = 10:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 6,99 (s, 1H), 6,76 (s, 1H), 6,20 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,82 (m, 1H), 3,08 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,89 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,14 (m, 2H), 1,54-1,80 (m, 4H), 1,01 (m, 6H).

Ejemplo 2(66)

15 8-(N-(2,2,2-Trifluoroetil)-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

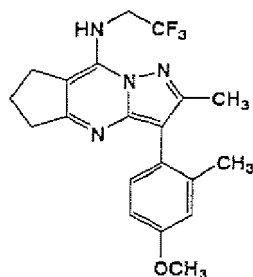


CCF: Rf 0,62 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,17 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 4,64 (q, J = 9,6 Hz, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,41 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 2,98 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,94 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,21-2,09 (m, 2H), 2,18 (s, 3H), 1,03 (m, 1H), 0,57 (m, 2H), 0,21 (m, 2H).

Ejemplo 2(67)

- 5 8-(2,2,2-Trifluoroetil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

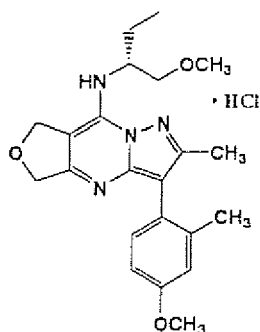


CCF: Rf 0,22 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,14 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 6,75 (ta, J = 7,8 Hz, 1H), 4,22 (dq, J = 7,8, 7,8 Hz, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,12 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,92 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,23-2,09 (m, 2H), 2,17 (s, 3H).

Ejemplo 2(68)

Clorhidrato de 8-[(2R)-1-metoxibutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

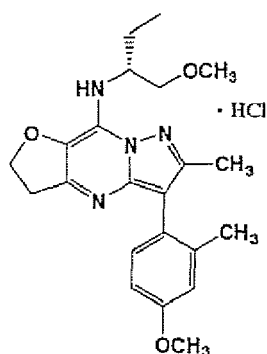


- 15 CCF: Rf 0,25 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, 0,5 ml de piridina-d₅ + 0,1 ml de CDCl₃): δ 7,39 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,37 (da, J = 9,3 Hz, 1H), 7,03 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,95 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 5,45 (d, J = 9,9 Hz, 1H), 5,35 (d, J = 9,9 Hz, 1H), 4,98 (sa, 2H), 3,74 (s, 3H), 3,63-3,48 (m, 3H), 3,26 (s, 3H), 2,41 (s, 3H), 2,34 (s, 3H), 1,82-1,60 (m, 2H), 0,97 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(69)

- 20 Clorhidrato de 8-[(2R)-1-metoxibutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-2,3-dihidro-furo[3,2-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

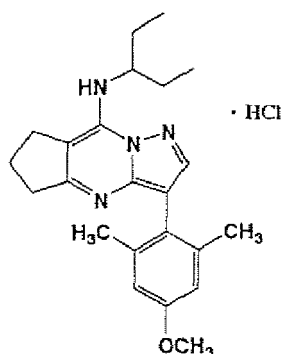


CCF: Rf 0,29 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, 0,5 ml de piridina-d₅ + 0,1 ml de CDCl₃): δ 7,40 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,03 (sa, 7 H), 6,95 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 6,80 (da, J = 9,3 Hz, 1H), 4,47 (m, 1H), 4,47 (t, J = 8,4 Hz, 2H), 3,74 (s, 3H), 3,56 (d, J = 4,8 Hz, 2H), 3,28 (s, 3H), 3,12 (t, J = 8,4 Hz, 2H), 2,43 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 1,87-1,46 (m, 2H), 1,00 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(70)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

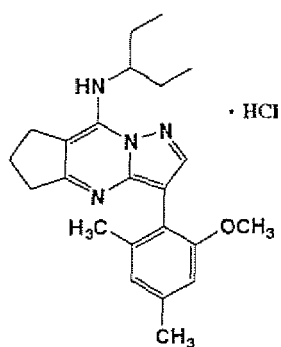


CCF: Rf 0,33 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,90 (s, 1H), 7,39 (d a, J = 10,2 Hz, 1H), 6,72 (s, 2H), 4,02 (m, 1H), 3,81 (s, 3H), 3,53 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,17 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,32 (m, 2H), 2,14 (s, 6H), 1,66-1,96 (m, 4H), 1,08 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(71)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-3-(4,6-dimetil-2-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

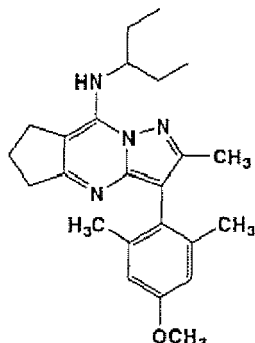


15 CCF: Rf 0,33 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,99 (s, 1H), 7,37 (d a, J = 10,8 Hz, 1H), 6,75 (s, 1H), 6,70 (s, 1H), 4,01 (m, 1H), 3,85 (s, 3H), 3,57 (t, J=7,8 Hz, 2H), 3,16 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,31 (m, 2H), 2,23 (s, 3H), 1,63-1,92 (m, 4H), 1,06 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(72)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

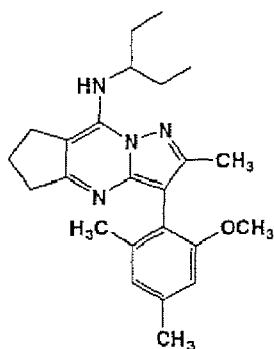


CCF: Rf 0,33 (benceno:acetato de etilo = 10:1);

- 5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 6,68 (s, 2H), 6,21 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,81 (m, 1H), 3,80 (s, 3H), 3,09 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,88 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,19 (s, 3H), 2,13 (m, 2H), 2,04 (s, 6H), 1,55-1,83 (m, 4H), 1,03 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(73)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(4,6-dimetil-2-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

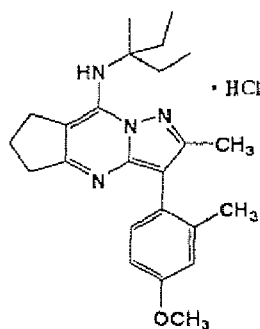


- 10 CCF: Rf 0,33 (benceno:acetato de etilo = 10:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 6,75 (m, 1H), 6,62 (s, 1H), 6,21 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,80 (m, 1H), 3,71 (s, 3H), 3,06 (m, 2H), 2,87 (m, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 2,12 (m, 2H), 2,09 (s, 3H), 1,53-1,80 (m, 4H), 1,03 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 1,00 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(74)

- 15 Clorhidrato de 8-(3-metilpentan-3-il)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

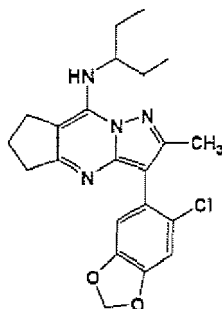


CCF: Rf 0,36 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,01 (sa, 1 H), 7,12 (d, J = 8,1 Hz, 1 H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1 H), 6,82 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1 H), 3,83 (s, 3 H), 3,52 (t, J = 7,8 Hz, 2 H), 3,16 (t, J = 7,2 Hz, 2 H), 2,28 (s, 3 H), 2,24 (m, 2 H), 2,20 (s, 3 H), 2,00-1,85 (m, 4 H), 1,55 (s, 3 H), 1,03 (t, J = 7,5 Hz, 6 H).

Ejemplo 2(75)

- 5 8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(5-cloro-1,3-dioxaindan-6-il)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta [d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

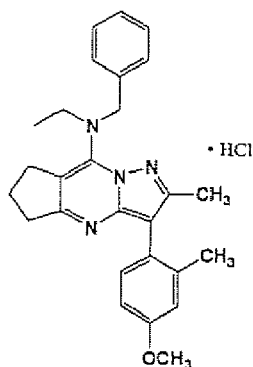


CCF: Rf 0,44 (benceno:acetato de etilo = 10:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 6,96 (s, 1H), 6,85 (s, 1H), 6,22 (d a, J = 10,5 Hz, 1H), 5,99 (s, 2H), 3,80 (m, 1H), 3,08 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,16 (m, 2H), 1,53-1,81 (m, 4H), 1,01 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

- 10 Ejemplo 2(76)

Clorhidrato de 8-(N-etil-N-bencilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

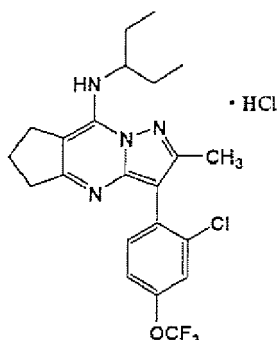


CCF: Rf 0,43 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,26-7,43 (m, 5H), 7,13 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 5,21 (s, 2H), 3,87 (q, J = 6,9 Hz, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,47 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 3,03 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,22 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,39 (t, J = 6,9 Hz, 3H).

Ejemplo 2(77)

- 20 Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-trifluorometoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

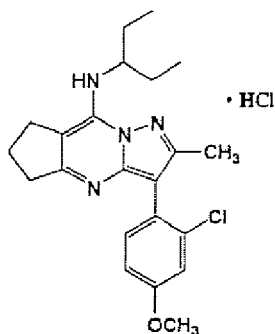


CCF: Rf 0,52 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, pirideno-d₅ (0,5 ml), CDCl₃ (0,1ml)): δ 7,71 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,57 (m, 1H), 7,28 (m, 1H), 6,77 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,74 (m, 1H), 2,95 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,85 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,46 (s, 3H), 1,98 (m, 2H), 1,64-1,48 (m, 4H), 0,92 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(78)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

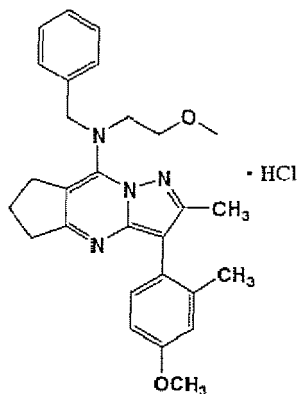


CCF: Rf 0,20 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, pirideno-d₅ (0,5 ml), CDCl₃ (0,1 ml)): δ 7,59 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,24 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,98 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 6,78 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,74 (m, 1H), 3,69 (s, 3H), 2,94 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,85 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,51 (s, 3H), 1,96 (m, 2H), 1,64-1,48 (m, 4H), 0,91 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(79)

15 Clorhidrato de 8-(N-bencil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

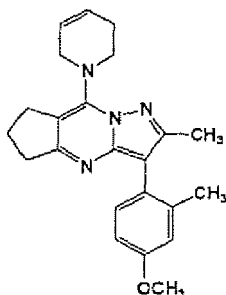


CCF: Rf 0,24 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,34 - 7,44 (m, 3H), 7,27 - 7,34 (m, 2H), 7,13 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 5,11 (s, 2H), 4,14 (t, J = 4,8 Hz, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,64 (t, J = 4,8 Hz, 2H), 3,49 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,29 (s, 3H), 3,07 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,23 (m, 2H), 2,19 (s, 3H).

Ejemplo 2(80)

5 8-(1,2,5,6-Tetrahidropiridil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

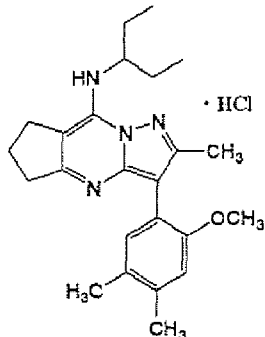


CCF: Rf 0,30 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 2,7, 8,1 Hz, CDCl₃), 5,97 (m, 1H), 5,83 (m, 1H), 4,21 (m, 2H), 3,85 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,07 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,89 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,41 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 2,11 (m, 2H).

Ejemplo 2(81)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metoxi-4,5-dimetilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

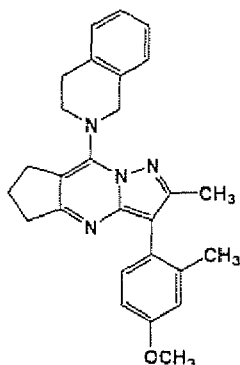


15 CCF: Rf 0,29 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (da, J = 10,2 Hz, 1 H), 7,04 (s, 1 H), 6,83 (s, 1H), 3,95 (m, 1H), 3,90 (s, 3H), 3,56 (t, J = 7,8 Hz, 2 H), 3,12 (t, J = 7,5 Hz, 2 H), 2,42 (s, 3 H), 2,31 (s, 3 H), 2,28 (m, 2 H), 2,24 (s, 3 H), 1,90 - 1,62 (m, 4 H), 1,04 (t, J = 7,5 Hz, 6 H).

Ejemplo 2(82)

20 8-(1,2,3,4-Tetrahydroisoquinolin-2-il)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

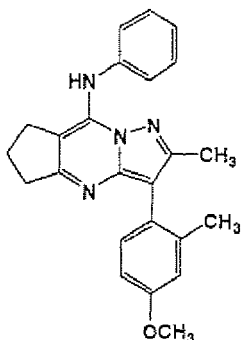


CCF: Rf 0,24 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,23- 7,18 (m, 3 H), 7,16 (d, J = 8,4 Hz, 1 H), 7,11 (m, 1 H), 6,86 (d, J = 2,4 Hz, 1 H), 6,79 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 4,86 (s, 2 H), 4,09 (t, J = 5,7 Hz, 2 H), 3,82 (s, 3 H), 3,08 (t, J = 5,7 Hz, 2 H), 2,97 (t, J = 7,2 Hz, 2 H), 2,89 (t, J = 7,8 Hz, 2 H), 2,33 (s, 3 H), 2,17 (s, 3 H), 2,08 (m, 2 H).

Ejemplo 2(83)

8-Fenilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

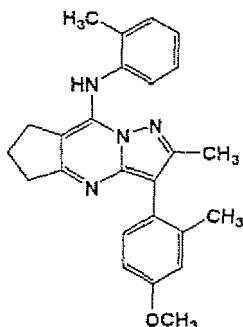


CCF: Rf 0,35 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,01 (a, 1H), 7,45 - 7,38 (m, 2H), 7,33 - 7,17 (m, 4H), 6,87 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,1, 2,4 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,89 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,30 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,21 (s, 3H), 2,02 - 1,90 (m, 2H).

Ejemplo 2(84)

8-(2-Metilfenil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



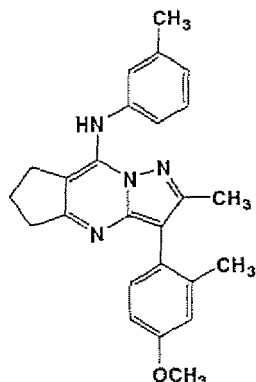
15

CCF: Rf 0,37 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,76 (a, 1H), 7,32 - 7,17 (m, 5H), 6,87 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,85 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,36 (s, 6H), 2,22 (s, 3H), 2,13 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 1,96 - 1,85 (m, 2H).

Ejemplo 2(85)

8-(3-Metilfenil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

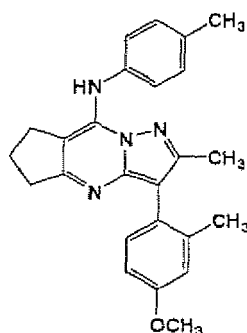


CCF: Rf 0,38 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,96 (a, 1H), 7,32 - 7,26 (m, 1H), 7,19 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,12 - 7,01 (m, 3H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,88 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,40 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 2,31 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,21 (s, 3H), 2,02 - 1,91 (m, 2H).

Ejemplo 2(86)

8-(4-Metilfenil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



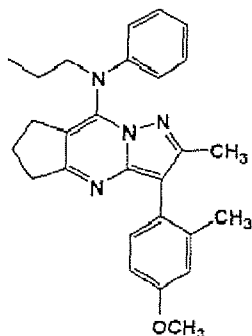
10

CCF: Rf 0,33 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,93 (a, 1H), 7,23 - 7,11 (m, 5H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,86 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,40 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 2,29 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,21 (s, 3H), 2,00 - 1,88 (m, 2H).

15 Ejemplo 2(87)

8-(N-Fenil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

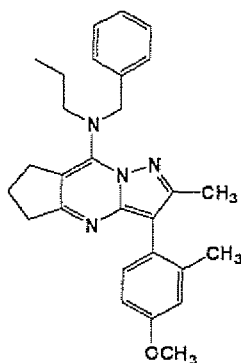


CCF: Rf 0,48 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,31 - 7,24 (m, 2H), 7,21 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,99 - 6,87 (m, 4H), 6,81 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,15 - 4,07 (m, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,92 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,31 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,05 - 1,94 (m, 2H), 1,82 - 1,68 (m, 2H), 0,96 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

5 Ejemplo 2(88)

8-(N-Bencil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

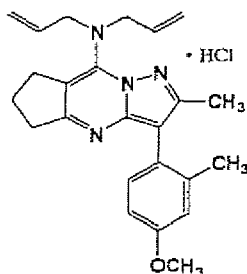


CCF: Rf 0,63 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,33 - 7,21 (m, 5H), 7,19 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,86 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,42 - 3,34 (m, 2H), 2,88 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,81 (t, J = 7,1 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 2,11 - 1,98 (m, 2H), 1,67 - 1,54 (m, 2H), 0,88 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(89)

Clorhidrato de 8-(N,N-dialilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



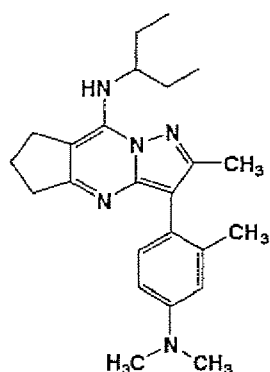
15

CCF: Rf 0,46 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,11 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 6,03 (m, 2H), 5,40 (d, J = 10,5 Hz, 2H), 5,35 (d, J = 18 Hz, 2H), 4,49 (d, J = 6,0 Hz, 4H), 3,83 (s, 3H), 3,47 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,08 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,23 (m, 2H), 2,18 (s, 3H).

20 Ejemplo 2(90)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-dimetilaminofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

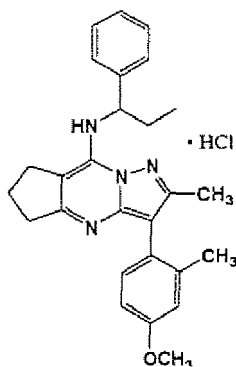


CCF: Rf 0,17 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,11 (d, J = 8,1 Hz, 1 H), 6,70 (d, J = 2,7 Hz, 1 H), 6,64 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1 H), 6,19 (d, J = 10,2 Hz, 1 H), 3,80 (m, 1 H), 3,08 (t, J = 7,5 Hz, 2 H), 2,95 (s, 6 H), 2,89 (t, J = 7,5 Hz, 2 H), 2,32 (s, 3 H), 2,18 (s, 3 H), 2,18 - 2,08 (m, 2 H), 1,80 - 1,56 (m, 4 H), 1,01 (sa, 6 H).

Ejemplo 2(91)

Clorhidrato de 8-(1-fenilpropilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

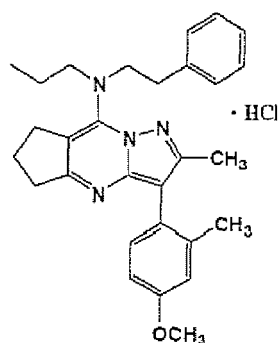


10 CCF: Rf 0,45 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,83 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,27 - 7,48 (m, 5H), 7,12 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,88 (m, 1H), 6,81 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 5,10 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,41 (m, 2H), 3,16 (m, 1H), 2,83 (m, 1H), 2,32 (s, 3H), 2,20 y 2,19 (s, 3H total), 2,12 (m, 4H), 1,12 y 1,01 (t, J = 7,2 Hz, 3H total).

Ejemplo 2(92)

15 Clorhidrato de 8-(N-(2-feniletil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

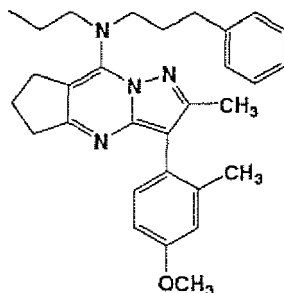


CCF: Rf 0,35 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,23 - 7,05 (m, 6H), 6,90 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 4,33 (t, J = 6,6 Hz, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,71 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 3,37 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,98 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,77 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 2,20 - 2,06 (m, 2H), 1,81 - 1,68 (m, 2H), 0,97 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

5 Ejemplo 2(93)

8-(N-(3-Fenilpropil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

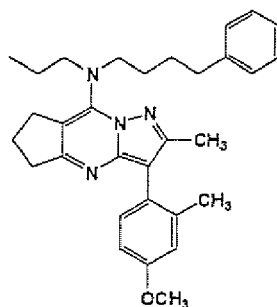


CCF: Rf 0,40 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,26 - 7,05 (m, 6H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,66 - 3,53 (m, 4H), 2,88 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,87 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,62 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,15 - 2,04 (m, 2H), 1,95 - 1,83 (m, 2H), 1,61 - 1,49 (m, 2H), 0,88 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(94)

15 8-(N-(4-Fenilbutil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

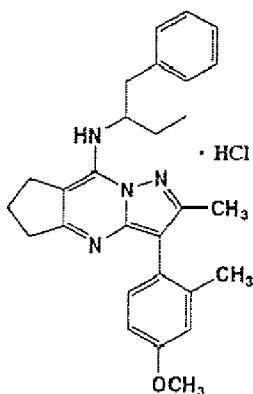


CCF: Rf 0,48 (hexano:acetato de etilo = 3: 1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,25 - 7,05 (m, 6H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,63 (t, J = 6,6 Hz, 2H), 3,57 - 3,49 (m, 2H), 2,90 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,88 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,57 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,15 - 2,05 (m, 2H), 1,66 - 1,49 (m, 6H), 0,88 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(95)

Clorhidrato de 8-(1-fenil-2-butil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



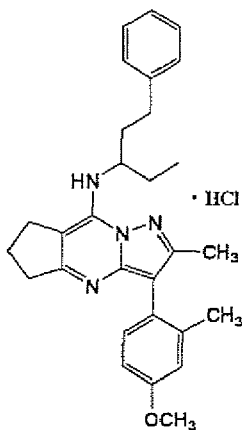
CCF: Rf 0,41 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, DMSO-d₆): δ 9,24 (m, 1H), 7,04 - 7,30 (m, 6H), 6,95 (sa, 1H), 6,86 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 4,20 (sa, 1H), 3,78 (s, 3H), 2,87 - 3,17 (m, 3H), 2,64 - 2,87 (m, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,82 - 2,18 (m, 5H), 1,63 - 1,82 (m, 2 H), 0,93 (t a, J = 6,9 Hz, 3H).

5

Ejemplo 2(96)

Clorhidrato de 8-(1-fenil-3-pentil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

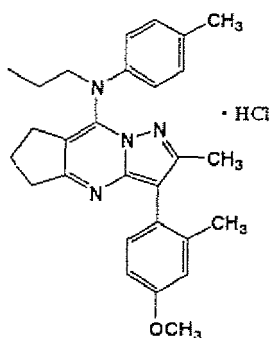


10 CCF: Rf 0,43 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, DMSO-d₆): δ 8,53 (m, 1H), 7,09 - 7,28 (m, 6H), 6,96 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,85 (dd, J = 3,0, 8,4 Hz, 1H), 4,10 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 2,89 - 3,02 (m, 3H), 2,68 - 2,85 (m, 3H), 2,25 (s, 3H), 2,00 - 2,22 (m, 7H), 1,79 (m, 2H), 0,93 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(97)

15 Clorhidrato de 8-(N-(4-metilfenil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



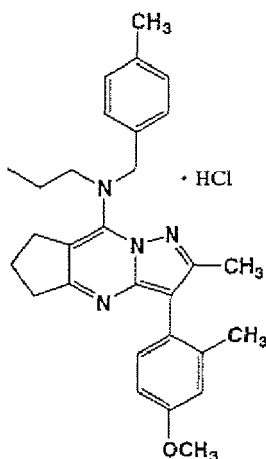
CCF: Rf 0,43 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,27 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,13 - 7,22 (m, 3H), 6,90 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,84 (dd, J = 2,4, 8,7 Hz, 1H), 4,46 (m, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,35 (m, 2H), 2,43 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,77 - 1,97 (m, 6H), 0,98 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

5

Ejemplo 2(98)

Clorhidrato de 8-(N-(4-metilfenil)metil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

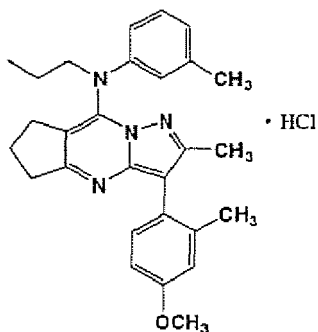


10 CCF: Rf 0,45 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,11-7,21 (m, 5H), 6,90 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 2,7, 8,7 Hz, 1H), 5,13 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,72 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,48 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 3,01 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 2,22 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,77 (m, 2H), 0,94 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(99)

15 Clorhidrato de 8-(N-(3-metilfenil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

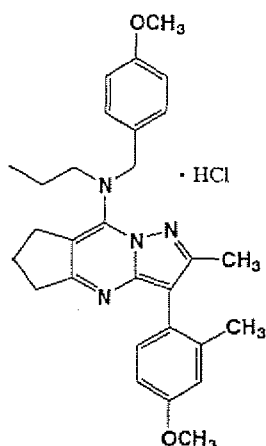


CCF: Rf 0,41 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,36 (m, 1H), 7,06 - 7,24 (m, 4H), 6,91 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,84 (dd, J = 2,4, 8,1 Hz, 1H), 4,46 (m, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,36 (m, 2H), 2,42 (s, 3H), 2,32 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 1,77 - 2,00 (m, 6H), 0,99 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

5 Ejemplo 2(100)

Clorhidrato de 8-(N-(4-metoxifenil)metil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

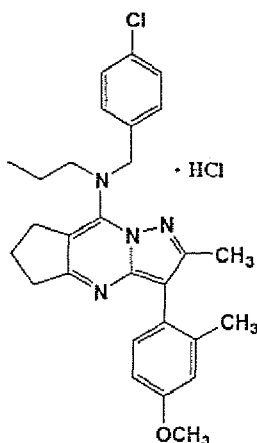


CCF: Rf 0,26 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,18 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,13 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 6,90 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 3,0, 8,4 Hz, 1H), 5,10 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,82 (s, 3H), 3,70 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,49 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 3,01 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,22 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,75 (m, 2H), 0,93 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(101)

- 15 Clorhidrato de 8-(N-(4-clorofenil)metil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

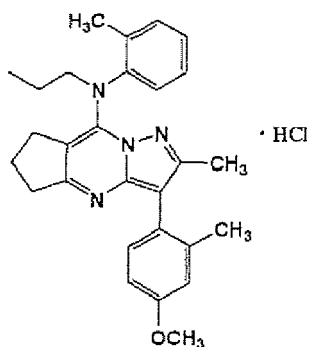


CCF: Rf 0,26 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,37 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,24 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,12 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 5,15 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,68 (m, 2H), 3,50 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,02 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,25 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,74 (m, 2H), 0,93 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(102)

Clorhidrato de 8-(N-(2-metilfenil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



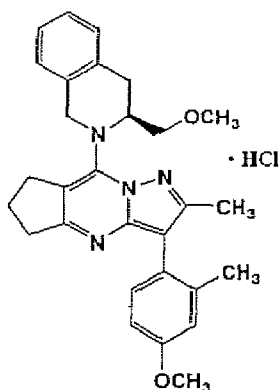
CCF: Rf 0,46 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,27 - 7,45 (m, 4H), 7,16 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,84 (dd, J = 2,4, 8,4 Hz, 1H), 4,53 (m, 1H), 4,37 (m, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,34 (m, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,50 - 2,07 (m, 6H), 0,97 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

5

Ejemplo 2(103)

Clorhidrato de 8-((3S)-3-metoximetil-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-2-il)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

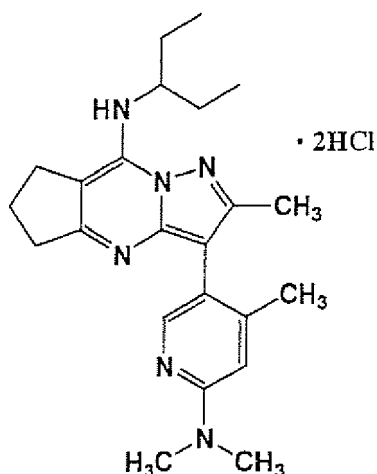


10 CCF: Rf 0,56 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,30 - 7,05 (m, 5H), 6,90 - 6,75 (m, 2H), 5,48 (m, 1H), 5,03 (d, J = 15,6 Hz, 1H), 4,72 (dd, J = 15,6, 3,9 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,33 y 3,32 (s, 3H), 3,87 - 3,05 (m, 7H), 2,82 (d, J = 15,6 Hz, 1H), 2,40 - 2,10 (m, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,25 y 2,11 (s, 3H).

Ejemplo 2(104)

15 Diclorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-dimetilamino-4-metilpiridin-5-il)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

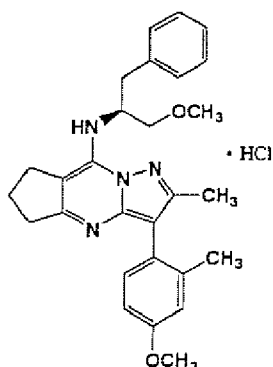


CCF: Rf 0,42 (cloroformo:metanol = 20:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 8,01 (s, 1H), 7,32 (d, J = 10,2 Hz, 1H), 6,85 (s, 1H), 4,00 (m, 1H), 3,41 (s, 6H), 3,40 (m, 2H), 3,17 (m, 2H), 2,37 (s, 3H), 2,33 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 1,65 - 1,95 (m, 4H), 1,07 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 1,06 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(105)

Clorhidrato de 8-((2S)-1-metoxi-3-fenil-2-propil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

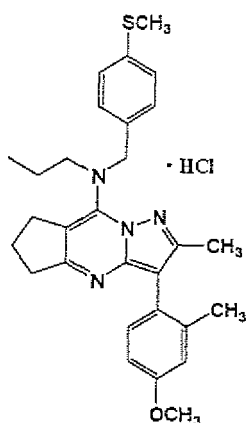


10 CCF: Rf 0,26 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,77 (m, 1H), 7,25 - 7,36 (m, 3H), 7,16 - 7,23 (m, 2H), 7,11 (m, 1H), 6,88 (m, 1H), 6,80 (m, 1H), 4,44 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,53 - 3,68 (m, 2H), 3,47 y 3,46 (s, 3H), 3,38 (m, 2H), 3,11 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 3,08 (m, 1H), 2,81 (m, 1H), 2,31 (s, 3H), 2,20 y 2,17 (s, 3H), 2,15 (m, 2H).

Ejemplo 2(106)

15 Clorhidrato de 8-(N-(4-metilfenil)metil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

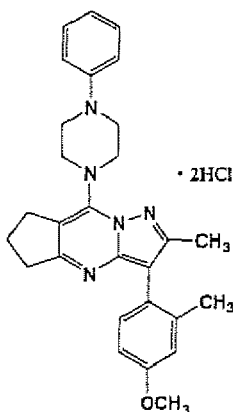


CCF: Rf 0,50 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,25 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,18 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,13 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 2,4, 8,1 Hz, 1H), 5,13 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,70 (m, 2H), 3,50 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,01 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,50 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 2,23 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,75 (m, 2H), 0,93 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(107)

Diclorhidrato de 8-(4-fenilpiperazin-1-il)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

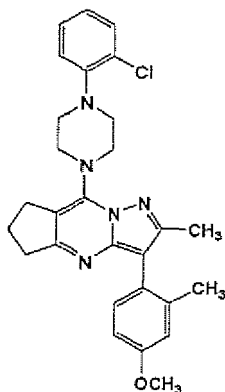


10 CCF: Rf 0,30 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, DMSO-d₆): δ 7,30 - 7,38 (m, 2H), 7,21 - 7,29 (m, 2H), 7,12 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,00 (da, J = 6,9 Hz, 1H), 6,95 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,86 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 4,22 (sa, 4H), 3,79 (s, 3H), 3,53 (sa, 4H), 3,14 (m, 2H), 2,97 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,21 (s, 3H), 2,15 (m, 2H), 2,06 (s, 3H).

Ejemplo 2(108)

15 8-(4-(2-Clorofenil)piperazin-1-il)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

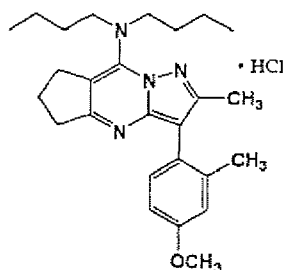


CCF: Rf 0,38 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,41 (dd, J = 1,5, 7,8 Hz, 1H), 7,28 (m, 1H), 7,16 (d, J=8,1 Hz, 1H), 7,15 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,03 (m, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 2,7, 8,1 Hz, 1H), 3,90 (m, 4H), 3,82 (s, 3H), 3,33 (t, J = 4,8 H, 4H), 3,16 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,14 (m, 2H).

Ejemplo 2(109)

Clorhidrato de 8-(N,N-dibutilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

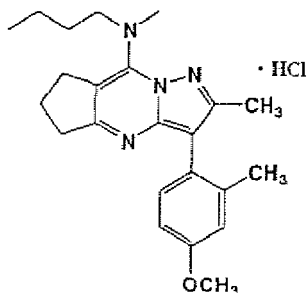


10 CCF: Rf 0,57 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,12 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 2,4, 7,8 Hz, 1H), 3,90 (t, J = 7,5 Hz, 4H), 3,83 (s, 3H), 3,48 (m, 2H), 3,02 (m, 2H), 2,27 (s, 3H), 2,25 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,71 (m, 4H), 1,38 (m, 4H), 0,97 (t, J = 6,9 Hz, 6H).

Ejemplo 2(110)

15 Clorhidrato de 8-(N-metil-N-butilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



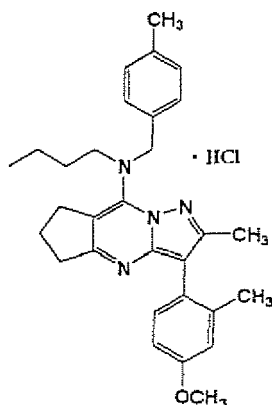
CCF: Rf 0,36 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,10 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 3,0, 8,1 Hz, 1H), 3,97 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,51 (s, 3H), 3,45 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 8,12 (t, J= 6,9 Hz, 2H), 2,26 (s, 3H), 2,23 (m, 2 H), 2,18 (s,

3H), 1,85 (m, 2H), 1,40 (m, 2H), 0,99 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(111)

Clorhidrato de 8-(N-(4-metilfenil)metil-N-butilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



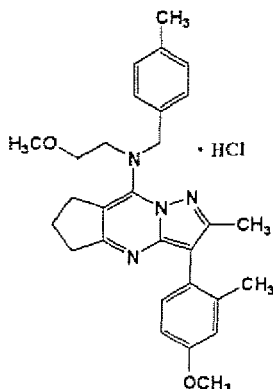
5

CCF: Rf 0,53 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,10 - 7,21 (m, 5H), 6,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 2,4, 8,1 Hz, 1H), 5,13 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,77 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 3,48 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,01 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 2,21 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,73 (m, 2H), 1,34 (m, 2H), 0,93 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

10 Ejemplo 2(112)

Clorhidrato de 8-(N-(4-metilfenil)metil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

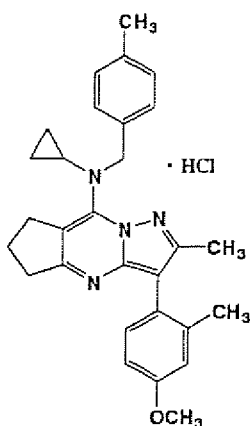


CCF: Rf 0,23 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,25 - 7,05 (m, 5H), 6,98 - 6,78 (m, 2H), 5,06 (s, 2H), 4,22 - 4,03 (m, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,75 - 3,58 (m, 2H), 3,58 - 3,38 (m, 2H), 3,30 (s, 3H), 3,20 - 2,90 (m, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,21 (m, 2H), 2,19 (s, 3H).

Ejemplo 2(113)

20 Clorhidrato de 8-(N-ciclopropil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

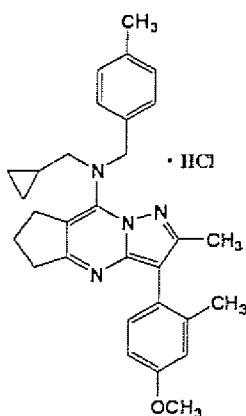


CCF: Rf 0,35 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,25 - 6,95 (m, 5H), 6,95 - 6,73 (m, 2H), 5,40 - 5,15 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,65 - 3,30 (m, 2H), 3,30 - 2,95 (m, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 2,30 - 2,10 (m, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,10 - 0,80 (m, 4H).

5 Ejemplo 2(114)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

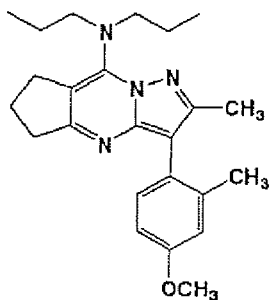


CCF: Rf 0,37 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,30 - 7,00 (m, 5H), 7,00 - 6,75 (m, 2H), 5,24 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,80 - 3,60 (m, 2H), 3,60 - 3,35 (m, 2H), 3,20 - 2,90 (m, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 2,22 (s, 2H), 2,11 (s, 3H), 1,38 - 1,05 (m, 1H), 0,75 - 0,50 (m, 2H), 0,35 - 0,10 (m, 2H).

Ejemplo 2(115)

8-(N,N-Dipropilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



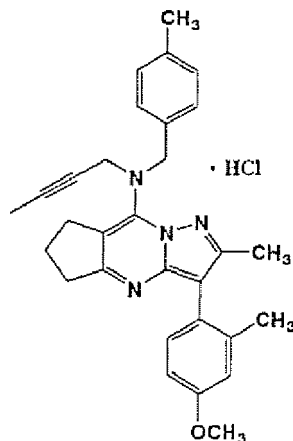
15

CCF: Rf 0,59 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,17 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 2,4, 8,4 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,56 (m, 4H), 2,95 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,90 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,13 (m, 2H), 1,58 (m, 4H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(116)

- 5 Clorhidrato de 8-(N-(4-metilfenil)metil-N-(2-butilil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

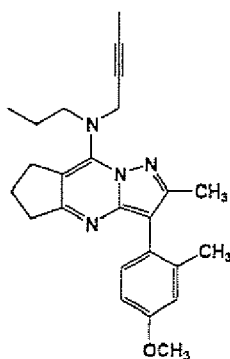


CCF: Rf 0,47 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,33 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,19 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,11 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 2,7, 8,7 Hz, 1H), 5,27 (d, J = 15,0 Hz, 1H), 5,24 (d, J = 15,0 Hz, 1H), 4,41 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,51 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,22 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,37 (s, 3H), 2,28 (s, 3H), 2,25 (m, 2H), 2,17 (s, 3H), 1,91 (t, J = 2,4 Hz, 3H).

Ejemplo 2(117)

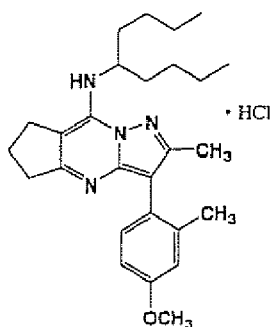
8-(N-Propil-N-(2-butilil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



- 15 CCF: Rf 0,55 (hexano:acetato de etilo = 2:1);
- RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 2,7, 8,1 Hz, 1H), 4,40 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,55 (m, 2H), 3,11 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,13 (m, 2H), 1,81 (t, J = 2,4 Hz, 3H), 1,66 (m, 2H), 0,95 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

20 Ejemplo 2(118)

Clorhidrato de 8-(5-nonilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

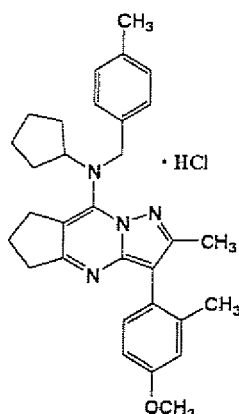


CCF: Rf 0,58 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,33 (da, J = 10,5 Hz, 1H), 7,12 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 2,7, 8,7 Hz, 1H), 4,10 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,49 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 3,12 (t, J = 6,6 Hz, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,27 (m, 2H), 2,20 (s, 3H), 1,61 - 1,88 (m, 4H), 1,30 - 1,53 (m, 8H), 0,94 (m, 6H).

Ejemplo 2(119)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopentil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

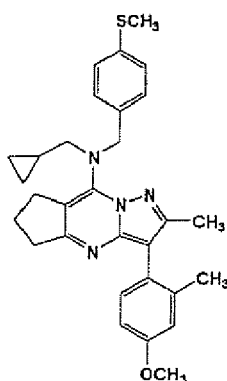


10 CCF: Rf 0,38 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CD_3OD): δ 7,20 - 6,98 (m, 5H), 6,93 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,85 (dd, J = 8,6, 2,4 Hz, 1H), 5,20 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 5,09 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 5,02 - 4,70 (m, 1H), 3,81 (s, 3H), 3,17 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,98 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 2,40 - 1,60 (m, 10H).

Ejemplo 2(120)

15 8-(N-Ciclopropilmetil-N-(4-metiltiofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

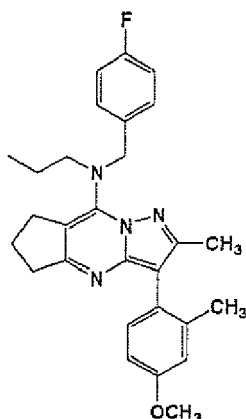


CCF: Rf 0,85 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,28 - 7,16 (m, 5H), 6,87 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 3,0, 8,4 Hz, 1H), 4,89 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,38 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 2,96 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,89 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,47 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,09 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,10 - 0,95 (m, 1H), 0,52 - 0,42 (m, 2H), 0,10 - 0,05 (m, 2H).

5 Ejemplo 2(121)

8-(N-(4-Fluorofenil)metil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

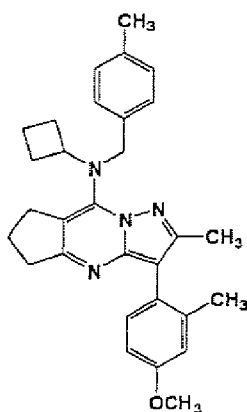


CCF: Rf 0,87 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,28 - 7,16 (m, 3H), 7,03 - 6,95 (m, 2H), 6,87 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 2,4, 8,4 Hz, 1H), 4,80 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,40 - 3,32 (m, 2H), 2,89 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,81 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 2,07 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,62 - 1,50 (m, 2H), 0,88 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(122)

15 8-(N-Ciclobutil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

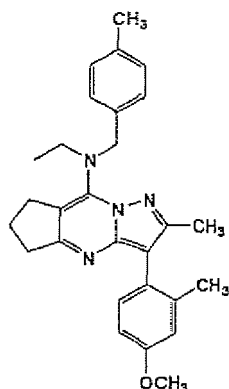


CCF: Rf 0,48 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,19 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,02 (d, J = 7,5 Hz, 2H), 6,89 (d, J = 7,5 Hz, 2H), 6,87 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,4, 3,0 Hz, 1H), 4,90 - 4,70 (m, 2H), 4,08 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,84 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,61 (m, 2H), 2,39 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,20 - 2,06 (m, 4H), 1,96 (m, 2H), 1,80 - 1,60 (m, 2H).

Ejemplo 2(123)

8-(N-Etil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

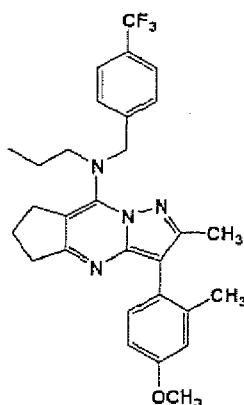


CCF: Rf 0,69 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,19 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,14 - 7,06 (m, 4H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 2,7, 8,1 Hz, 1H), 4,81 (s, 2H), 3,87 (s, 3H), 3,47 (q, J = 6,9 Hz, 2H), 2,88 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,81 (ta, J = 7,8 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,33 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 2,04 (quint., J = 7,8 Hz, 2H), 1,18 (t, J = 6,9 Hz, 3H).

Ejemplo 2(124)

8-(N-Propil-N-(4-trifluorometilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

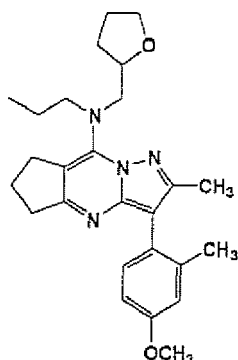


10 CCF: Rf 0,79 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,57 (da, J = 8,1 Hz, 2H), 7,44 (da, J = 8,1 Hz, 2H), 7,18 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 2,4, 8,7 Hz, 1H), 4,91 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,49 - 3,25 (m, 2H), 2,90 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,87 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,18 - 2,00 (m, 2H), 1,62 - 1,50 (m, 2H), 0,88 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(125)

15 8-(N-Propil-N-(tetrahidrofuran-2-il)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

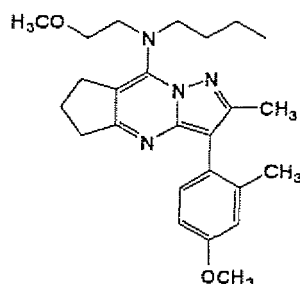


CCF: Rf 0,31 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 2,7, 8,1 Hz, 1H), 3,84 - 4,06 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,64 - 3,80 (m, 3H), 3,50 - 3,64 (m, 2H), 2,99 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,13 (m, 2H), 1,74 - 2,00 (m, 3H), 1,42 - 1,65 (m, 3H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(126)

8-(N-Butil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

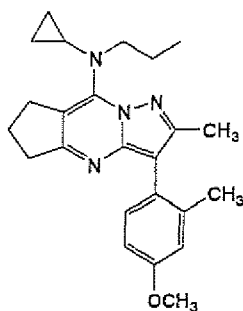


CCF: Rf 0,30 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 3,92 (t, J = 5,7 Hz, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,57 (m, 2H), 3,50 (t, J = 5,7 Hz, 2H), 3,28 (s, 3H), 2,98 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,13 (m, 2H), 1,55 (m, 2H), 1,33 (m, 2H), 0,90 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(127)

8-(N-Propil-N-ciclopropilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

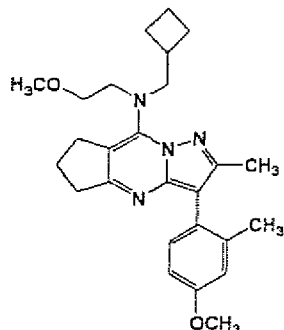


15 CCF: Rf 0,45 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 3,85 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,19 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,07 (m, 1H), 2,92 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,12 (m, 2H), 1,62 (m, 2H), 0,89 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,80 - 0,68 (m, 4H).

Ejemplo 2(128)

8-(N-Ciclobutilmetil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

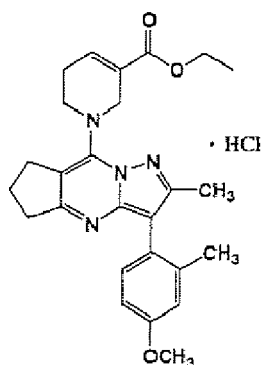


5 CCF: Rf 0,57 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,17 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,82 (t, J = 6,0 Hz, 2H), 3,64 (d, J = 7,5 Hz, 2H), 3,49 (t, J = 6,0 Hz, 2H), 3,28 (s, 3H), 2,96 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,62 - 2,50 (m, 1H), 2,32 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,20 - 2,05 (m, 2H), 2,06 - 1,58 (m, 6H).

Ejemplo 2(129)

10 Clorhidrato de 8-(3-etoxicarbonil-1,2,5,6-tetrahidropiridil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

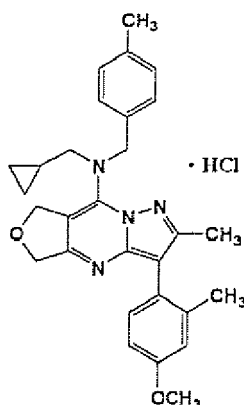


CCF: Rf 0,27 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,27 (m, 1H), 7,09 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 2,7, 8,1 Hz, 1H), 4,62 (m, 2H), 4,27 (q, J = 6,9 Hz, 2H), 4,20 (t, J = 5,7 Hz, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,47 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 3,16 (t, J = 6,0 Hz, 2H), 2,85 (m, 2H), 2,27 (s, 3H), 2,26 (m, 2H), 2,17 (s, 3H), 1,34 (t, J = 6,9 Hz, 3H).

Ejemplo 2(130)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

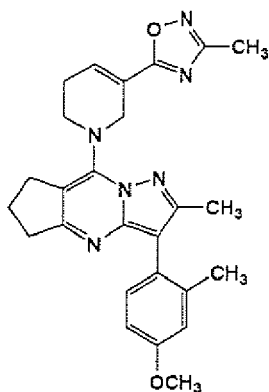


CCF: Rf 0,68 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,21 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,16 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,13 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 5,41 (sa, 2H), 5,27 (m, 2H), 5,22 (sa, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,74 (m, 2H), 2,37 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,24 (m, 1H), 0,67 (m, 2H), 0,24 (m, 2H).

Ejemplo 2(131)

8-(3-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1,2,5,6-tetrahidropiridil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

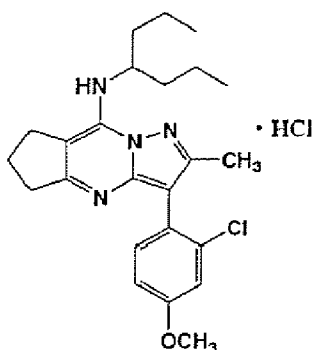


10 CCF: Rf 0,18 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (m, 1H), 7,15 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 2,7, 8,7 Hz, 1H), 4,57 (m, 2H), 3,94 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,09 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,71 (m, 2H), 2,42 (s, 3H), 2,32 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,14 (m, 2H).

Ejemplo 2(132)

15 Clorhidrato de 8-(4-heptilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

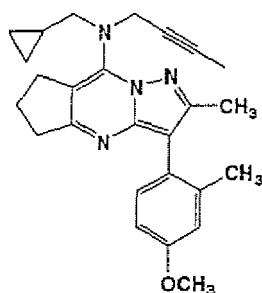


CCF: Rf 0,48 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,37 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 2,4, 8,7 Hz, 1H), 4,13 (m, 1H), 3,85 (s, 3H), 3,35 - 3,66 (m, 2H), 3,13 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,29 (m, 2H), 1,60 - 1,84 (m, 4 H), 1,34 - 1,60 (m, 4H), 1,00 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,99 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(133)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-(2-butiril)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

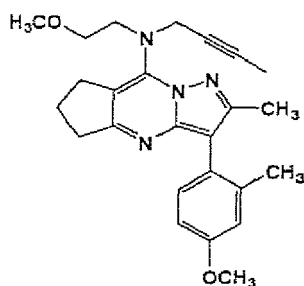


10 CCF: Rf 0,73 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 4,54 (sa, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,53 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 3,13 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,17 - 2,08 (m, 2H), 1,81 (t, J = 2,7 Hz, 3H), 1,20 - 1,16 (m, 1H), 0,60 - 0,52 (m, 2H), 0,36 - 0,28 (m, 2H).

Ejemplo 2(134)

15 8-(N-(2-Metoxietil)N-(2-butiril)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

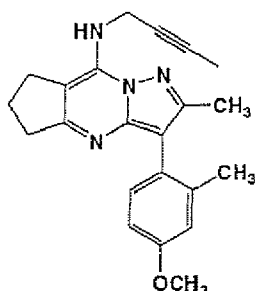


CCF: Rf 0,13 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,44 - 4,39 (m, 2H), 3,92 (t, J = 6,0 Hz, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,65 (t, J = 6,0 Hz, 2H), 3,34 (s, 3H), 3,13 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,17 - 2,08 (m, 2H), 1,81 (t, J = 2,7 Hz, 3H).

Ejemplo 2(135)

8-(2-Butirilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

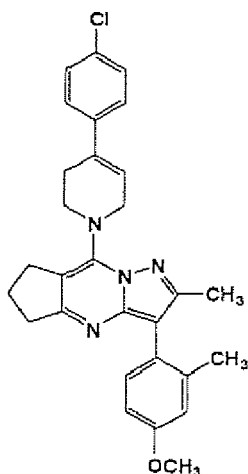


CCF: Rf 0,80 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 6,53 (t, J = 6,9 Hz, 1H), 4,36 - 4,30 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,25 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,90 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,20 - 2,08 (m, 2H), 1,83 (t, J = 2,1 Hz, 3H).

Ejemplo 2(136)

8-(4-(4-Clorofenil)-1,2,5,6-tetrahidropiridil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



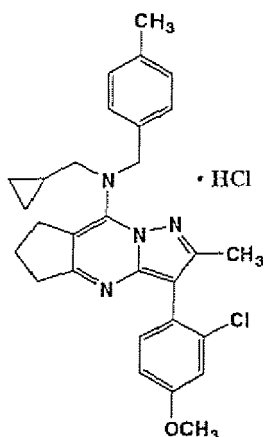
10

CCF: Rf 0,10 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,42 - 7,30 (m, 4H), 7,16 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,1, 2,4 Hz, 1H), 6,22 - 6,18 (m, 1H), 4,50 - 4,32 (m, 2H), 4,10 - 3,90 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,10 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,82 - 2,69 (m, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,17 - 2,08 (m, 2H).

15 Ejemplo 2(137)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

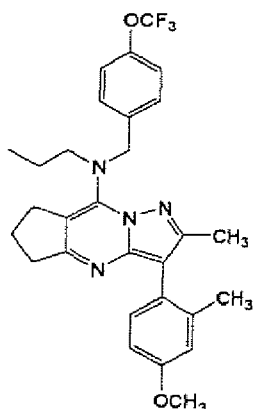


CCF: Rf 0,53 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,36 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,18 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,15 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,08 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,25 (d, J = 15,9 Hz, 1H), 5,21 (d, J = 15,9 Hz, 1H), 3,85 (s, 3H), 3,70 (m, 2H), 3,36 - 3,62 (m, 2H), 3,07 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 2,23 (m, 2H), 1,23 (m, 1H), 0,63 (m, 2H), 0,18 (m, 2H).

Ejemplo 2(138)

8-(N-Propil-N-(4-trifluorometiloxifenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



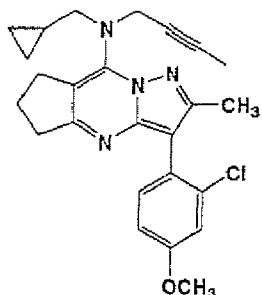
10

CCF: Rf 0,55 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (da, J = 8,7 Hz, 2H), 7,18 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,15 (da, J = 8,7 Hz, 2H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,84 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,41 - 3,35 (m, 2H), 2,89 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,83 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,19 - 2,00 (m, 2H), 1,66 - 1,54 (m, 2H), 0,88 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

15 Ejemplo 2(139)

8-(N-(2-Butiril)-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

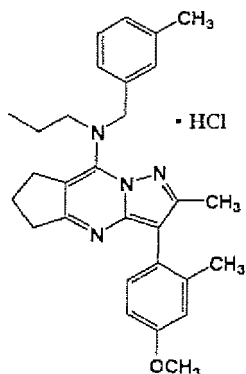


CCF: Rf 0,40 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,05 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,88 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 4,54 (q, J = 2,1 Hz, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,52 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 3,13 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,92 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,37 (s, 3H), 2,13 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,81 (t, J = 2,1 Hz, 3H), 1,16 - 1,02 (m, 1H), 0,60 - 0,52 (m, 2H), 0,32 - 0,26 (m, 2H).

Ejemplo 2(140)

Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(3-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

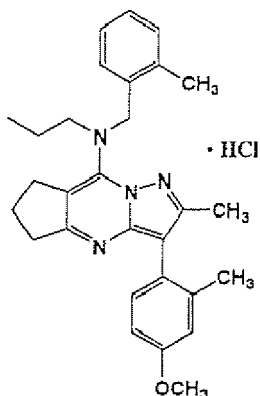


10 CCF: Rf 0,52 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,27 (m, 1H), 7,15 (m, 1H), 7,13 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,05 (m, 2H), 6,90 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 2,7, 8,1 Hz, 1H), 5,14 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,74 (m, 2H), 3,49 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 3,02 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 2,22 (m, 2H), 2,20 (s, 3H), 1,77 (m, 2H), 0,94 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(141)

15 Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(2-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

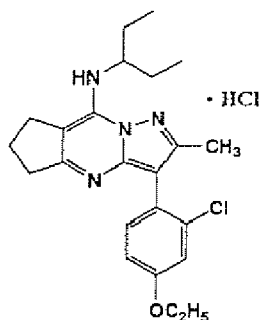


CCF: Rf 0,52 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,18 - 7,30 (m, 4H), 7,13 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 2,4, 8,1 Hz, 1H), 5,13 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,78 (m, 2H), 3,49 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 3,00 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 2,21 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,79 (m, 2H), 0,94 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(142)

5 Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-etoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

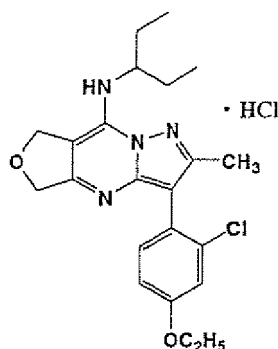


CCF: Rf 0,49 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,34 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,95 (dd, J = 2,4, 8,7 Hz, 1H), 4,07 (m, 2H), 3,99 (m, 1H), 3,34 - 3,65 (m, 2H), 3,13 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,29 (m, 2H), 1,62 - 1,93 (m, 4H), 1,42 (t, J = 6,9 Hz, 3H), 1,06 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 1,05 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(143)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-etoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

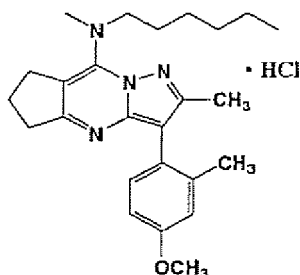


CCF: Rf 0,40 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,52 (da, J = 10,2 Hz, 1H), 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,95 (dd, J = 2,4, 8,4 Hz, 1H), 5,49 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 5,39 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 5,28 (sa, 2H), 4,07 (m, 2H), 3,40 (m, 1H), 2,40 (s, 3H), 1,68 - 1,98 (m, 4H), 1,43 (t, J = 6,9 Hz, 3H), 1,07 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 1,06 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(144)

20 Clorhidrato de 8-(N-metil-N-hexilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

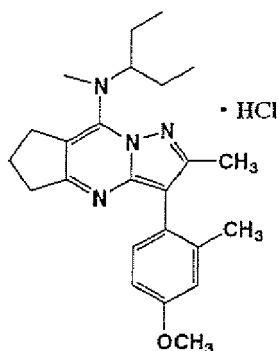


CCF: Rf 0,09 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,11 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 4,01 - 3,95 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,51 (s, 3H), 3,51 - 3,42 (m, 2H), 3,18 - 3,06 (m, 2H), 2,26 (s, 3H), 2,26 - 2,18 (m, 2H), 2,18 (s, 3H), 1,96 - 1,80 (m, 2H), 1,44 - 1,25 (m, 6H), 0,90 (ta, J = 6,6 Hz, 3H).

Ejemplo 2(145)

Clorhidrato de 8-(N-metil-N-(3-pentil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

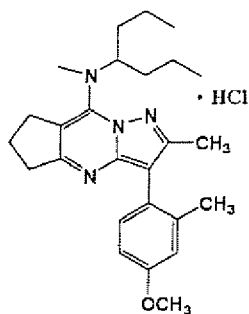


10 CCF: Rf 0,47 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,11 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (m, 1H), 4,55 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,46 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,27 (s, 3H), 3,10 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,26 (s, 3H), 2,45 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,76 - 1,98 (m, 4H), 1,01 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(146)

15 Clorhidrato de 8-(N-metil-N-(4-heptil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

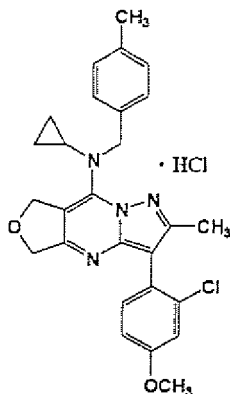


CCF: Rf 0,51 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,11 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 3,0, 8,4 Hz, 1H), 4,80 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,47 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,27 (s, 3H), 3,09 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,25 (s, 3H), 2,24 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,64 - 1,94 (m, 4H), 1,28 - 1,58 (m, 4H), 0,97 (t, J=7,2 Hz,6H).

Ejemplo 2(147)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

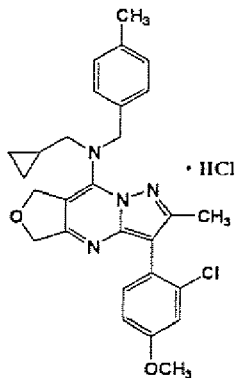


5 CCF: Rf 0,54 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,34 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,11 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,09 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,02 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 6,94 (dd, J = 2,4, 8,4 Hz, 1H), 5,18 - 5,30 (m, 4H), 5,15 (s, 2H), 3,85 (s, 3H), 2,67 (m, 1H), 2,41 (s, 3H), 2,33 (s, 3H), 0,85 - 1,00 (m, 4H).

Ejemplo 2(148)

10 Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

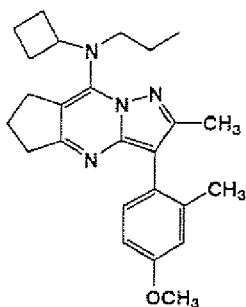


CCF: Rf 0,58 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,35 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,19 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,17 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,08 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 5,10 - 5,50 (m, 6H), 3,85 (s, 3H), 3,69 (m, 2H), 2,37 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 1,21 (m, 1H), 0,65 (m, 2H), 0,22 (m, 2H).

Ejemplo 2(149)

8-(N-Ciclobutil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

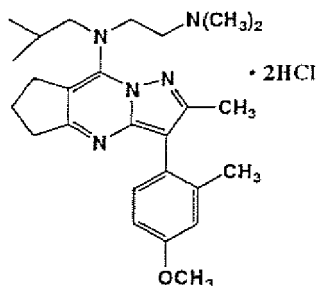


CCF: Rf 0,45 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,17 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 4,35 (quint., J = 7,5 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,69 - 3,10 (m, 2H), 2,94 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,90 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,22 - 2,02 (m, 9H), 1,78 - 1,58 (m, 2H), 1,39 (sext., J = 7,8 Hz, 2H), 0,84 (t, J = 7,8 Hz, 3H).

Ejemplo 2(150)

Diclorhidrato de 8-(N-isobutil-N-(2-dimetilaminoetil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

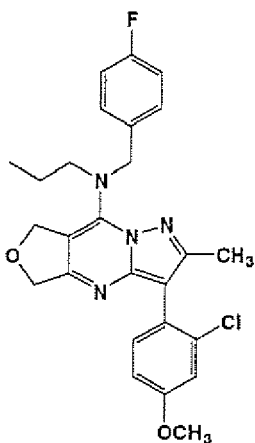


10 CCF: Rf 0,63 (acetato de etilo:ácido acético:agua = 3:1:1);

RMN (300 MHz, DMSO-d_6): δ 7,11 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,91 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,08 - 3,98 (m, 2H), 3,78 (s, 3H), 3,50 - 3,42 (m, 2H), 3,42 - 3,32 (m, 2H), 3,01 (ta, J = 6,9 Hz, 2H), 2,87 (ta, J = 7,8 Hz, 2H), 2,79 (s, 3H), 2,77 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 2,18 - 2,00 (m, 2H), 2,08 (s, 3H), 1,80 - 1,64 (m, 1H), 0,83 (d, J = 6,6 Hz, 6H).

Ejemplo 2(151)

15 8-(N-Propil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

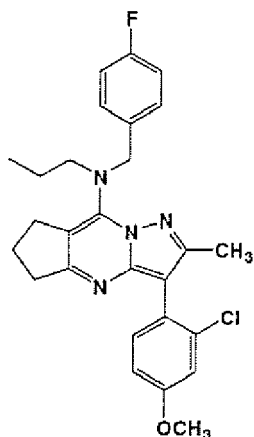


CCF: Rf 0,34 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,31 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,28 - 7,24 (m, 2H), 7,08 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 7,05 - 6,97 (m, 2H), 6,90 (dd, J = 8,7, 3,0 Hz, 1H), 5,09 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 4,89 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,33 - 3,27 (m, 2H), 2,40 (s, 3H), 1,63 (sext., J = 7,8 Hz, 2H), 0,39 (t, J = 7,8 Hz, 3H).

Ejemplo 2(152)

- 5 8-(N-Propil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

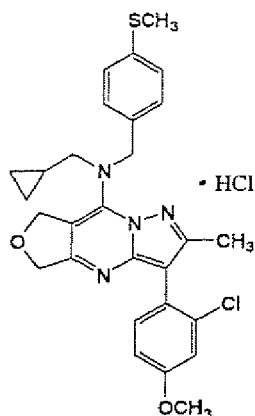


CCF: Rf 0,36 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,28 - 7,20 (m, 2H), 7,07 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,02 - 6,94 (m, 2H), 6,89 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,80 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,36 (ta, J = 7,5 Hz, 2H), 2,90 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,82 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,39 (s, 3H), 2,07 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,68 - 1,48 (m, 2H), 0,87 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(153)

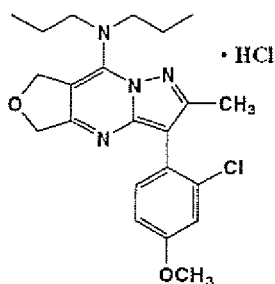
Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-metiltiofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



- 15 CCF: Rf 0,67 (hexano:acetato de etilo = 1:1);
- 20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,35 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,27 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,22 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,09 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 5,48 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 5,37 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 5,33 (d, J = 15,9 Hz, 1H), 5,24 (s, 2H), 5,24 (d, J = 15,9 Hz, 1H), 3,85 (s, 3H), 3,69 (m, 2H), 2,50 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 1,19 (m, 1H), 0,69 (m, 2H), 0,24 (m, 2H).

Ejemplo 2(154)

Clorhidrato de 8-(N,N-dipropilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

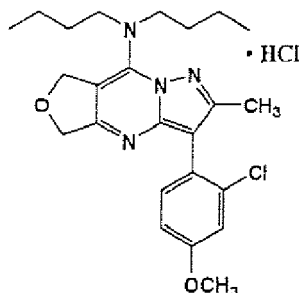


CCF: Rf 0,69 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,33 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 2,4, 8,7 Hz, 1H), 5,48 (td, J = 1,8, 16,8 Hz, 1H), 5,36 (td, J = 1,8, 16,8 Hz, 1H), 5,21 (t, J = 1,8 Hz, 2H), 3,85 (m, 4H), 3,85 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 1,83 (m, 4H), 1,02 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(155)

Clorhidrato de 8-(N,N-dibutilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

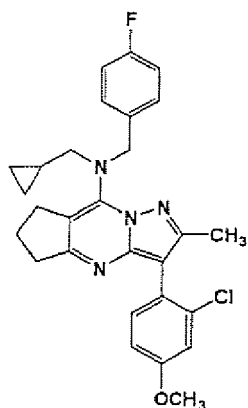


CCF: Rf 0,74 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,34 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 2,4, 8,4 Hz, 1H), 5,47 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 5,36 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 5,21 (s, 2H), 3,88 (m, 4H), 3,85 (s, 3H), 2,34 (s, 3H), 1,79 (m, 4H), 1,42 (m, 4H), 1,00 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(156)

15 8-(N-Ciclopropilmetil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



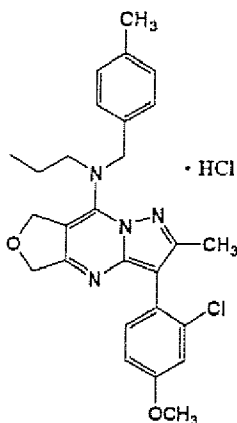
CCF: Rf 0,27 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,33 - 7,26 (m, 3H), 7,06 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,01 - 6,95 (m, 2H), 6,88 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,88 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,38 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 2,96 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,39 (s, 3H),

2,10 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,10 - 0,98 (m, 1H), 0,49 - 0,42 (m, 2H), 0,08 - 0,02 (m, 2H).

Ejemplo 2(157)

Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



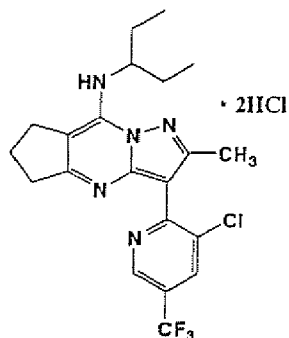
5

CCF: Rf 0,43 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,33 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,19 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,13 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,08 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,95 (dd, J = 2,7, 8,1 Hz, 1H), 5,28 (m, 2H), 5,13 (m, 2H), 5,08 (m, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,64 (m, 2H), 2,37 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 1,80 (m, 2H), 0,95 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

10 Ejemplo 2(158)

Diclorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(3-cloro-5-trifluorometilpiridin-2-il)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

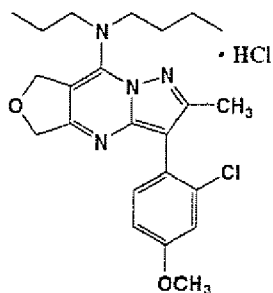


CCF: Rf 0,19 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,91 (s, 1H), 8,12 (s, 1H), 3,99 (m, 1H), 3,50 (m, 2H), 3,15 (m, 2H), 2,47 (s, 3H), 2,32 (m, 2H), 1,94 - 1,64 (m, 4H), 1,06 (ta, J = 6,9 Hz, 6H).

Ejemplo 2(159)

Clorhidrato de 8-(N-butyl-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

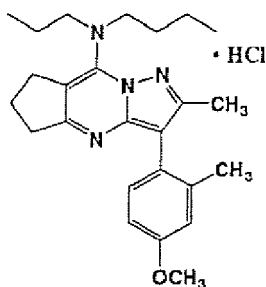


CCF: Rf 0,21 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,34 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 8,1, 2,4 Hz, 1H), 5,47 y 5,35 (ABd, J = 16,5 Hz, 2H), 5,21 (sa, 2H), 4,00 - 3,75 (m) y 3,85 (s) 7H total, 2,34 (s, 3H), 1,90 1,75 (m, 4H), 1,42 (sext., J = 7,2 Hz, 2H), 1,05 - 0,98 (m, 6H).

Ejemplo 2(160)

Clorhidrato de 8-(N-butil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

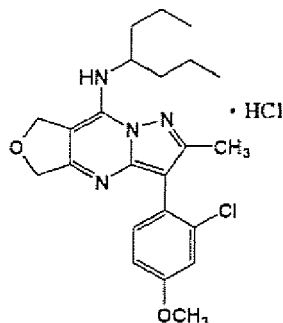


10 CCF: Rf 0,33 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,12 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 3,95 - 3,80 (m) y 3,83 (s) 7H total, 3,48 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,02 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,30 - 2,18 (m) y 2,27 (s) 5H total, 2,19 (s, 3H), 1,80 - 1,65 (m, 4H), 1,38 (sext., J = 7,2 Hz, 2H), 0,96 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(161)

15 Clorhidrato de 8-(4-heptilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

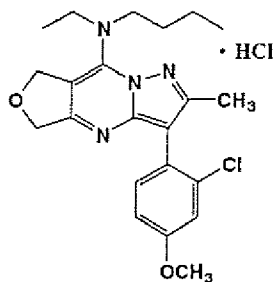


CCF: Rf 0,54 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,52 (d, J = 10,2 Hz, 1H), 7,34 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 2,4, 8,7 Hz, 1H), 5,49 (da, J = 16,8 Hz, 1H), 5,39 (d, J = 16,8 Hz, 1H), 5,28 (m, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,53 (m, 1H), 2,39 (s, 3H), 1,75 (m, 4H), 1,47 (m, 4H), 1,00 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(162)

Clorhidrato de 8-(N-butil-N-etilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

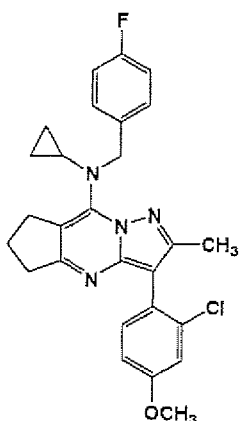


CCF: Rf 0,48 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,33 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 2,4, 8,7 Hz, 1H), 5,46 (m, 1H), 5,35 (m, 1H), 5,23 (t, J = 1,5 Hz, 2H), 3,80 - 4,00 (m, 4H), 3,85 (s, 3H), 2,34 (s, 3H), 1,80 (m, 2H), 1,46 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 1,44 (m, 2H), 1,01 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(163)

8-(N-Ciclopropil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



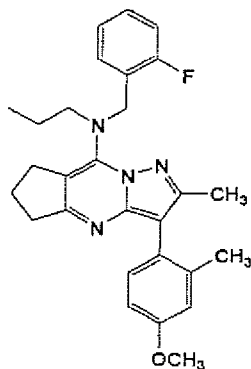
10

CCF: Rf 0,80 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,17 - 7,09 (m, 2H), 7,07 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,96 - 6,93 (m, 2H), 6,90 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,01 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,97 - 2,86 (m, 4H), 2,75 (m, 1H), 2,39 (s, 3H), 2,03 (m, 2H), 0,80 - 0,68 (m, 4H).

15 Ejemplo 2(164)

8-(N-Propil-N-(2-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

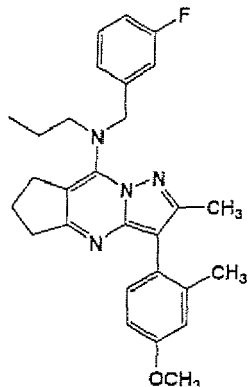


CCF: Rf 0,85 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,24 - 7,12 (m, 2H), 7,19 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,06 - 6,97 (m, 2H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 5,00 - 4,92 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,42 - 3,36 (m, 2H), 2,86 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,75 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,37 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,02 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,68 - 1,46 (m, 2H), 0,90 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

5 Ejemplo 2(165)

8-(N-Propil-N-(3-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

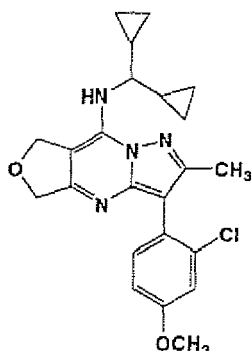


CCF: Rf 0,86 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,30 - 7,22 (m, 1H), 7,18 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,08 - 7,01 (m, 2H), 6,98 - 6,90 (m, 1H), 6,87 (d, J=2,4 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 4,85 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,42 - 3,36 (m, 2H), 2,89 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,86 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,09 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,68 - 1,52 (m, 2H), 0,88 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(166)

- 15 8-Diciclopropilmetilamino-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

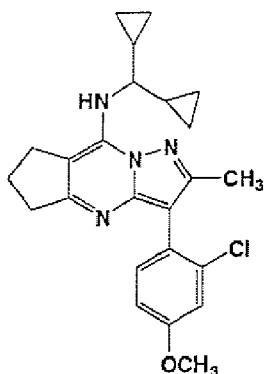


CCF: Rf 0,39 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 2,4, 8,7 Hz, 1H), 6,48 (da, J=9,9 Hz, 1H), 5,22 (sa, 2H), 4,89 (sa, 2H), 3,83 (s, 3H), 2,87 (m, 1H), 2,37 (s, 3H), 1,15 (m, 2H), 0,61 (m, 4H), 0,42 (m, 4H).

Ejemplo 2(167)

8-Diciclopropilmetilamino-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

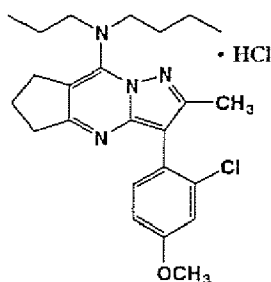


CCF: Rf 0,40 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,04 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,87 (dd, J = 2,4, 8,4 Hz, 1H), 6,37 (da, J = 9,9 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,40 (m, 1H), 3,01 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,88 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,11 (m, 2H), 1,14 (m, 2H), 0,50 - 0,66 (m, 4H), 0,35-0,50 (m, 4H).

Ejemplo 2(168)

Clorhidrato de 8-(N-butil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

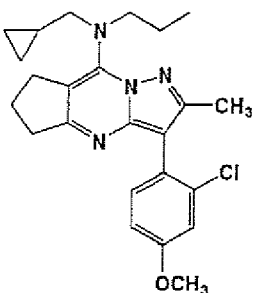


10 CCF: Rf 0,52 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,40 - 7,30 (m, 1H), 7,08 (s, 1H), 7,00 - 6,90 (m, 1H), 4,00 - 3,80 (m) y 3,85 (s) 7H total, 3,65 - 3,30 (m, 2H), 3,10 - 2,95 (m, 2H), 2,40 - 2,20 (m) y 2,33 (s) 5H total, 1,80 - 1,65 (m, 4H), 1,43 - 1,30 (m, 2H), 0,97 (t, J = 6,6 Hz, 6H).

Ejemplo 2(169)

15 8-(N-Ciclopropilmetil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



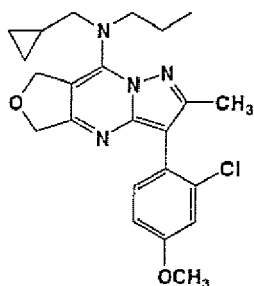
CCF: Rf 0,54 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,31 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,05 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,88 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 3,83 (s,

3H), 3,64 - 3,58 (m, 2H), 3,53 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 3,01 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,92 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,14 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,65 - 1,55 (m, 2H), 1,05 - 0,90 (m, 1H), 0,91 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 0,50 - 0,40 (m, 2H), 0,15 - 0,05 (m, 2H).

Ejemplo 2(170)

5 8-(N-Ciclopropilmetil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

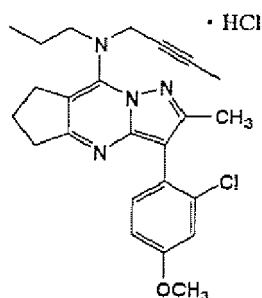


CCF: Rf 0,42 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,30 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,23 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,65 - 3,50 (m, 4H), 2,38 (s, 3H), 1,63 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,10 - 0,98 (m, 1H), 0,94 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,56 - 0,46 (m, 2H), 0,15 (dd, J = 10,8, 5,1 Hz, 2H).

Ejemplo 2(171)

Clorhidrato de 8-(N-(2-butinil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

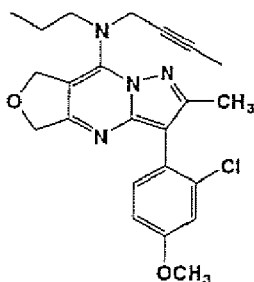


15 CCF: Rf 0,44 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,34 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,96 (da, J = 8,7 Hz, 1H), 4,56 (d, J = 2,1 Hz, 2H), 4,05 - 3,80 (m) y 3,85 (s) 5H total, 3,65 - 3,30 (m, 2H), 3,25 - 3,10 (m, 2H), 2,40 - 2,20 (m) y 2,33 (s) 5H total, 1,95 - 1,80 (m) y 1,89 (s) 5H total, 1,01 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(172)

20 8-(N-(2-Butinil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1-5-a]pirimidina

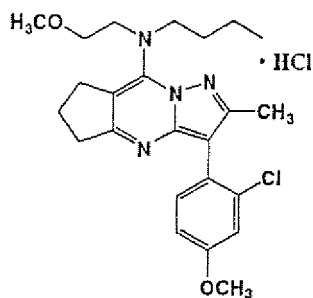


CCF: Rf 0,36 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,28 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,90 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 5,32 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 4,45 (q, J = 2,1 Hz, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,55 - 3,45 (m, 2H), 2,38 (s, 3H), 1,82 (t, J = 2,1 Hz, 3H), 1,72 (sext., J = 7,2 Hz, 2H), 0,98 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(173)

- 5 Clorhidrato de 8-(N-butil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

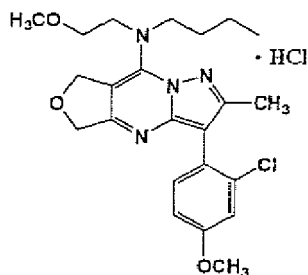


CCF: Rf 0,34 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,35 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,97 (da, J = 7,8 Hz, 1H), 4,30 - 4,18 (m, 2H), 3,90 - 3,78 (m) y 3,85 (s) 5H total, 3,70 - 3,30 (m) y 3,64 (m) 4H total, 3,30 (s, 3H), 3,08 - 2,98 (m, 2H), 2,40 - 2,18 (m) y 2,33 (s) 5H total, 1,80 - 1,65 (m, 2H), 1,43 - 1,35 (m, 2H), 0,96 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(174)

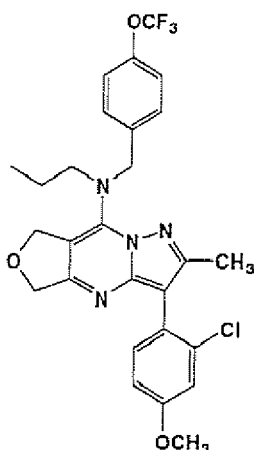
- Clorhidrato de 8-(N-butil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



- 15 CCF: Rf 0,39 (hexano:acetato de etilo = 2:1);
- RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,40 - 7,30 (m, 1H), 7,08 (sa, 1H), 7,05 - 6,95 (m, 1H), 5,60 - 5,35 (m, 2H), 5,30 - 5,15 (m, 2H), 4,40 - 4,20 (m, 2H), 3,90 - 3,70 (m) y 3,85 (s) 7H total, 3,35 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 1,85 - 1,70 (m, 2H), 1,50 - 1,38 (m, 2H), 0,99 (t, J = 6,9 Hz, 3H).

- 20 Ejemplo 2(175)

8-(N-Propil-N-(4-trifluorometiloxifenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



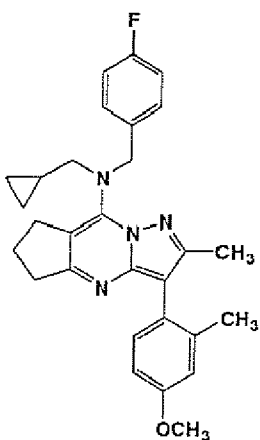
CCF: Rf 0,42 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,39 - 7,33 (m, 2H), 7,31 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,21 - 7,15 (m, 2H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,91 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,12 (s, 2H), 4,95 (s, 2H), 4,90 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,36 - 3,28 (m, 2H), 2,40 (s, 3H), 1,70 - 1,54 (m, 2H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

5

Ejemplo 2(176)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

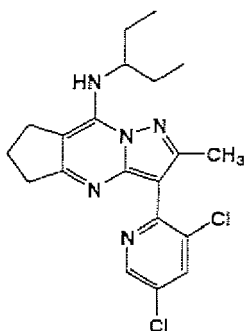


10 CCF: Rf 0,28 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,33 - 7,26 (m, 2H), 7,18 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,03 - 6,94 (m, 2H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,88 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,38 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 2,95 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,89 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,09 (quint., J = 6,9 Hz, 2H), 1,01 (m, 1H), 0,58 - 0,42 (m, 2H), 0,20 - 0,01 (m, 2H).

15 Ejemplo 2(177)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(3,5-dicloropiridin-2-il)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta [d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



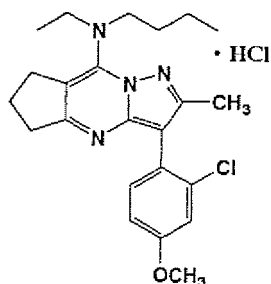
CCF: Rf 0,38 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,58 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 7,81 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,24 (da, J = 11,1 Hz, 1H), 3,80 (m, 1H), 3,08 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,93 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,41 (s, 3H), 2,15 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,80 - 1,52 (m, 4H), 1,00 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

5

Ejemplo 2(178)

Clorhidrato de 8-(N-butil-N-etilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

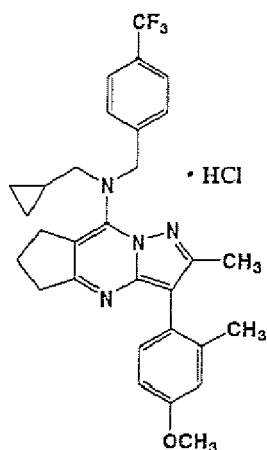


10 CCF: Rf 0,61 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,35 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 3,94 (m, 4H), 3,85 (s, 3H), 3,30 - 3,62 (m, 2H), 3,05 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,25 (m, 2H), 1,74 (m, 2H), 1,32 - 1,48 (m, 5H), 0,98 (t, J = 7,8 Hz, 3H).

Ejemplo 2(179)

15 Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-trifluorometilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

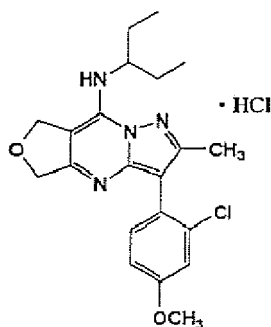


CCF: Rf 0,54 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,65 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,13 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 2,4, 8,7 Hz, 1H), 5,37 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,66 (m, 2H), 3,52 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,11 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,27 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,14 (m, 1H), 0,65 (m, 2H), 0,17 (m, 2H).

5 Ejemplo 2(180)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

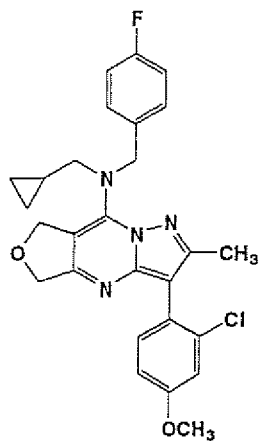


CCF: Rf 0,40 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,52 (da, J = 10,2 Hz, 1H), 7,35 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 2,7, 8,7 Hz, 1H), 5,50 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 5,39 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 5,29 (s, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,39 (m, 1H), 2,40 (s, 3H), 1,68 - 1,98 (m, 4H), 1,06 (m, 6H).

Ejemplo 2(181)

8-(N-Ciclopropilmetilamino-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



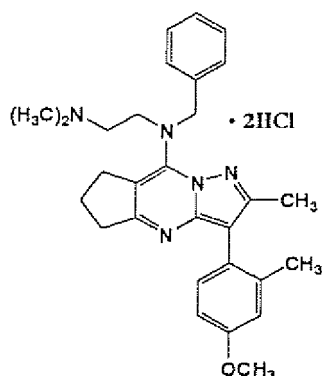
15

CCF: Rf 0,28 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,34 - 7,28 (m, 2H), 7,30 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,05 - 6,98 (m, 2H), 6,901 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,21 (s, 2H), 4,93 (s, 2H), 4,90 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,38 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 2,40 (s, 3H), 1,08 - 0,94 (m, 1H), 0,56 - 0,48 (m, 2H), 0,14-0,06 (m, 2H).

20 Ejemplo 2(182)

Clorhidrato de 8-(N-bencil-N-(2-dimetilaminoetil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

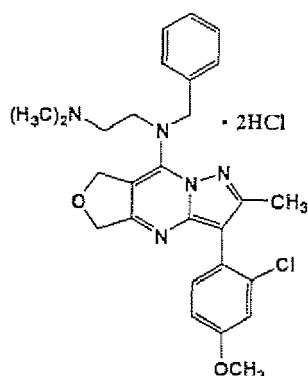


CCF: Rf 0,60 (acetato de etilo:ácido acético:agua = 3:1:1);

5 RMN (300 MHz, CD₃OD): δ 7,45 - 7,32 (m, 5H), 7,18 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,98 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,90 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,20 (s, 2H), 4,40 (m, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,75 (m, 2H), 3,16 (m, 2H), 3,06 (m, 2H), 2,96 (s, 6H), 2,35 (s, 3H), 2,38- 2,18 (m, 2H), 2,11 (s, 3H).

Ejemplo 2(183)

Clorhidrato de 8-(N-bencil-N-(2-dimetilaminoetil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

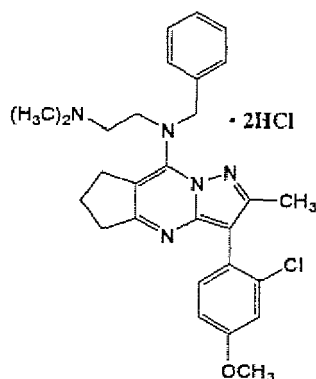


10 CCF: Rf 0,80 (acetato de etilo:ácido acético:agua = 3:1:1);

RMN (300 MHz, CD₃OD): δ 7,60 - 7,30 (m, 6H), 7,19 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,08 - 7,02 (m, 1H), 5,13 (s, 2H), 4,96 (s, 2H), 4,94 (s, 2H), 4,40 - 4,24 (m, 2H), 3,87 (s, 3H), 3,76 (m, 1H), 3,56 (m, 1H), 2,99 (s, 3H), 2,98 (s, 3H), 2,44 (s, 3H).

Ejemplo 2(184)

15 Clorhidrato de 8-(N-bencil-N-(2-dimetilaminoetil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

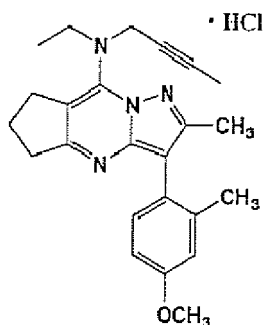


CCF: Rf 0,27 (cloroformo:metanol = 9:1);

RMN (300 MHz, CD₃OD): δ 7,46 - 7,26 (m, 6H), 7,20 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 7,08 - 7,02 (m, 1H), 5,11 (sa, 2H), 4,34 - 4,20 (m, 2H), 3,87 (s, 3H), 3,76 - 3,64 (m, 2H), 3,34 - 2,86 (m) y 2,96 (s) 10H total, 2,41 (s, 3H), 2,26 - 2,10 (m, 2H).

Ejemplo 2(185)

- 5 Clorhidrato de 8-(N-(2-butinil)-N-etilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

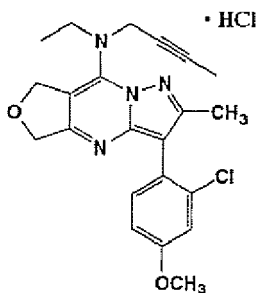


CCF: Rf 0,36 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,10 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 4,55 (q, J = 2,1 Hz, 2H), 4,08 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,48 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,22 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,24 (m, 2H), 2,17 (s, 3H), 1,90 (t, J = 2,1 Hz, 3H), 1,47 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(186)

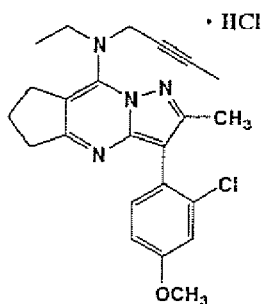
- Clorhidrato de 8-(N-(2-butinil)-N-etilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



- 15 CCF: Rf 0,26 (hexano:acetato de etilo = 2:1);
- RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,95 (dd, J = 2,4, 8,4 Hz, 1H), 5,41 (s, 2H), 5,36 (m, 2H), 4,46 (m, 2H), 4,08 (m, 2H), 3,85 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 1,89 (t, J = 2,7 Hz, 3H), 1,51 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

20 Ejemplo 2(187)

- Clorhidrato de 8-(N-(2-butinil)-N-etilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

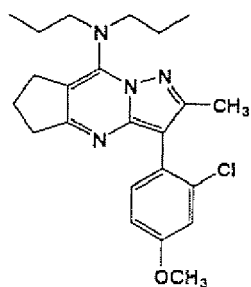


CCF: Rf 0,32 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 Hz, CDCl₃): δ 7,34 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 4,54 (m, 2H), 4,09 (m, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,35 - 3,64 (m, 2H), 3,22 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,26 (m, 2H), 1,90 (t, J = 2,4 Hz, 3H), 1,47 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(188)

8-(N,N-Dipropilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

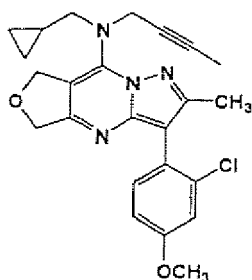


CCF: Rf 0,40 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,30 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,05 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,88 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,56 (m, 4H), 2,95 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,13 (m, 2H), 1,58 (m, 4H), 0,89 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(189)

15 8-(N-(2-Butinil)-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

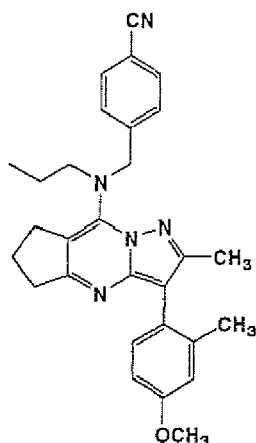


CCF: Rf 0,50 (tolueno:acetona = 5:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,28 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,90 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,35 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 4,56 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,50 (m, 2H), 2,39 (s, 3H), 1,82 (t, J = 2,4 Hz, 3H), 1,15 (m, 1H), 0,64 - 0,56 (m, 2H), 0,38 - 0,28 (m, 2H).

Ejemplo 2(190)

8-(N-Propil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

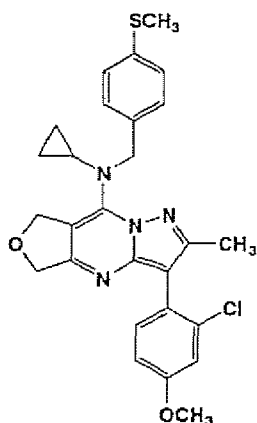


CCF: Rf 0,22 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,60 (da, J = 8,1 Hz, 2H), 7,47 (da, J = 8,1 Hz, 2H), 7,17 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 4,90 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,39 (m, 2H), 2,94 - 2,82 (m, 4H), 2,34 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,11 (m, 2H), 1,59 (m, 2H), 0,88 (t, J=7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(191)

8-(N-Ciclopropil-N-(4-metiltiofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

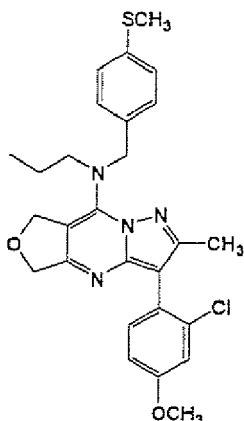


10 CCF: Rf 0,20 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,19-7,13 (m, 2H), 7,08 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,06 - 7,01 (m, 2H), 6,91 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,20 (s, 2H), 5,15 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,56 (m, 1H), 2,46 (s, 3H), 2,41 (s, 3H), 0,95 - 0,88 (m, 4H).

Ejemplo 2(192)

15 8-(N-Propil-N-(4-metiltiofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

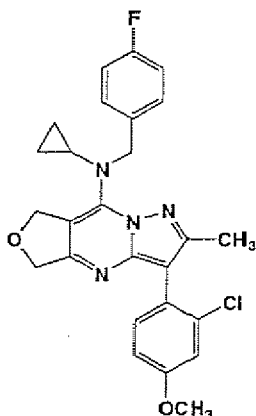


CCF: Rf 0,25 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,31 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,20 (s, 4H), 7,08 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,90 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 5,10 (s, 2H), 4,90 (s, 2H), 4,89 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,34 (m, 2H), 2,48 (s, 3H), 2,40 (s, 3H), 1,70 - 1,50 (m, 2H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(193)

8-(N-Ciclopropil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

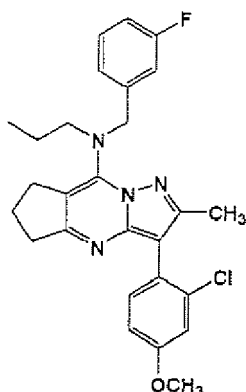


10 CCF: Rf 0,19 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,14 - 7,04 (m, 3H), 7,02 - 6,94 (m, 2H), 6,92 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,19 (s, 2H), 5,16 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,55 (m, 1H), 2,41 (s, 3H), 0,90 - 0,76 (m, 4H).

Ejemplo 2(194)

15 8-(N-Propil-N-(3-fluorofenil) metilamino)- 2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

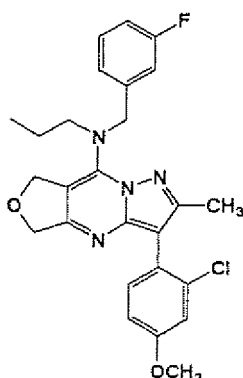


CCF: Rf 0,48 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,33 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,26 - 7,15 (m, 2H), 7,07 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,05 - 6,98 (m, 2H), 6,89 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 4,94 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,39 (m, 2H), 2,88 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,77 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,40 (s, 3H), 2,04 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,63 (m, 2H), 0,90 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(195)

8-(N-Propil-N-(3-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

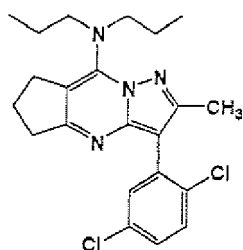


10 CCF: Rf 0,46 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,28 - 7,16 (m, 2H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,07 - 6,99 (m, 2H), 6,91 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,07 (s, 2H), 5,04 (s, 2H), 4,88 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,13 (m, 2H), 2,41 (s, 3H), 1,68 (sext., J = 7,5 Hz, 2H), 0,93 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(196)

15 8-Dipropilamino-2-metil-3-(2,5-diclorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



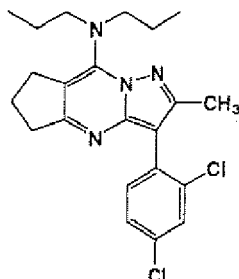
CCF: Rf 0,64 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,41 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,40 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,23 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 3,60 - 3,52

(m, 4H), 2,96 (t, J = 7,8 Hz) y 2,93 (t, J = 7,8 Hz) 4H total, 2,37 (s, 3H), 2,15 (quint., J = 7,8 Hz, 2H), 1,65 - 1,50 (m, 4H), 0,89 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(197)

8-Dipropilamino-2-metil-3-(2,4-diclorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



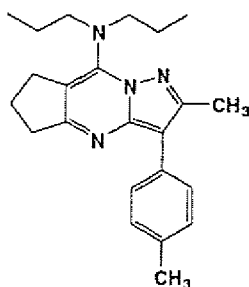
5

CCF: Rf 0,57 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,51 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,35 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,29 (dd, J = 8,1, 2,4 Hz, 1H), 3,65 - 3,50 (m, 4H), 2,96 (t, J = 7,2 Hz) y 2,92 (t, J = 7,2 Hz) 4H total, 2,36 (s, 3H), 2,14 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,63 - 1,45 (m, 4H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

10 Ejemplo 2(198)

8-Dipropilamino-2-metil-3-(4-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

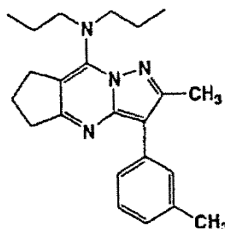


CCF: Rf 0,58 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,58 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,24 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 3,60 - 3,52 (m, 4H), 3,00 - 2,90 (m, 4H), 2,56 (s, 3H), 2,37 (s, 3H), 2,14 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,64 - 1,48 (m, 4H), 0,87 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(199)

8-Dipropilamino-2-metil-3-(3-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

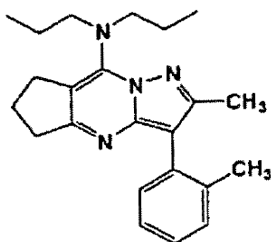


CCF: Rf 0,61 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,50 (s) y 7,47 (d, J = 7,5 Hz) 2H total, 7,32 (t, J = 7,5 Hz, 1H), 7,06 (t, J = 7,5 Hz, 1H), 3,60 - 3,52 (m, 4H), 2,96 (t, J = 7,8 Hz, 4H), 2,57 (s, 3H), 2,41 (s, 3H), 2,15 (quint., J = 7,8 Hz, 2H), 1,64 - 1,45 (m, 4H), 0,88 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(200)

8-Dipropilamino-2-metil-3-(2-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

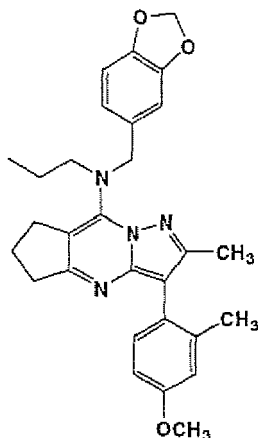


CCF: Rf 0,56 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,35 - 7,20 (m, 4H), 3,62 - 3,54 (m, 4H), 2,96 (t, J = 7,2 Hz) y 2,90 (t, J = 7,2 Hz) 4H total, 2,34 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,13 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,63 - 1,50 (m, 4H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(201)

8-(N-propil-N-(benz[d]1,3-dioxolan-5-il)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

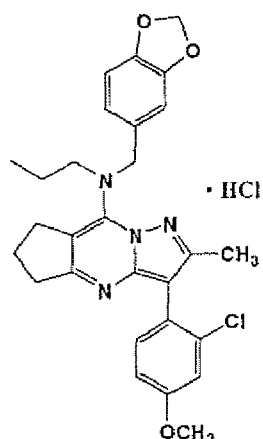


10 CCF: Rf 0,31 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,18 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,87 (d, J=2,7 Hz, 1H), 6,77-6,83 (m, 2H), 6,67-6,75 (m, 2H), 5,94 (s, 2H), 4,74 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,37 (m, 2H), 2,89 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,85 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 2,08 (m, 2H), 1,58 (m, 2H), 0,88 (t, J=7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(202)

15 Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(benz[d]1,3-dioxolan-5-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

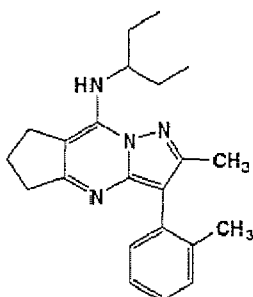


CCF: Rf 0,38 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,36 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 6,70 - 6,82 (m, 3H), 6,00 (s, 2H), 5,07 (s, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,71 (m, 2H), 3,36 - 3,64 (m, 2H), 3,03 (t, J = 7,4 Hz, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,24 (m, 2H), 1,74 (m, 2H), 0,93 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(203)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

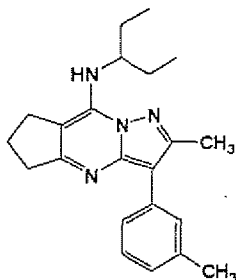


CCF: Rf 0,39 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,30 - 7,18 (m, 4H), 6,23 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,90 - 3,75 (m, 1H), 3,09 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,90 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,14 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,80 - 1,58 (m, 4H), 1,08 - 0,96 (m, 6H).

Ejemplo 2(204)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(3-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



15

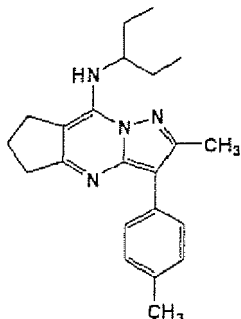
CCF: Rf 0,45 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,50 (s, 1H), 7,46 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 7,31 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,05 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 6,21 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 3,86 - 3,74 (m, 1H), 3,08 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,95 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,55 (s, 3H), 2,41 (s,

3H), 2,15 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,82 - 1,55 (m, 4H), 1,01 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(205)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(4-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

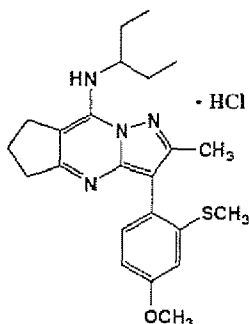


5 CCF: Rf 0,47 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,57 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,24 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 6,20 (10,5 Hz, 1H), 3,83 - 3,75 (m, 1H), 3,08 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,94 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,55 (s, 3H), 2,37 (s, 3H), 2,15 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,80 - 1,52 (m, 4H), 1,00 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(206)

10 Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

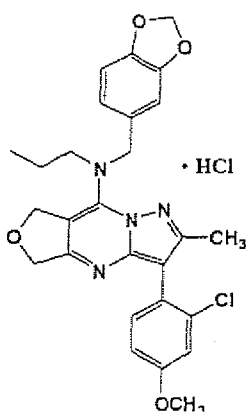


CCF: Rf 0,10 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,26 - 7,16 (m, 1H), 6,83 (m, 1H), 6,84 - 6,76 (m, 1H), 3,97 (m, 1H), 3,86 (s, 3H), 3,48 (m, 2H), 3,12 (m, 2H), 2,44 (s, 3H), 2,33 (s, 3H), 2,28 (m, 2H), 1,95 - 1,44 (m, 4H), 1,11 - 0,99 (m, 6H).

Ejemplo 2(207)

Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(benz[d]1,3-dioxolan-5-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidrofuro[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

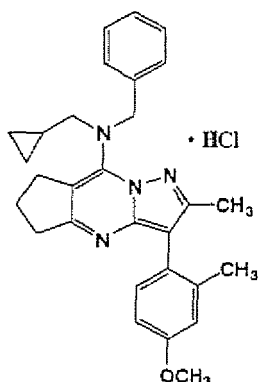


CCF: Rf 0,40 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,34 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,95 (dd, J = 2,7, 8,7 Hz, 1H), 6,78 - 6,83 (m, 2H), 6,72 (m, 1H), 5,99 (s, 2H), 5,28 (m, 2H), 5,16 (s, 2H), 5,04 (m, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,60 (m, 2H), 2,38 (s, 3H), 1,77 (m, 2H), 0,95 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(208)

Clorhidrato de 8-(N-bencil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

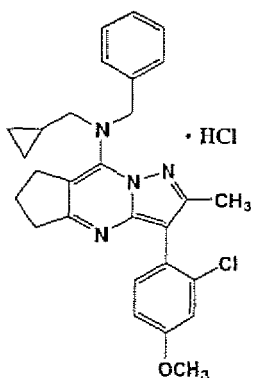


10 CCF: Rf 0,58 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,25 - 7,43 (m, 5H), 7,13 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 2,4, 7,8 Hz, 1H), 5,28 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,69 (m, 2H), 3,48 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 3,07 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,24 (m, 2H), 2,19 (s, 3H), 1,16 (m, 1H), 0,63 (m, 2H), 0,18 (m, 2H).

Ejemplo 2(209)

15 Clorhidrato de 8-(N-bencil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

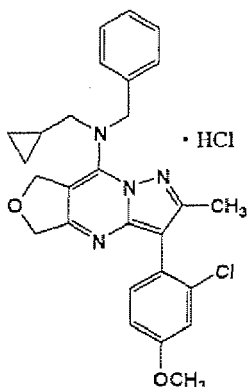


CCF: Rf 0,56 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,25 - 7,43 (m, 6H), 7,09 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 5,27 (m, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,68 (m, 2H), 3,48 (m, 2H), 3,07 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,23 (m, 2H), 1,16 (m, 1H), 0,64 (m, 2H), 0,18 (m, 2H).

Ejemplo 2(210)

Clorhidrato de 8-(N-bencil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

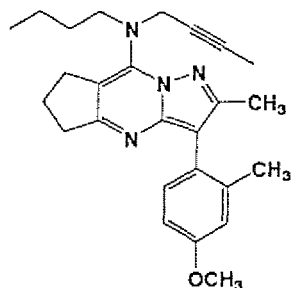


10 CCF: Rf 0,47 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,26 - 7,45 (m, 6H), 7,09 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 2,4, 8,1 Hz, 1H), 5,36 (m, 2H), 5,28 (m, 2H), 5,23 (s, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,69 (m, 2H), 2,37 (s, 3H), 1,21 (m, 1H), 0,66 (m, 2H), 0,22 (m, 2H).

Ejemplo 2(211)

8-(N-Butil-N-(2-butinil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



15

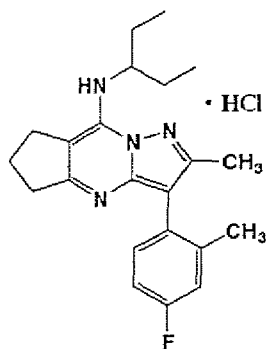
CCF: Rf 0,38 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,40 (sa, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,59 (m, 2H), 3,11 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,13 (m,

2H), 1,81 (t, J = 2,1 Hz, 3H), 1,63 (m, 2H), 1,38 (m, 2H), 0,94 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(212)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-fluorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

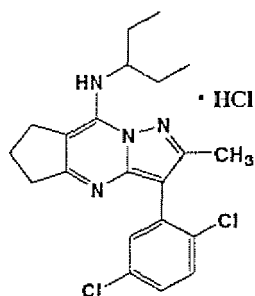


5 CCF: Rf 0,44 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, DMSO-d₆): δ 7,34 - 7,24 (m, 2H), 7,20 - 7,10 (m, 1H), 4,03 - 3,85 (m, 1H), 3,14 (ta, J = 8,1 Hz, 2H), 2,95 (ta, J = 8,1 Hz, 2H), 2,25 (s, 3H), 2,25 - 2,10 (m) y 2,12 (s) 5H total, 1,85 - 1,60 (m, 4H), 0,95 - 0,85 (m, 6H).

Ejemplo 2(213)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,5-diclorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



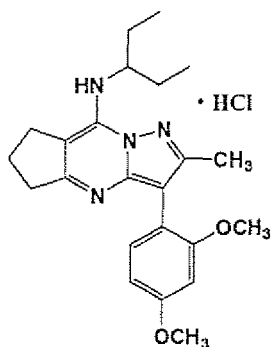
10

CCF: Rf 0,46 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, DMSO-d₆): δ 7,68 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,62 - 7,55 (m) y 7,59 (s) 2H total, 4,03 - 3,85 (m, 1H), 3,14 (ta, J = 7,8 Hz, 2H), 2,96 (ta, J = 7,8 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,25 - 2,10 (m, 2H), 1,85 - 1,60 (m, 4H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

15 Ejemplo 2(214)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,4-dimetoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

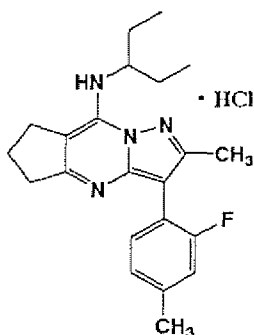


CCF: Rf 0,43 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, DMSO-d₆): δ 7,24 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,71 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,66 (dd, J = 8,1, 2,4 Hz, 1H), 4,05 - 3,85 (m, 1H), 3,85 (s, 3H), 3,74 (s, H), 3,15 (ta, J = 8,1 Hz, 2H), 2,99 (ta, J = 8,1 Hz, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,25 - 2,10 (m, 2H), 1,85 - 1,63 (m, 4H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

5 Ejemplo 2(215)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-fluoro-4-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

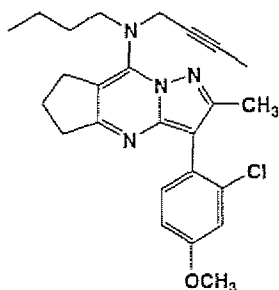


CCF: Rf 0,43 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, DMSO-d₆): δ 9,20 - 9,00 (m, 1H), 7,39 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,22 (d, J = 11,1 Hz, 1H), 7,17 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 4,05 - 3,60 (m, 1H, cubierto con H₂O en DMSO-d₆), 3,14 (ta, J = 7,8 Hz, 2H), 2,99 (ta, J = 7,8 Hz, 2H), 2,40 (s, 3H), 2,37 (s, 3H), 2,18 (quint., J = 7,8 Hz, 2H), 1,83 - 1,60 (m, 4H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(216)

8-(N-Butil-N-(2-butinil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

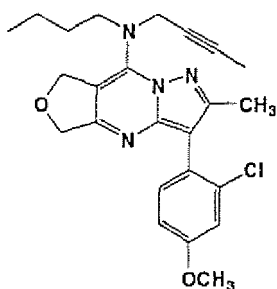


15 CCF: Rf 0,80 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,88 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 4,39 (q, J = 2,1 Hz, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,59 (m, 2H), 3,11 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,93 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,14 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,81 (t, J = 2,1 Hz, 3H), 1,68 - 1,54 (m, 2H), 1,39 (sext., J = 7,5 Hz, 2H), 0,94 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(217)

20 8-(N-Butil-N-(2-butinil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

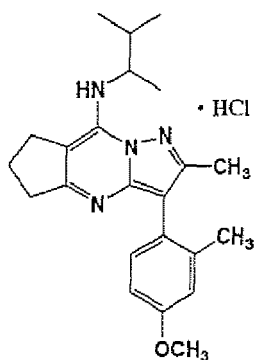


CCF: Rf 0,78 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,28 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 5,33 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 4,44 (q, J = 2,4 Hz, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,54 (m, 2H), 2,38 (s, 3H), 1,82 (t, J = 2,4 Hz, 3H), 1,74 - 1,61 (m, 2H), 1,41 (sext., J = 7,5 Hz, 2H), 0,96 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(218)

Clorhidrato de 8-(3-metil-2-butilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1, 5-a]pirimidina

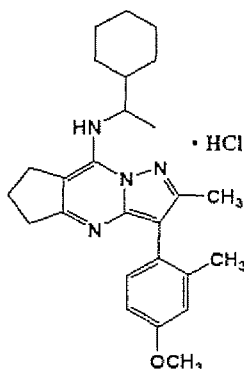


10 CCF: Rf 0,36 (hexano acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,45 (da, J = 10,2 Hz, 1H), 7,11 (dd J = 4,2, 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 2,4, 8,4 Hz, 1H), 4,07 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,49 (m, 2H), 3,15 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,29 (m, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,20 y 2,19 (s, 3H total), 1,99 (m, 1H), 1,42 y 1,41 (d, J = 6,6 Hz, 3H total), 1,05 - 1,14 (m, 6H).

Ejemplo 2(219)

15 Clorhidrato de 8-(1-ciclohexiletilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



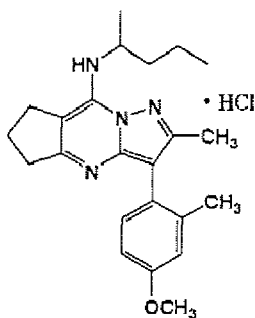
CCF: Rf 0,36 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,42 (da, J = 10,5 Hz, 1H), 7,11 y 7,10 (d, J = 8,1 Hz, 1H total), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H),

6,81 (dd, J = 2,7, 8,1 Hz, 1H), 4,03 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,48 (m, 2H), 3,12 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,28 (m, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,20 y 2,18 (s, 3H total), 1,52 - 1,95 (m, 6H), 1,41 y 1,40 (d, J = 6,6 Hz, 3H total), 1,01 - 1,37 (m, 5H).

Ejemplo 2(220)

Clorhidrato de 8-(2-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



5

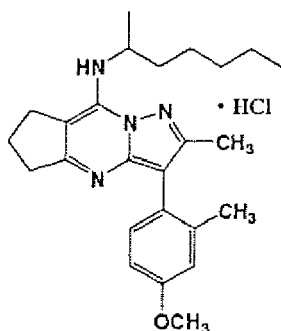
CCF: Rf 0,36 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,34 (da, J = 9,6 Hz, 1H), 7,11 y 7,10 (d, J = 8,7 Hz, 1H total), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 2,7, 8,7 Hz, 1H), 4,25 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,49 (m, 2H), 3,16 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,29 (m, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,20 y 2,19 (s, 3H total), 1,70 - 1,80 (m, 2H), 1,44 - 1,58 (m, 2H), 1,47 y 1,46 (d, J = 6,6 Hz, 3H total), 1,01 (m, 3H).

10

Ejemplo 2(221)

Clorhidrato de 8-(2-heptilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

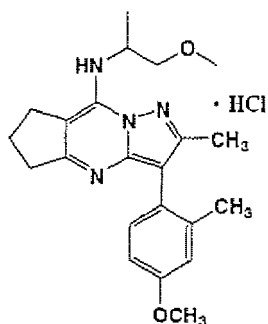


CCF: Rf 0,43 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (da, J = 10,2 Hz, 1H), 7,12 y 7,11 (d, J = 8,4 Hz, 1H total), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 4,22 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,50 (m, 2H), 3,15 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,29 (m, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,20 y 2,19 (s, 3H total), 1,71 - 1,81 (m, 2H), 1,30 - 1,55 (m, 9H), 0,92 (m, 3H).

Ejemplo 2(222)

20 Clorhidrato de 8-(1-metoxi-2-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

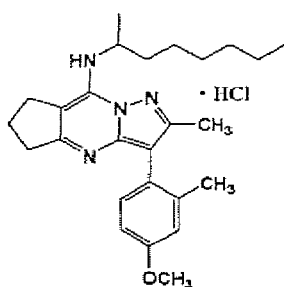


CCF: Rf 0,30 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,66 (da, J = 8,4 Hz, 1H), 7,11 y 7,10 (d, J = 8,7 Hz, 1H total), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 2,7, 8,7 Hz, 1H), 4,46 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,64 (dd, J = 3,9, 9,9 Hz, 1H), 3,42 - 3,58 (m, 3H), 3,46 y 3,45 (s, 3H total), 3,23 (m, 1H), 3,11 (m, 1H), 2,29 (m, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,19 y 2,18 (s, total, 3H), 1,49 (d, J = 6,6 Hz, 3H).

Ejemplo 2(223)

Clorhidrato de 8-(2-octilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

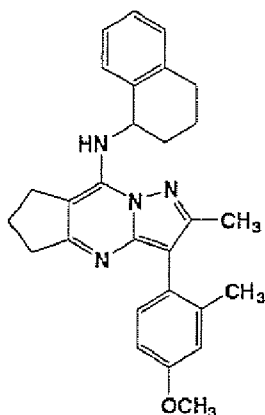


10 CCF: Rf 0,60 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,33 (da, J = 10,2 Hz, 1H), 7,12 y 7,11 (d, J = 8,1 Hz, 1H total), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 2,7, 8,1 Hz, 1H), 4,23 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,50 (ta, J = 7,2 Hz, 2H), 3,15 (t, J = 6,6 Hz, 2H), 2,29 (m, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,20 y 2,19 (s, 3H total), 1,75 (m, 2H), 1,46 y 1,45 (d, J = 6,3 Hz, 3H total), 1,26 - 1,45 (m, 8H), 0,90 (m, 3H).

15 Ejemplo 2(224)

8-(1,2,3,4-Tetrahidronaftalen-1-il)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

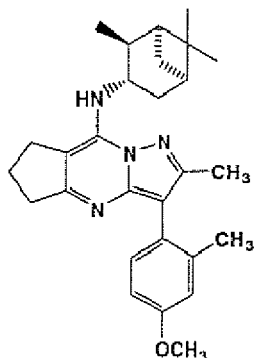


CCF: Rf 0,16 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,44 (m, 1H), 7,27 - 7,14 (m, 4H), 6,85 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 6,69 (da, J = 9,9 Hz, 1H), 5,22 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,24 - 3,08 (m, 2H), 3,00 - 2,76 (m, 4H), 2,26 (s, 3H), 2,24 - 1,82 (m, 6H), 2,20 (s, 3H).

Ejemplo 2(225)

- 5 8-((1S,2S,3S,5R)-2,6,6-Trimetilbicyclo[3,1,1]-3-heptil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

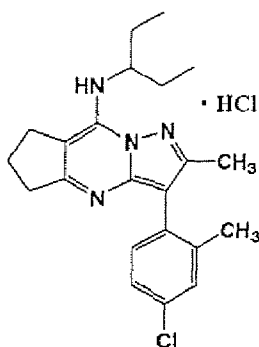


CCF: Rf 0,25 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,78 (dd, J = 8,1, 2,4 Hz, 1H), 6,35 (da, J = 10,8 Hz, 1H), 4,31 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,22 - 3,06 (m, 2H), 2,91 (t, J = 8,1 Hz, 2H), 2,62 - 2,46 (m, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,19 - 1,82 (m, 6H), 1,29 (s, 3H), 1,20 (d, J = 6,0 Hz, 3H), 1,11 - 1,08 (m, 1H), 1,09 (s, 3H).

Ejemplo 2(226)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-clorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

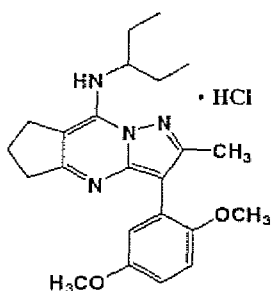


- 15 CCF: Rf 0,41 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,38 - 7,32 (m, 2H), 7,26 - 7,10 (m, 2H), 4,04 - 3,90 (m, 1H), 3,60 - 3,30 (m, 2H), 3,13 (t, J = 6,6 Hz, 2H), 2,39 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 2,28 (quint., J = 6,6 Hz, 2H), 1,92 - 1,40 (m, 4H), 1,06 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(227)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,5-dimetoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

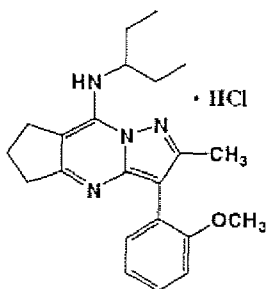


CCF: Rf 0,52 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 - 7,24 (m, 1H), 7,00 - 6,90 (m, 2H), 6,85 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 4,05-3,95 (m, 1H), 3,90 (s, 3H), 3,84 (s, 3H), 3,56 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,12 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,43 (s, 3H), 2,29 (quint., J = 7,8 Hz, 2H), 1,90 - 1,40 (m, 4H), 1,05 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(228)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

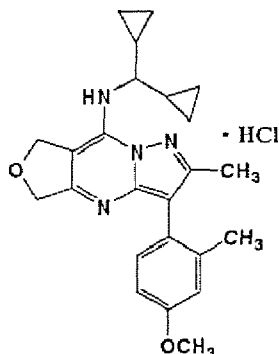


CCF: Rf 0,24 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,41 (t, J = 8,1 Hz, 1H), 7,34 - 7,24 (m, 2H), 7,10 - 7,02 (m, 2H), 4,03 - 3,90 (m, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,56 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,12 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,43 (s, 3H), 2,36 - 2,20 (m, 2H), 1,90 - 1,40 (m, 4H), 1,05 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(229)

15 Clorhidrato de 8-diciclopropilmetilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

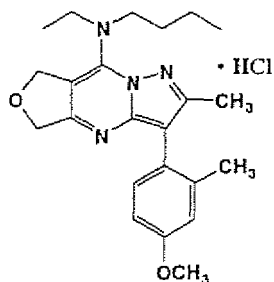


CCF: Rf 0,46 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,87 (m, 1H), 7,11 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 2,7, 8,7 Hz, 1H), 5,37 (s, 2H), 5,19 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 2,90 (m, 1H), 2,36 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,26 (m, 2H), 0,66 - 0,85 (m, 4H), 0,47 (m, 4H).

Ejemplo 2(230)

Clorhidrato de 8-(N-butil-N-etilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

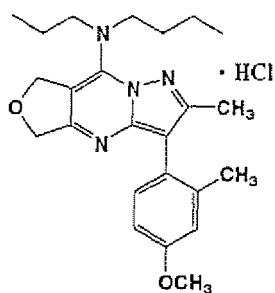


CCF: Rf 0,49 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,10 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 2,7, 8,7 Hz, 1H), 5,40 (s, 2H), 5,23 (s, 2H), 3,85 - 4,00 (m, 4H), 3,83 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,82 (m, 2H), 1,46 (t, J = 6,9 Hz, 3H), 1,44 (m, 2H), 1,02 (t, J = 6,9 Hz, 3H).

Ejemplo 2(231)

- 10 Clorhidrato de 8-(N-butil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

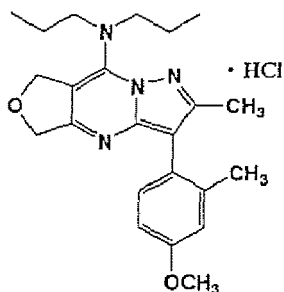


CCF: Rf 0,54 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,10 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 2,4, 8,4 Hz, 1H), 5,40 (s, 2H), 5,21 (s, 2H), 3,87 (m, 4H), 3,83 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,82 (m, 4H), 1,42 (m, 2H), 1,02 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 1,00 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(232)

Clorhidrato de 8-(N,N-dipropilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

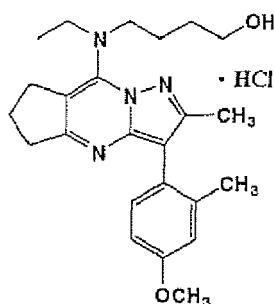


CCF: Rf 0,51 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,10 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 3,0, 8,4 Hz, 1H), 5,39 (sa, 2H), 5,21 (sa, 2H), 3,85 (m, 4H), 3,83 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,83 (m, 4H), 1,02 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(233)

Clorhidrato de 8-(N-etil-N-(4-hidroxibutil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

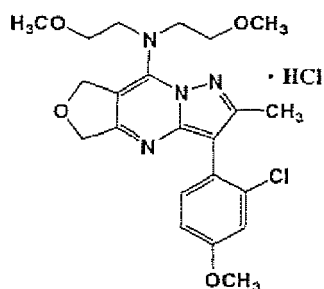


CCF: Rf 0,29 (hexano:acetato de etilo = 1:2);

- 5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,10 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 3,0, 8,4 Hz, 1H), 3,87 - 4,01 (m, 4H), 3,82 (s, 3H), 3,65 (t, J = 6,0 Hz, 2H), 3,38 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,06 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,27 (s, 3H), 2,24 (m, 2H), 2,17 (s, 3H), 1,86 (m, 2H), 1,61 (m, 2H), 1,38 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(234)

- 10 Clorhidrato de 8-bis(2-metoxietil)amino-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

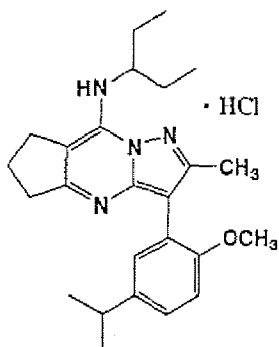


CCF: Rf 0,35 (hexano:acetato de etilo =1:2);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,33 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 2,4, 8,4 Hz, 1H), 5,40 (m, 1H), 5,33 (m, 1H), 5,25 (m, 2H), 4,15 (m, 4H), 3,85 (s, 3H), 3,71 (t, J = 5,1 Hz, 4H), 3,35 (s, 6H), 2,35 (s, 3H).

- 15 Ejemplo 2(235)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metoxi-5-isopropilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



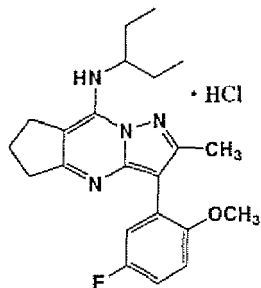
CCF: Rf 0,36 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,23 (dd, J = 8,4, 2,1 Hz, 1H), 7,12 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,98 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 4,00 - 3,85

(m) y 3,91 (s) 4H total, 3,58 - 3,30 (m, 2H), 3,11 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,92 (m, 1H), 2,43 (s, 3H), 2,35 - 2,20 (m, 2H), 1,90 - 1,50 (m, 4H), 1,26 (d, J = 6,9 Hz, 6H), 1,04 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(236)

Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metoxi-5-fluorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



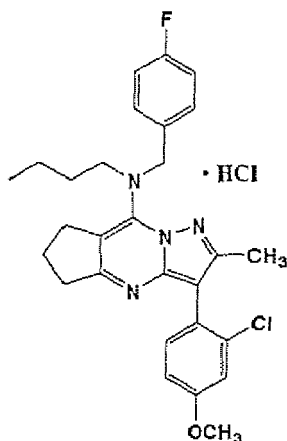
5

CCF: Rf 0,26 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,20 - 6,95 (m, 4H), 4,04 - 3,80 (m) y 3,91 (s) 4H total, 3,52 - 3,40 (m, 2H), 3,12 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,43 (s, 3H), 2,27 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,90 - 1,40 (m, 4H), 1,05 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(237)

10 Clorhidrato de 8-(N-butil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-5-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

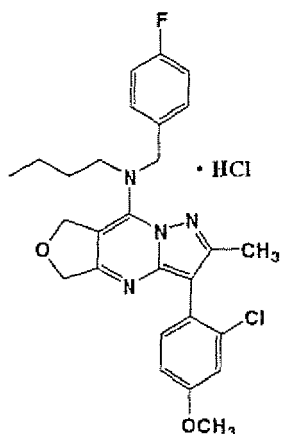


CCF: Rf 0,40 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,44 - 7,20 (m, 3H), 7,14 - 6,90 (m, 4H), 5,03 (sa, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,62 (m, 2H), 3,29 (m, 2H), 2,96 (m, 2H), 2,37 (s, 3H), 2,19 (m, 2H), 1,65 (m, 2H), 1,32 (m, 2H), 0,90 (m, 3H).

Ejemplo 2(238)

Clorhidrato de 8-(N-butil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



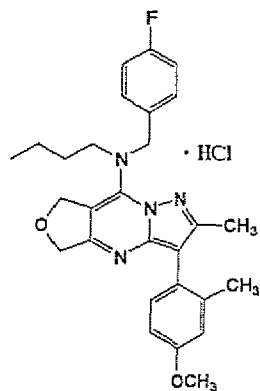
CCF: Rf 0,20 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,40 - 7,26 (m, 3H), 7,12 (da, J = 7,8 Hz, 2H), 7,09 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,99 - 6,92 (m, 1H), 5,40 (m, 2H), 5,30 - 5,08 (m, 4H), 3,85 (s, 3H), 3,70 (m, 2H), 2,37 (s, 3H), 1,76 (m, 2H), 1,36 (m, 2H), 0,94 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

5

Ejemplo 2(239)

Clorhidrato de 8-(N-butyl-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

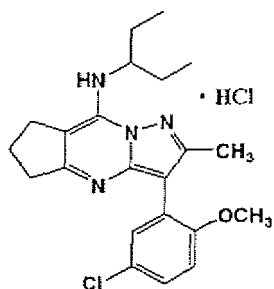


10 CCF: Rf 0,28 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (m, 2H), 7,18 - 7,04 (m, 3H), 6,89 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,85 - 6,78 (m, 1H), 5,23 (m, 2H), 5,15 (m, 2H), 5,11 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,58 (m, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,71 (m, 2H), 1,35 (m, 2H), 0,95 - 0,84 (m, 3H).

Ejemplo 2(240)

15 Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metoxi-5-clorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

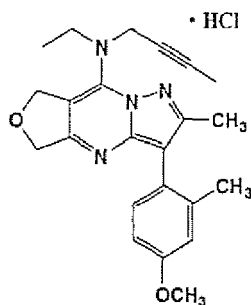


CCF: Rf 0,26 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,33 (dd, J = 9,0, 3,0 Hz, 1H), 7,25 - 7,05 (m) y 7,22 (d, J = 3,0 Hz) 2H total, 6,98 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 4,03 - 3,85 (m) y 3,93 (s) 4H total, 3,55 - 3,40 (m, 2H), 3,13 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,43 (s, 3H), 2,28 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,30 - 1,40 (m, 4H), 1,05 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

5 Ejemplo 2(241)

Clorhidrato de 8-(N-etil-N-(2-butilil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

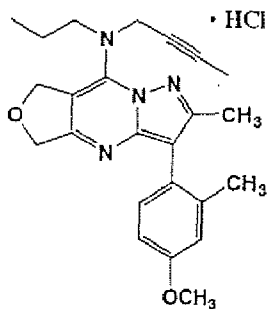


CCF: Rf 0,37 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,10 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 5,41 (s, 4H), 4,48 (m, 2H), 4,14 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,90 (t, J = 2,4 Hz, 3H), 1,54 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(242)

15 Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(2-butilil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

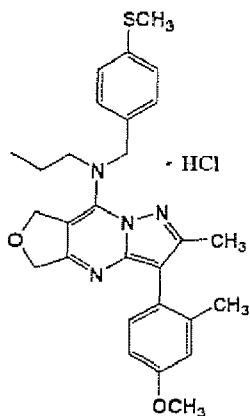


CCF: Rf 0,47 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,10 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 2,7, 8,1 Hz, 1H), 5,41 (m, 2H), 5,39 (m, 2H), 5,42 (m, 2H), 3,98 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,94 (m, 2H), 1,89 (t, J = 2,7 Hz, 3H), 1,05 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(243)

Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(4-metiltofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

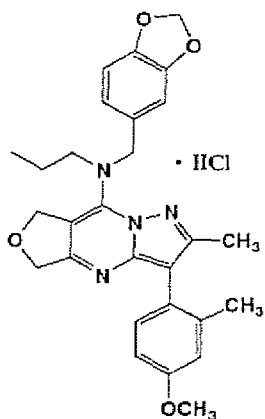


CCF: Rf 0,45 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,27 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,20 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,12 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 5,40 (s, 2H), 5,11 - 5,26 (m, 4H), 3,84 (s, 3H), 3,70 (m, 2H), 2,50 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,84 (m, 2H), 0,97 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(244)

Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(benz[d]1,3-dioxolan-5-il)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

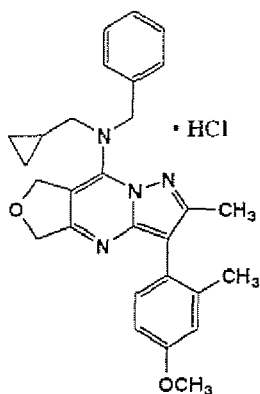


10 CCF: Rf 0,45 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,13 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 2,7, 8,1 Hz, 1H), 6,82 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 6,78 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 6,73 (dd, J = 1,5, 7,5 Hz, 1H), 6,01 (s, 2H), 5,39 (s, 2H), 5,17 (s, 2H), 5,11 (m, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,69 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,81 (m, 2H), 0,96 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(245)

15 Clorhidrato de 8-(N-bencil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

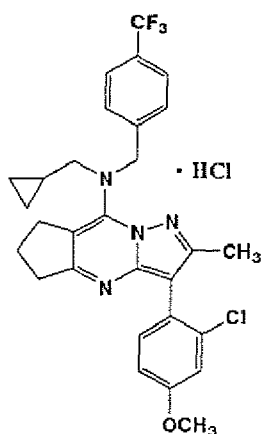


CCF: Rf 0,47 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,34 - 7,46 (m, 3H), 7,26 - 7,33 (m, 2H), 7,13 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,84 (dd, J = 2,7, 8,7 Hz, 1H), 5,42 (s, 2H), 5,33 (m, 2H), 5,24 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,73 (m, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,24 (m, 1H), 0,69 (m, 2H), 0,24 (m, 2H).

Ejemplo 2(246)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-trifluorometilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-5-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

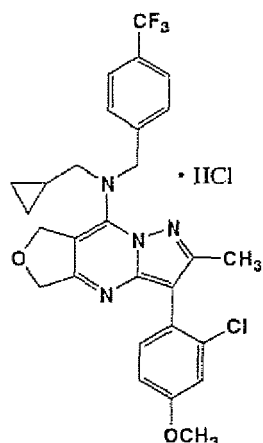


10 CCF: Rf 0,48 (hexano: acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,62 (da, J = 7,8 Hz, 2H), 7,48 (da, J = 7,8 Hz, 2H), 7,34 (da, J = 8,1 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,90 - 6,88 (m, 1H), 5,19 (sa, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,54 (m, 2H), 3,36 - 3,14 (m, 2H), 3,14 - 2,98 (m, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,22 (m, 2H), 1,12 - 0,98 (m, 1H), 0,64 - 0,52 (m, 2H), 0,18 - 0,08 (m, 2H).

Ejemplo 2(247)

15 Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-trifluorometilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidrofuro[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

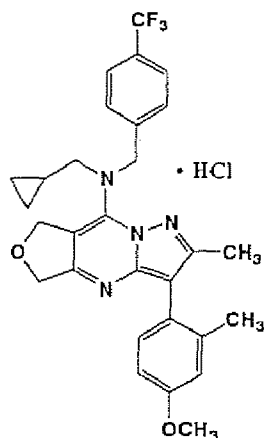


CCF: Rf 0,42 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,65 (da, J = 7,5 Hz, 2H), 7,49 (da, J = 7,5 Hz, 2H), 7,33 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,95 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,35 - 5,18 (m, 6H), 3,85 (s, 3H), 3,54 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 1,11 (m, 1H), 0,72 - 0,60 (m, 2H), 0,22 - 0,14 (m, 2H).

Ejemplo 2(248)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-trifluorometilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

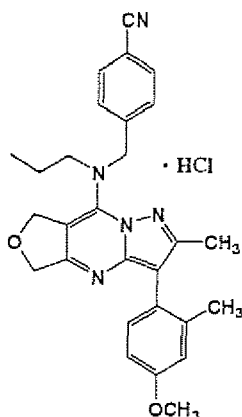


10 CCF: Rf 0,42 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,68 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,12 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,42 (m, 2H), 5,38 (s, 2H), 5,27 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,61 (m, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,15 (m, 1H), 0,74 - 0,66 (m, 2H), 0,26 - 0,18 (m, 2H).

Ejemplo 2(249)

15 Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

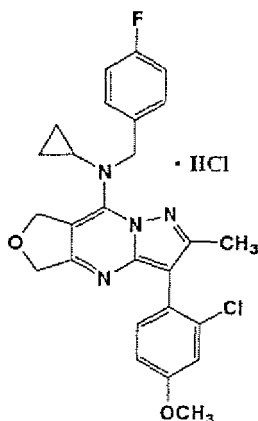


CCF: Rf 0,29 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,66 (da, J = 7,8 Hz, 2H), 7,49 (da, J = 7,8 Hz, 2H), 7,15 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,15 (sa, 2H), 5,09 (sa, 2H), 5,01 (sa, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,37 (m, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,74 - 1,60 (m, 2H), 0,91 (t, J = 6,9 Hz, 3H).

Ejemplo 2(250)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

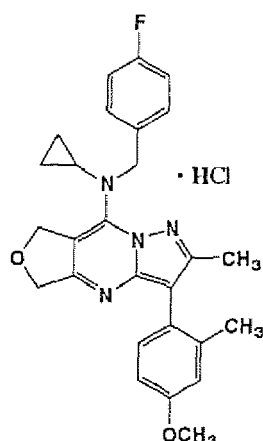


10 CCF: Rf 0,40 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,16 - 7,07 (m, 3H), 7,02 - 6,94 (m, 2H), 6,92 (dd, J = 8,4, 3,0 Hz, 1H), 5,20 (s, 2H), 5,18 (s, 2H), 4,94 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,56 (m, 1H), 2,41 (s, 3H), 0,89 - 0,79 (m, 4H).

Ejemplo 2(251)

15 Clorhidrato de 8-(N-ciclopropil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



CCF: Rf 0,44 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,19 - 7,08 (m, 3H), 7,04 - 6,96 (m, 2H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,28 - 5,18 (m, 4H), 5,00 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 2,60 (m, 1H), 2,38 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 0,90 - 0,80 (m, 4H).

5 Ejemplo 2(252)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

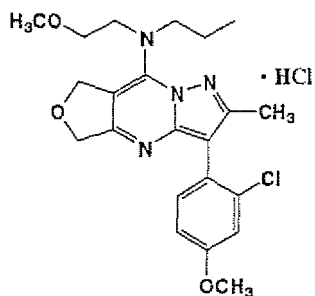


CCF: Rf 0,49 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,36 - 7,29 (m, 2H), 7,15 - 7,05 (m, 3H), 6,90 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,84 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 5,39 (s, 2H), 5,32 - 5,20 (m, 4H), 3,84 (s, 3H), 3,62 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,20 - 1,08 (m, 1H), 0,72 - 0,62 (m, 2H), 0,28 - 0,18 (m, 2H).

Ejemplo 2(253)

- 15 Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

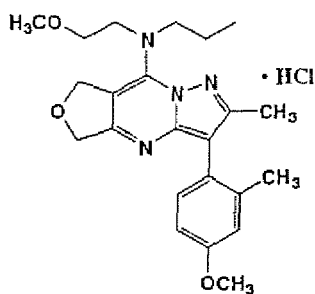


CCF: Rf 0,35 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,34 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 5,48 (d, J = 16,8 Hz, 1H), 5,36 (d, J = 16,8 Hz, 1H), 5,23 (s, 2H), 4,38 - 4,22 (m, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,78 - 3,66 (m, 4H), 3,34 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 1,81 (sext., J = 7,5 Hz, 2H), 1,01 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(254)

Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

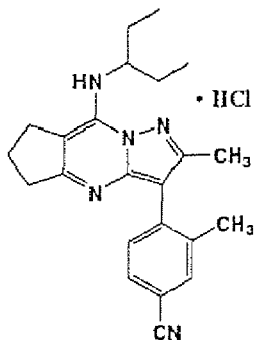


10 CCF: Rf 0,33 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,11 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,41 (s, 2H), 5,22 (s, 2H), 4,30 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,80 - 3,60 (m, 4H), 3,34 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,81 (sext., J = 7,5 Hz, 2H), 1,01 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(255)

15 Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-cianofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

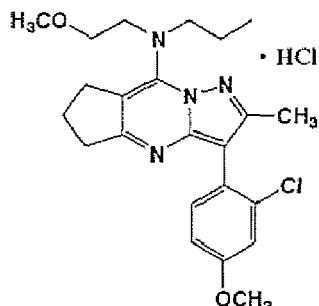


CCF: Rf 0,45 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,65 (s, 1H), 7,57 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 7,34 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 7,24 - 7,08 (m, 1H), 4,06 - 3,88 (m, 1H), 3,41 (ta, J = 7,2 Hz, 2H), 3,15 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,40 - 2,20 (m) y 2,30 (s) 8H total, 1,90 - 1,40 (m, 4H), 1,06 (t, J = 6,6 Hz, 6H).

Ejemplo 2(256)

Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-5-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

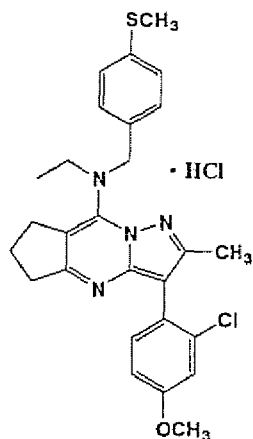


5 CCF: Rf 0,46 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,34 (da, J = 8,4 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,99 - 6,91 (m, 1H), 4,20 (m, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,75 (m, 2H), 3,62 (m, 2H), 3,52 - 3,30 (m, 2H), 3,30 (s, 3H), 3,03 (m, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,24 (m, 2H), 1,72 (m, 2H), 0,96 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(257)

10 Clorhidrato de 8-(N-etil-N-(4-metiltofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

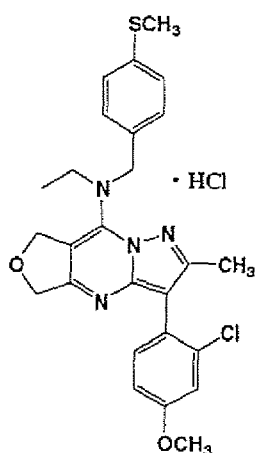


CCF: Rf 0,42 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,40 - 7,30 (m, 1H), 7,30 - 7,16 (m, 4H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,99 - 6,92 (m, 1H), 5,11 (sa, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,78 (m, 2H), 3,42 (m, 2H), 3,00 (m, 2H), 2,50 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 2,21 (m, 2H), 1,34 (m, 3H).

Ejemplo 2(258)

Clorhidrato de 8-(N-etil-N-(4-metiltofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

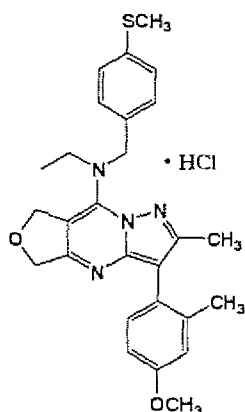


CCF: Rf 0,35 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,35 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,28 (da, J = 8,1 Hz, 2H), 7,21 (da, J = 8,1 Hz, 2H), 7,09 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 5,48 - 5,27 (m, 2H), 5,27 - 5,06 (m, 4H), 3,85 (s, 3H), 3,88 - 3,78 (m, 2H), 2,50 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 1,42 (t, J = 6,9 Hz, 3H).

Ejemplo 2(259)

Clorhidrato de 8-(N-etil-N-(4-metiltiofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

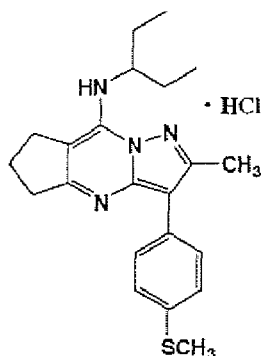


10 CCF: Rf 0,40 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,28 (da, J = 8,4 Hz, 2H), 7,22 (da, J = 8,4 Hz, 2H), 7,13 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,84 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,40 (sa, 2H), 5,22 - 5,08 (m, 4H), 3,86 (m, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,50 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,43 (t, J = 6,6 Hz, 3H).

Ejemplo 2(260)

15 Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(4-metiltiofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

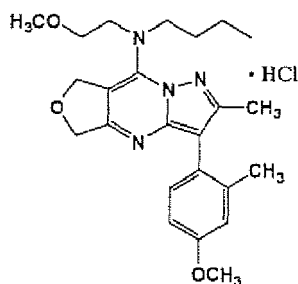


CCF: Rf 0,46 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,52 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,39 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,31 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 4,06 - 3,90 (m, 1H), 3,60 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,13 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,52 (s, 3H), 2,49 (s, 3H), 2,30 (quint., J = 7,8 Hz, 2H), 1,94 - 1,64 (m, 4H), 1,05 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(261)

Clorhidrato de 8-(N-butil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

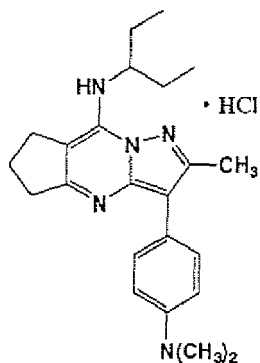


10 CCF: Rf 0,61 (hexano:acetato de etilo = 1:2);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,11 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,40 (s, 2H), 5,22 (s, 2H), 4,29 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,78 (m, 2H), 3,72 (t, J = 5,1 Hz, 2H), 3,34 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,77 (quintete, J = 7,5 Hz, 2H), 1,42 (sextete, J = 7,5 Hz, 2H), 1,00 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(262)

15 Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(4-dimetilaminofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

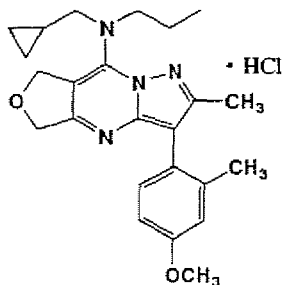


CCF: Rf 0,57 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,72 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,60 - 7,40 (m, 2H), 6,88 - 6,75 (m, 1H), 3,98 - 3,85 (m, 1H), 3,35 - 3,25 (m, 2H), 3,15 - 3,05 (m) y 3,13 (s) 8H total, 2,52 (s, 3H), 2,25 (quint., J = 7,8 Hz, 2H), 1,85 - 1,60 (m, 4H), 1,03 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(263)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

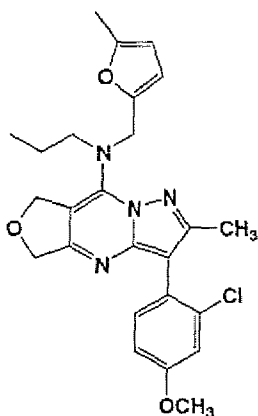


5 CCF: Rf 0,55 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,24 (s, 2H), 5,04 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,69 - 3,63 (m, 4H), 2,33 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,70 (sext., J = 7,5 Hz, 2H), 1,07 (m, 1H), 0,96 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 0,56 (m, 2H), 0,20 (m, 2H).

Ejemplo 2(264)

10 8-(N-Propil-N-(5-metilfuran-2-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

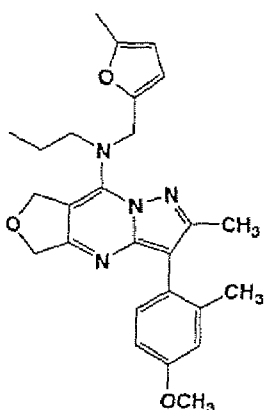


CCF: Rf 0,47 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,31 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,90 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 6,02 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 5,86 (m, 1H), 5,08 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 4,90 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,26 (m, 2H), 2,41 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 1,66 (m, 2H), 0,94 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(265)

8-(N-Propil-N-(5-metilfuran-2-il)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

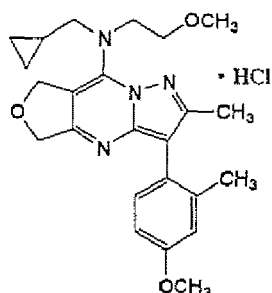


CCF: Rf 0,49 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,18 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 2,4, 8,1 Hz, 1H), 6,01 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 5,86 (m, 1H), 5,07 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 4,88 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,25 (m, 2H), 2,37 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,67 (m, 2H), 0,94 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(266)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1, 5-a]pirimidina

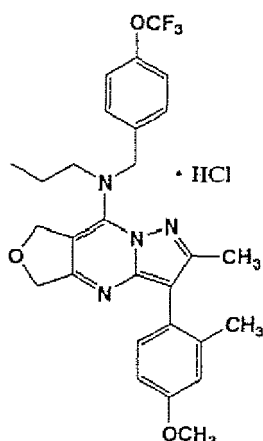


10 CCF: Rf 0,29 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,1, 2,4 Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 4,90 (s, 2H), 4,05 (t, J = 5,4 Hz, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,56 (t, J = 5,4 Hz, 2H), 3,48 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 3,29 (s, 3H), 2,34 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 1,04 (m, 1H), 0,56 (m, 2H), 0,22 (m, 2H).

Ejemplo 2(267)

15 Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(4-trifluorometiloxifenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

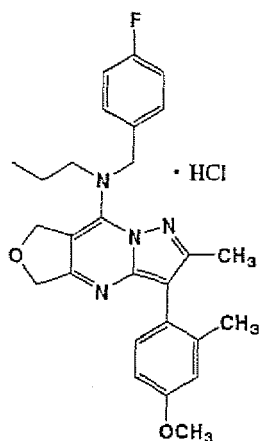


CCF: Rf 0,51 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,36 (da, J = 8,1 Hz, 2H), 7,18 (da, J = 8,1 Hz, 2H), 7,17 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,13 (sa, 2H), 4,97 (sa, 2H), 4,92 (sa, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,34 (m, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,64 (m, 2H), 0,90 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(268)

Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

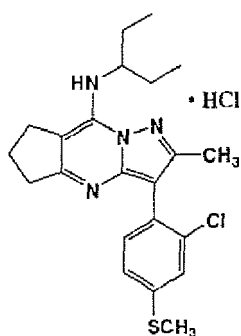


10 CCF: Rf 0,53 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 - 7,22 (m, 2H), 7,17 (da, J = 8,7 Hz, 1H), 7,02 (m, 2H), 6,88 (d, J=2,4 Hz, 1H), 6,82 (da, J = 8,7 Hz, 1H), 5,11 (sa, 2H), 4,95 (sa, 4H), 3,83 (s, 3H), 3,34 (m, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,65 (m, 2H), 0,90 (t, J = 6,9 Hz, 3H).

Ejemplo 2(269)

15 Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

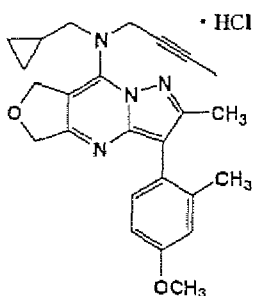


CCF: Rf 0,64 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,40 - 7,34 (m, 2H), 7,33 - 7,24 (m, 2H), 3,99 (m, 1H), 3,66 - 3,35 (m, 2H), 3,13 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,52 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 2,30 (m, 2H), 1,94 - 1,64 (m, 4H), 1,10 - 1,00 (m, 6H).

5 Ejemplo 2(270)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(2-butinil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

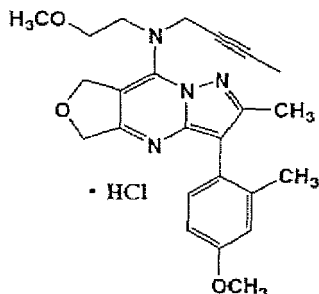


CCF: Rf 0,52 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,14 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 5,37 (s, 2H), 5,05 (s, 2H), 4,58 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,62 (m, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 1,84 (s, 3H), 1,20 (m, 1H), 0,63 (m, 2H), 0,36 (m, 2H).

Ejemplo 2(271)

- 15 Clorhidrato de 8-(N-(2-metoxietil)-N-(2-butinil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

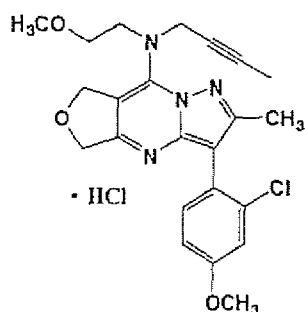


CCF: Rf 0,29 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 20 RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,13 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,1, 2,4 Hz, 1H), 5,39 (s, 2H), 5,06 (s, 2H), 4,42 (s, 2H), 4,06 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,81 (m, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,33 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 1,85 (s, 3H).

Ejemplo 2(272)

Clorhidrato de 8-(N-(2-metoxietil)-N-(2-butilil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1, 5-a]pirimidina

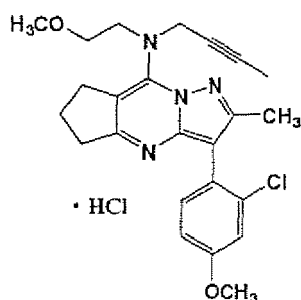


CCF: Rf 0,39 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,28 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,37 (s, 2H), 4,92 (s, 2H), 4,36 (m, 2H), 3,95 (t, J = 5,4 Hz, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,76 (t, J = 5,4 Hz, 2H), 3,36 (s, 3H), 2,37 (s, 3H), 1,83 (s, 3H).

Ejemplo 2(273)

- 10 Clorhidrato de 8-(N-(2-metoxietil)-N-(2-butilil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1, 5-a]pirimidina

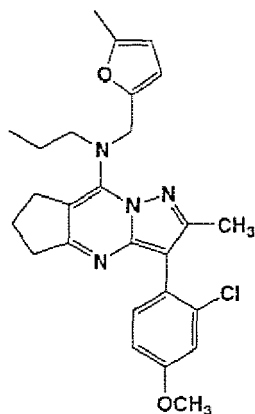


CCF: Rf 0,44 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,93 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,53 (m, 2H), 4,18 (m, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,81 (t, J = 4,8 Hz, 2H), 3,36 (s, 3H), 3,30 (m, 2H), 3,20 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,22 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,86 (t, J = 2,4 Hz, 3H).

Ejemplo 2(274)

8-(N-Propil-N-(5-metilfuran-2-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

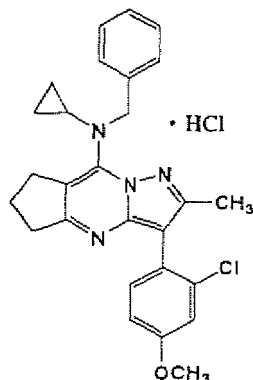


CCF: Rf 0,53 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 5,99 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 5,85 (dd, J = 1,6, 3,0 Hz, 1H), 4,78 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,35 (m, 2H), 2,90 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,81 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,39 (s, 3H), 2,22 (m, 3H), 2,07 (m, 2H), 1,62 (m, 2H), 0,91 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

5 Ejemplo 2(275)

Clorhidrato de 8-(N-bencil-N-ciclopropilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

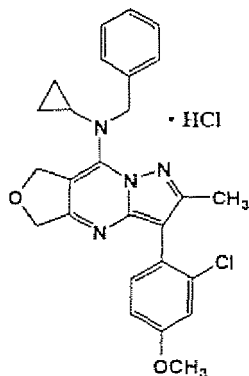


CCF: Rf 0,49 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,42 - 7,30 (m, 4H), 7,25 - 7,15 (m, 2H), 7,09 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,00 - 6,94 (m, 1H), 5,39 (d, J = 14,7 Hz, 1H), 5,27 (d, J = 14,7 Hz, 1H), 3,85 (s, 3H), 3,70 - 3,32 (m, 2H), 3,12 (m, 2H), 2,96 (m, 1H), 2,37 (s, 3H), 2,21 (m, 2H), 1,20 - 0,92 (m, 4H).

Ejemplo 2(276)

15 Clorhidrato de 8-(N-bencil-N-ciclopropilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

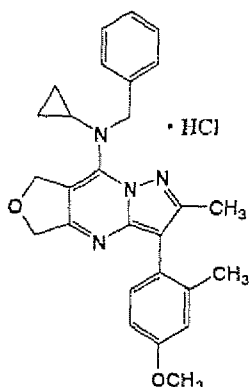


CCF: Rf 0,42 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,30 - 7,26 (m, 3H), 7,15 - 7,09 (m, 2H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,91 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,20 (s, 2H), 5,19 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,56 (m, 1H), 2,41 (s, 3H), 0,92 - 0,78 (m, 4H).

Ejemplo 2(277)

Clorhidrato de 8-(N-bencil-N-ciclopropilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

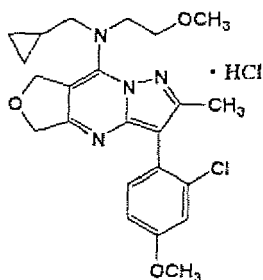


CCF: Rf 0,40 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,33 - 7,19 (m, 3H), 7,19 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,14 - 7,08 (m, 2H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 5,32 - 5,12 (m, 2H), 5,19 (s, 2H), 4,89 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 2,57 (m, 1H), 2,38 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 0,92 - 0,78 (m, 4H).

Ejemplo 2(278)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1, 5-a]pirimidina

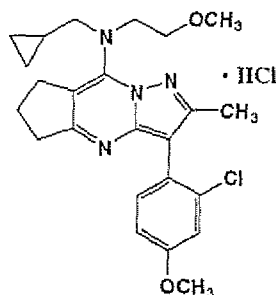


10 CCF: Rf 0,30 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,33 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,94 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,30 (m) y 5,27 (s) 4H total, 4,32 (m, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,72 - 3,67 (m, 4H), 3,31 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 1,11 (m, 1H), 0,71 (m, 2H), 0,36 (m, 2H).

Ejemplo 2(279)

15 Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1, 5-a]pirimidina



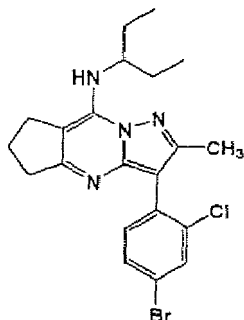
CCF: Rf 0,33 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,34 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,95 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 4,30 (m,

2H), 3,85 (s, 3H), 3,71 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 3,64 (t, J = 5,1 Hz, 2H), 3,41 (m, 2H), 3,29 (s, 3H), 3,07 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,24 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,09 (m, 1H), 0,65 (m, 2H), 0,31 (m, 2H).

Ejemplo 2(280)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-bromofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



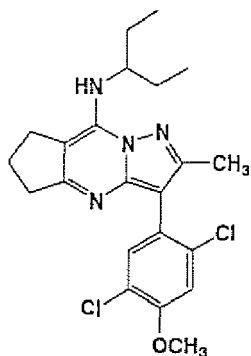
5

CCF: Rf 0,61 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,65 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 7,44 (dd, J = 2,1, 8,1 Hz, 1H), 7,28 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,23 (d a, J = 10,5 Hz, 1H), 3,81 (m, 1H), 3,09 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,90 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,15 (m, 2H), 1,60 - 1,82 (m, 4H), 1,01 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

10 Ejemplo 2(281)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2,5-dicloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

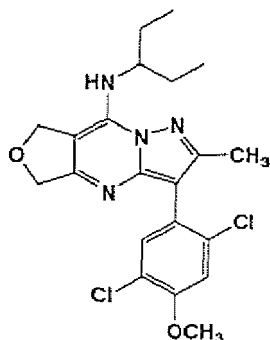


CCF: Rf 0,65 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,40 (s, 1H), 7,06 (s, 1H), 6,22 (d a, J = 10,5 Hz, 1H), 3,92 (s, 3H), 3,81 (m, 1H), 3,08 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 2,33 (s, 3H), 2,15 (m, 2H), 1,58 - 1,82 (m, 4H), 1,01 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(282)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2,5-dicloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

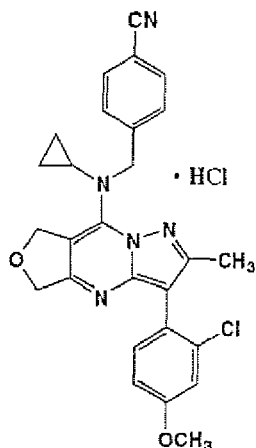


CCF: Rf 0,61 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,39 (s, 1H), 7,07 (s, 1H), 6,34 (d a, J = 10,5 Hz, 1H), 5,29 (m, 2H), 4,93 (m, 2H), 3,93 (s, 3H), 3,24 (m, 1H), 2,36 (s, 3H), 1,67 - 1,84 (m, 4H), 1,02 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(283)

- 5 Clorhidrato de 8-(N-ciclopropil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

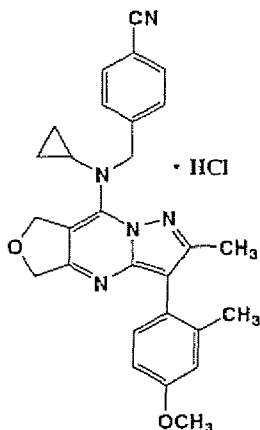


CCF: Rf 0,26 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,61 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,33 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,30 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,91 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 5,27 (s, 2H), 5,25 (s, 2H), 4,93 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,58 (m, 1H), 2,40 (s, 3H), 0,84 (m, 4H).

Ejemplo 2(284)

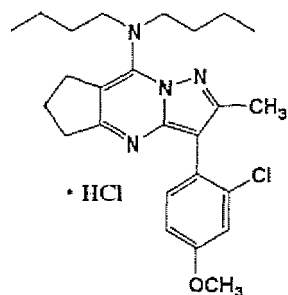
- Clorhidrato de 8-(N-ciclopropil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



- 15 CCF: Rf 0,24 (hexano:acetato de etilo = 2:1);
- RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,61 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,33 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,17 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 5,40 - 5,20 (m, 2H), 5,25 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 2,58 (m, 1H), 2,36 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 0,84 (m, 4H).

20 Ejemplo 2(285)

- Clorhidrato de 8-dibutilamino-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

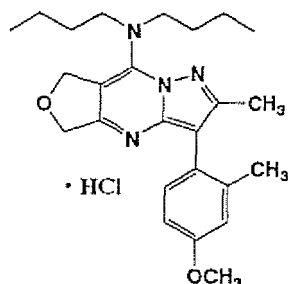


CCF: Rf 0,66 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,35 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,94 (dd, J = 8,4, 2,1 Hz, 1H), 3,84 (s y m, 7H total), 3,35 (m, 2H), 3,01 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,22 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,67 (quint., J = 7,5 Hz, 4H), 1,36 (sext., J = 7,5 Hz, 2H), 0,95 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(286)

Clorhidrato de 8-dibutilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

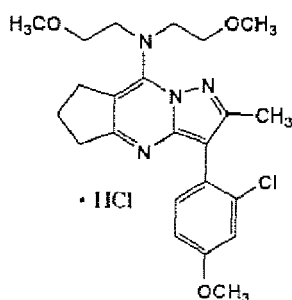


CCF: Rf 0,63 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,11 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,43 (s, 2H), 5,21 (s, 2H), 3,88 (m, 4H), 3,83 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,78 (quint., J = 7,5 Hz, 4H), 1,42 (sext., J = 7,5 Hz, 4H), 1,00 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(287)

15 Clorhidrato de 8-bis(2-metoxietil)amino-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

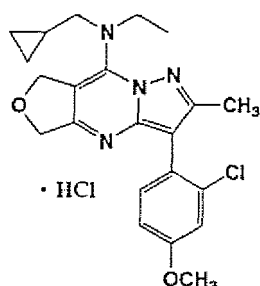


CCF: Rf 0,26 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,35 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 9,0, 2,7 Hz, 1H), 4,15 (m, 4H), 3,85 (s, 3H), 3,64 (t, J = 5,4 Hz, 4H), 3,53 (m, 1H), 3,45 (m, 1H), 3,31 (s, 6H), 3,05 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,22 (quint., J = 7,2 Hz, 2H).

Ejemplo 2(288)

Clorhidrato de 8-(N-etil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

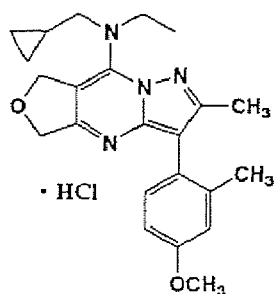


CCF: Rf 0,49 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,31 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,92 (m, 1H), 5,28 (s, 2H), 5,11 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,81 (m, 2H), 3,69 (m, 2H), 2,37 (s, 3H), 1,33 (s, 3H), 1,09 (m, 1H), 0,60 (m, 2H), 0,24 (m, 2H).

Ejemplo 2(289)

Clorhidrato de 8-(N-etil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



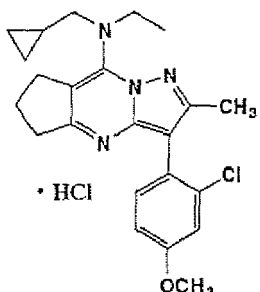
10

CCF: Rf 0,50 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,12 (m, 1H), 6,89 (s, 1H), 6,82 (m, 1H), 5,38 (m, 2H), 5,31 (m, 2H), 3,99 (m, 2H), 3,83 (s y m, 5H total), 2,31 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,44 (m, 3H), 1,19 (m, 1H), 0,72 (m, 2H), 0,36 (m, 2H).

Ejemplo 2(290)

- 15 Clorhidrato de 8-(N-etil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

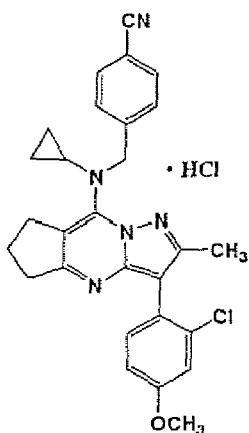


CCF: Rf 0,51 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,31 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,77 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 3,59 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 3,04 (t, J = 7,5 Hz, 4H), 2,36 (s, 3H), 2,16 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,23 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 1,03 (m, 1H), 0,50 (m, 2H), 0,15 (m, 2H).

Ejemplo 2(291)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta [d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

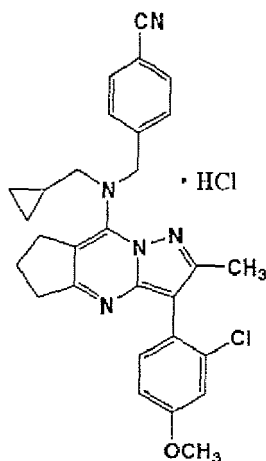


CCF: Rf 0,29 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 5 RMN (300 MHz, DMSO- d_6): δ 7,83 - 7,76 (m, 2H), 7,54 - 7,48 (m, 2H), 7,30 (dd, J = 8,7, 1,2 Hz, 1H), 7,16 (m, 1H), 7,02 - 6,96 (m, 1H), 5,12 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,06 (m, 2H), 2,94 - 2,78 (m, 3H), 2,25 (s, 3H), 2,05 (m, 2H), 0,79 - 0,70 (m, 2H), 0,61 (m, 2H).

Ejemplo 2(292)

- 10 Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta [d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

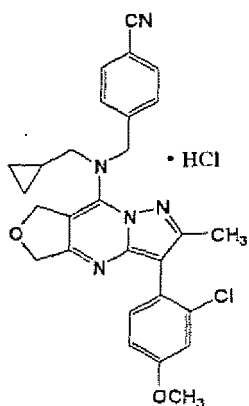


CCF: Rf 0,37 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 15 RMN (300 MHz, CDCl $_3$): δ 7,69 (da, J = 7,2 Hz, 2H), 7,49 (da, J = 7,2 Hz, 2H), 7,34 (da, J = 8,4 Hz, 1H), 7,09 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,96 (m, 1H), 5,33 (m, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,60 (m, 2H), 3,48 (m, 2H), 3,10 (m, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,28 (m, 2H), 1,18 - 1,02 (m, 1H), 0,70 - 0,58 (m, 2H), 0,22 - 0,10 (m, 2H).

Ejemplo 2(293)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo [3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

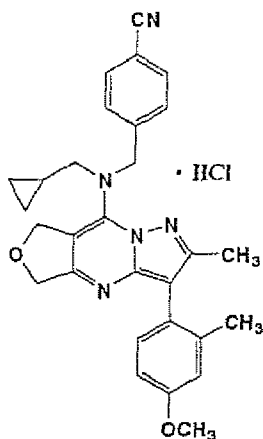


CCF: Rf 0,21 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,68 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,52 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,31 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,94 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 5,26 (m, 4H), 5,14 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,45 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 1,05 (m, 1H), 0,68 - 0,56 (m, 2H), 0,18 - 0,10 (m, 2H).

Ejemplo 2(294)

Clorhidrato de 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

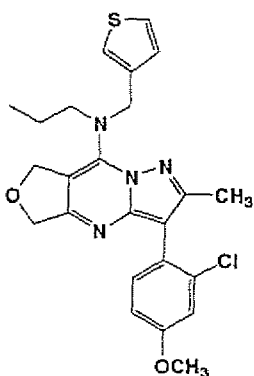


10 CCF: Rf 0,37 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,66 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,52 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,15 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,1, 2,4 Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 5,13 (s, 2H), 5,00 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,41 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,02 (m, 1H), 0,60 - 0,52 (m, 2H), 0,12 - 0,06 (m, 2H).

Ejemplo 2(295)

15 8-(N-Propil-N-(tiofen-3-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

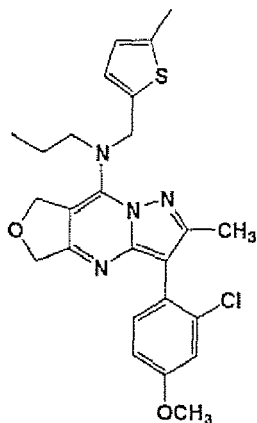


CCF: Rf 0,48 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,31 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,28 (m, 1H), 7,13 (m, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,98 (dd, J = 0,9, 4,8 Hz, 1H), 6,90 (dd, J = 2,4, 8,7 Hz, 1H), 5,08 (s, 2H), 4,96 (s, 2H), 4,89 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,32 (m, 2H), 2,41 (s, 3H), 1,64 (m, 2H), 0,90 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(296)

8-(N-Propil-N-(5-metilthiopen-2-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

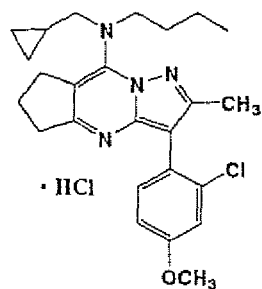


10 CCF: Rf 0,50 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,31 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,90 (dd, J = 2,4, 8,7 Hz, 1H), 6,66 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 6,56 (m, 1H), 5,02 - 5,17 (m, 4H), 4,90 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,27 (m, 2H), 2,44 (s, 3H), 2,42 (s, 3H), 1,64 (m, 2H), 0,92 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(297)

15 Clorhidrato de 8-(N-butil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

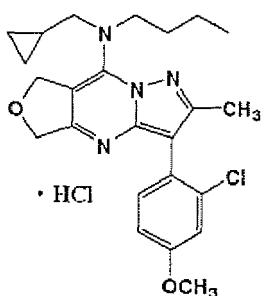


CCF: Rf 0,61 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,31 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,7, 2,1 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,69 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 3,56 (d, J = 7,2 Hz, 2H), 3,02 (m, 4H), 2,36 (s, 3H), 2,15 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,58 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,34 (sext., J = 7,5 Hz, 2H), 1,02 (m, 1H), 0,91 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 0,48 (m, 2H), 0,13 (m, 2H).

Ejemplo 2(298)

- 5 Clorhidrato de 8-(N-butil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

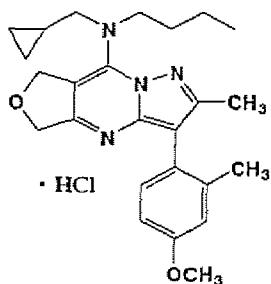


CCF: Rf 0,40 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,93 (dd, J = 8,4, 2,1 Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 5,17 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,77 (m, 2H), 3,71 (m, 2H), 2,37 (s, 3H), 1,70 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,39 (sext., J = 7,2 Hz, 2H), 1,10 (m, 1H), 0,96 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,62 (m, 2H), 0,25 (m, 2H).

Ejemplo 2(299)

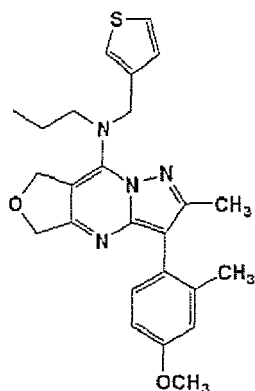
- Clorhidrato de 8-(N-butil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



- 15 CCF: Rf 0,45 (hexano:acetato de etilo = 2:1);
- RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,7, 2,1 Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 5,13 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,75 (m, 2H), 3,70 (m, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,69 (m, 2H), 1,39 (sext., J = 7,5 Hz, 2H), 1,09 (m, 1H), 0,96 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 0,60 (m, 2H), 0,23 (m, 2H).

- 20 Ejemplo 2(300)

8-(N-Propil-N-(tiofen-3-il)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

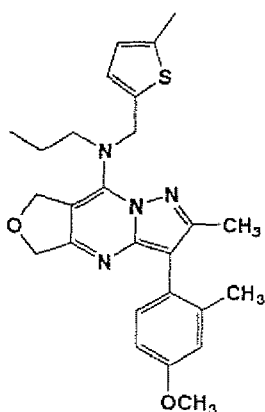


CCF: Rf 0,48 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN(300 MHz, CDCl₃): δ 7,28 (dd, J = 2,7, 5,1 Hz, 1H), 7,18 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,13 (m, 1H), 6,97 (dd, J = 1,5, 5,1 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 3,0, 8,7 Hz, 1H), 5,07 (s, 2H), 4,96 (s, 2H), 4,87 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,31 (m, 2H), 2,37 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,64 (m, 2H), 0,91 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(301)

8-(N-Propil-N-(5-metilthiopen-2-il)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

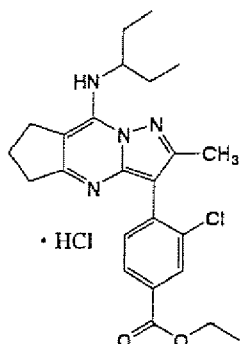


10 CCF: Rf 0,47 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,18 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 3,0, 8,4 Hz, 1H), 6,65 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 6,55 (m, 1H), 5,11 (s, 4H), 4,88 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,27 (m, 2H), 2,43 (s, 3H), 2,38 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,65 (m, 2H), 0,92 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(302)

15 Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-etoxicarbonilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

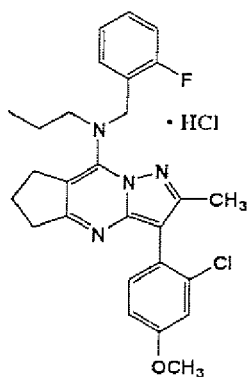


CCF: Rf 0,56 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,21 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 8,08 (dd, J = 1,5, 7,8 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 7,30 (da, J = 10,8 Hz, 1H), 4,38 (q, J = 6,9 Hz, 2H), 4,00 (m, 1H), 3,34 - 3,64 (m, 2H), 3,15 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,31 (m, 2H), 1,65 - 1,96 (m, 4H), 1,41 (t, J = 6,9 Hz, 3H), 1,07 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 1,06 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(303)

Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(2-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

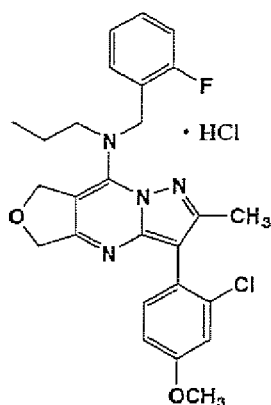


10 CCF: Rf 0,52 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,35 (m, 2H), 7,10 - 6,92 (m, 5H), 5,16 (m, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,70 (m, 2H), 3,60 - 3,34 (m, 2H), 3,03 (m, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,26 (m, 2H), 1,75 (m, 2H), 0,94 (m, 3H).

Ejemplo 2(304)

15 Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(2-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

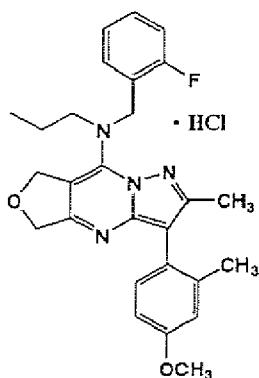


CCF: Rf 0,45 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,48 - 7,33 (m, 2H), 7,13 - 7,04 (m, 4H), 6,97 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,50 - 5,15 (m, 4H), 5,17 (s, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,74 - 3,60 (m, 2H), 2,37 (s, 3H), 1,82 (sext., J = 7,2 Hz, 2H), 0,97 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(305)

- 5 Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(2-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

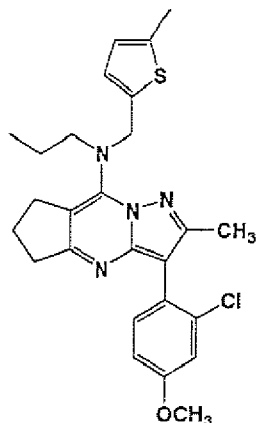


CCF: Rf 0,55 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,36 - 7,26 (m, 1H), 7,16 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,09 - 6,96 (m, 3H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 5,13 (s, 2H), 5,03 (s, 2H), 5,02 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,41 (m, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,69 (sext., J = 7,2 Hz, 2H), 0,92 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(306)

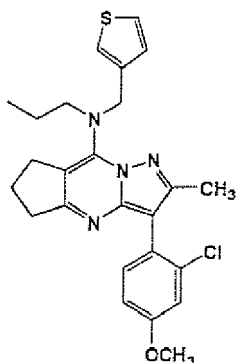
8-(N-Propil-N-(5-metil-tiofen-2-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



- 15 CCF: Rf 0,57 (hexano:acetato de etilo = 2:1);
- RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 6,64 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 6,54 (m, 1H), 4,96 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,38 (m, 2H), 2,90 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,86 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,43 (s, 3H), 2,40 (s, 3H), 2,08 (m, 2H), 1,61 (m, 2H), 0,90 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

20 Ejemplo 2(307)

8-(N-Propil-N-(tiofen-3-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

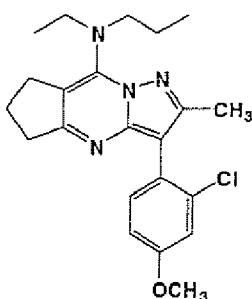


CCF: Rf 0,53 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,25 (m, 1H), 7,11 (m, 1H), 7,07 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,95 (dd, J = 1,5, 5,1 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 2,7, 8,7 Hz, 1H), 4,85 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,39 (m, 2H), 2,90 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,81 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,39 (s, 3H), 2,07 (m, 2H), 1,60 (m, 2H), 0,89 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(308)

8-(N-Etil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

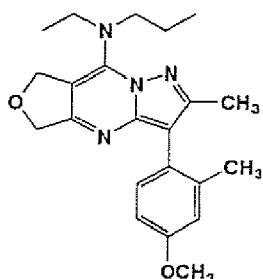


CCF: Rf 0,58 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,30 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,88 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,66 (q, J = 6,9 Hz, 2H), 3,60 - 3,50 (m, 2H), 3,02 - 2,84 (m, 4H), 2,37 (s, 3H), 2,20 - 2,04 (m, 2H), 1,64 - 1,52 (m, 2H), 1,17 (t, J = 6,9 Hz, 3H), 0,90 (t, J = 6,9 Hz, 3H).

Ejemplo 2(309)

8-(N-Etil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



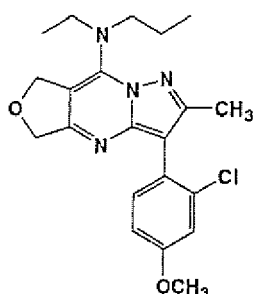
15

CCF: Rf 0,55 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 5,20 (s, 2H), 4,89 (s, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,67 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 3,60 - 3,48 (m, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,72 - 1,56 (m, 2H), 1,23 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,93 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

20 Ejemplo 2(310)

8-(N-Etil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

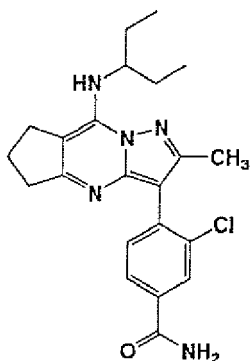


CCF: Rf 0,51 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 5,19 (s, 2H), 4,90 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,67 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 3,60 - 3,48 (m, 2H), 2,38 (s, 3H), 1,70 - 1,50 (m, 2H), 1,24 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,93 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(311)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-carbamoilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

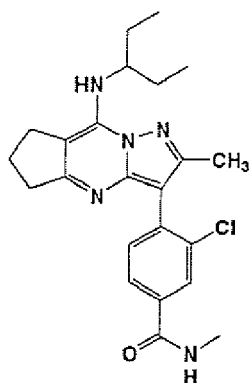


10 CCF: Rf 0,53 (cloruro de metileno:acetato de etilo = 10:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,96 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,70 (dd, J = 8,1, 1,8 Hz, 1H), 7,50 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,26 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,82 (m, 1H), 3,14 - 3,05 (m, 2H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,22 - 2,10 (m, 2H), 1,85 - 1,50 (m, 4H), 1,02 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(312)

15 8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-(N-metilcarbamoil)fenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

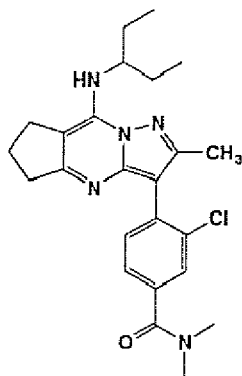


CCF: Rf 0,55 (cloruro de metileno:acetato de etilo = 10:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,89 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 7,8, 1,8 Hz, 1H), 7,45 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 6,42 (sa, 1H), 6,26 (d, J = 10,2 Hz, 1H), 3,82 (m, 1H), 3,14 - 3,05 (m, 2H), 3,01 (d, J = 4,5 Hz, 3H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,22 - 2,09 (m, 2H), 1,82 - 1,55 (m, 4H), 1,02 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(313)

- 5 8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-(N,N-dimetilcarbamoil)fenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

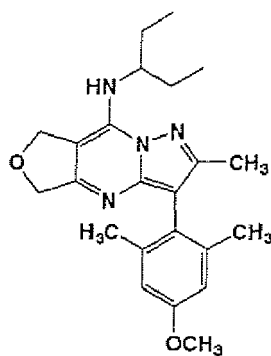


CCF: Rf 0,65 (cloruro de metileno:acetato de etilo = 10:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,56 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,46 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 7,36 (dd, J = 7,8, 1,5 Hz, 1H), 6,26 (d, J = 9,9 Hz, 1H), 3,82 (m, 1H), 3,17 - 3,02 (m, 8H), 2,92 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,21 - 2,06 (m, 2H), 1,85 - 1,42 (m, 4H), 1,02 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(314)

- 8-(3-Pentilamina)-2-metil-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

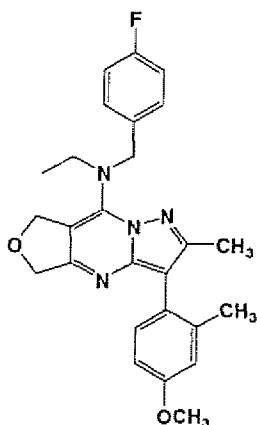


- 15 CCF: Rf 0,29 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 6,69 (s, 2H), 6,32 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 5,29 (s, 2H), 4,88 (s, 2H), 3,80 (s, 3H), 3,30 - 3,18 (m, 1H), 2,22 (s, 3H), 2,04 (s, 6H), 1,83 - 1,55 (m, 4H), 1,03 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(315)

- 8-(N-Etil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

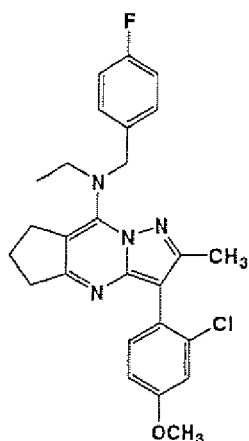


CCF: Rf 0,49 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,30 - 7,22 (m, 2H), 7,18 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,06 - 6,94 (m, 2H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 5,09 (s, 2H), 4,96 - 4,80 (m, 4H), 3,83 (s, 3H), 3,41 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 2,37 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,23 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(316)

8-(N-Etil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

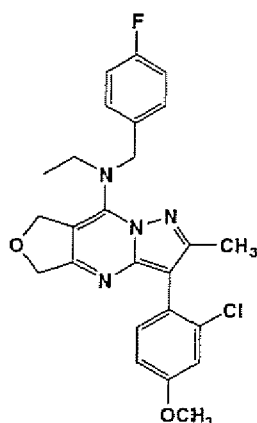


10 CCF: Rf 0,42 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,26 - 7,22 (m, 2H), 7,07 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,04 - 6,94 (m, 2H), 6,90 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 4,81 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,47 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 2,90 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,82 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,40 (s, 3H), 2,16 - 1,98 (m, 2H), 1,18 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(317)

15 8-(N-Etil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

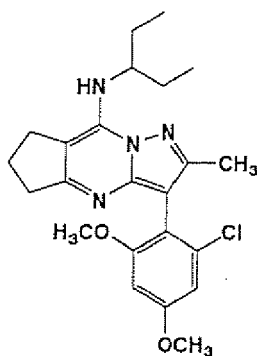


CCF: Rf 0,46 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,31 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,30 - 7,24 (m, 2H), 7,08 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,06 - 6,94 (m, 2H), 6,91 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 5,10 (s, 2H), 4,90 (s, 2H), 4,89 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,42 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 2,40 (s, 3H), 1,22 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(318)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4,6-dimetoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

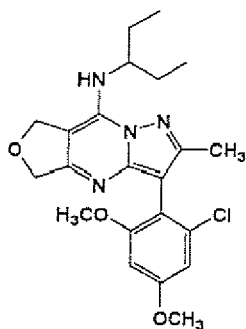


CCF: Rf 0,26 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 6,67 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,45 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,23 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,80 (m, 1H), 3,70 (s, 3H), 3,07 (m, 2H), 2,90 (m, 2H), 2,25 (s, 3H), 2,13 (m, 2H), 1,52 - 1,80 (m, 4H), 1,02 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 1,01 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(319)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4,6-dimetoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



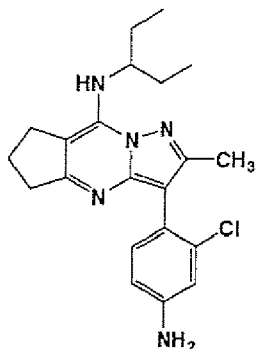
15

CCF: Rf 0,22 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 6,68 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,47 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,34 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 5,28 (s, 2H), 4,92 (d, J = 13,5 Hz, 1H), 4,90 (d, J = 3,5 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,71 (s, 3H), 3,23 (m, 1H), 2,28 (s, 3H), 1,53 - 1,82 (m, 4H), 1,02 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 1,01 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(320)

5 8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-aminofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta [d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

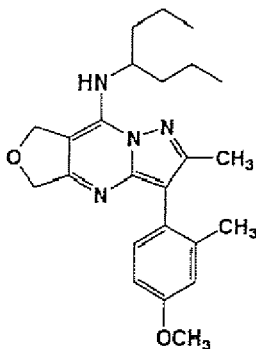


CCF: Rf 0,22 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,82 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,63 (dd, J = 8,4, 2,1 Hz, 1H), 6,21 (d, J = 10,2 Hz, 1H), 3,87 - 3,62 (m, 3H), 3,12 - 3,03 (m, 2H), 2,95 - 2,86 (m, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,20 - 2,07 (m, 2H), 1,85 - 1,50 (m, 4H), 1,01 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(321)

8-(4-Heptilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d] pirazolo[1,5-a]pirimidina

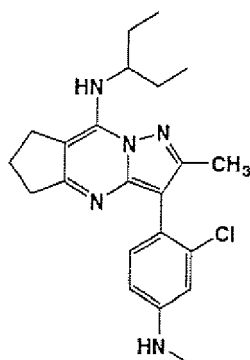


CCF: Rf 0,48 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 6,32 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 5,29 (s, 2H), 4,90 (s, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,40 (m, 1H), 2,32 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,78 - 1,38 (m, 8H), 0,95 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(322)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metilaminofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

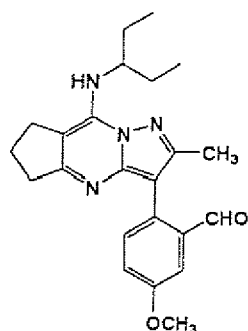


CCF: Rf 0,45 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,18 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,73 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,56 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 6,21 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,88 - 3,70 (m, 2H), 3,12 - 3,02 (m, 2H), 2,95 - 2,80 (m, 2H), 2,85 (s, 3H), 2,34 (s, 3H), 2,20 - 2,05 (m, 2H), 1,80 - 1,50 (m, 4H), 1,01 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(323)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-formil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

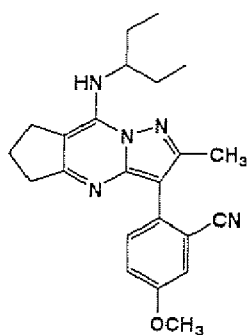


CCF: Rf 0,26 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 9,85 (s, 1H), 7,55 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,38 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,22 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 6,23 (d, J = 9,6 Hz, 1H), 3,93 - 3,74 (m) y 3,89 (s) 4H total, 3,09 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,88 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,39 (s, 3H), 2,14 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,83 - 1,50 (m, 4H), 1,02 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(324)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-ciano-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



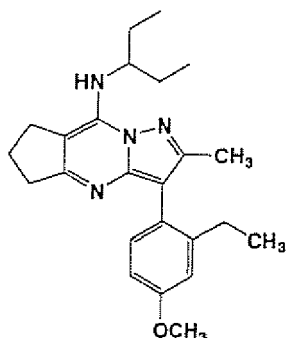
15

CCF: Rf 0,54 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,46 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,24 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,18 (dd, J = 9,0, 2,4 Hz, 1H), 6,24 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,88 - 3,73 (m) y 3,86 (s) 4H total, 3,09 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,92 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,43 (s, 3H), 2,15 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,80 - 1,50 (m, 4H), 1,02 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(325)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-etil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

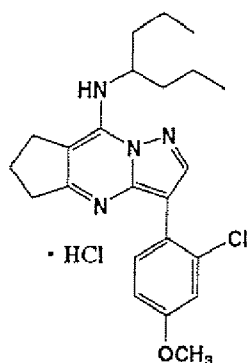


CCF: Rf 0,30 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,12 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,77 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 6,21 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,83 - 3,75 (m) y 3,83 (s) 4H total, 3,08 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,88 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,52 (q, J = 7,8 Hz, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,13 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,83 - 1,50 (m, 4H), 1,10 - 0,98 (m, 9H).

Ejemplo 2(326)

Clorhidrato de 8-(4-heptilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



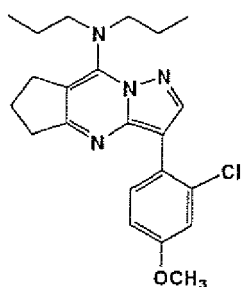
10

CCF: Rf 0,51 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,20 (s, 1H), 7,65 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,38 (d, J = 10,2 Hz, 1H), 7,08 - 6,97 (m, 2H), 4,15 (m, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,61 (m, 2H), 3,16 (m, 2H), 2,33 (m, 2H), 1,88 - 1,60 (m, 4H), 1,60 - 1,35 (m, 4H), 0,99 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

15 Ejemplo 2(327)

8-(N,N-Dipropilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



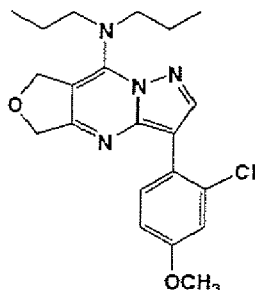
CCF: Rf 0,54 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,32 (s, 1H), 7,78 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,03 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,91 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz,

1H), 3,83 (s, 3H), 3,57 (m, 4H), 2,97 (m, 4H), 2,17 (m, 2H), 1,66 - 1,50 (m, 4H), 0,88 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(328)

8-(N,N-Dipropilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

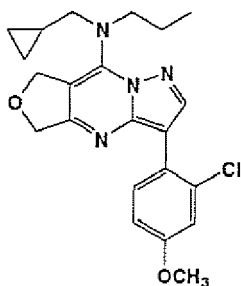


5 CCF: Rf 0,58 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,35 (s, 1H), 7,72 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,04 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,91 (dd, J = 9,0, 2,4 Hz, 1H), 5,20 (s, 2H), 4,94 (s, 2H), 3,82 (s, 3H), 3,57 (t, J = 7,5 Hz, 4H), 1,72 - 1,46 (m, 4H), 0,90 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(329)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-propilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



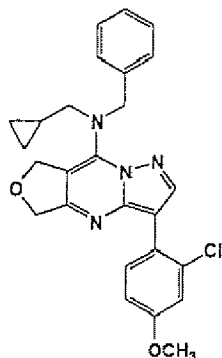
10

CCF: Rf 0,60 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,37 (s, 1H), 7,73 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,05 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,92 (dd, J=8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 4,96 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,64 - 3,50 (m, 4H), 1,72 - 1,56 (m, 2H), 1,04 (m, 1H), 0,93 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 0,58 - 0,44 (m, 2H), 0,20 - 0,08 (m, 2H).

15 Ejemplo 2(330)

8-(N-Bencil-N-ciclopropilmetilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

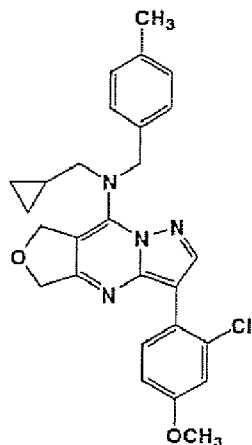


CCF: Rf 0,52 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,42 (s, 1H), 7,74 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,38 - 7,20 (m, 5H), 7,06 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,93 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 4,96 (s, 2H), 4,95 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,43 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 1,04 (m, 1H), 0,58 - 0,46 (m, 2H), 0,16 - 0,04 (m, 2H).

Ejemplo 2(331)

- 5 8-(N-Ciclopropilmetil-N-(4-metilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

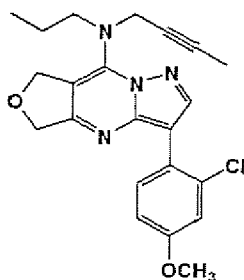


CCF: Rf 0,56 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,42 (s, 1H), 7,75 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,19 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,13 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,06 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,93 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,24 (s, 2H), 4,95 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,42 (d, J = 6,3 Hz, 2H), 2,33 (s, 3H), 1,04 (m, 1H), 0,58 - 0,46 (m, 2H), 0,18 - 0,04 (m, 2H).

Ejemplo 2(332)

8-(N-Propil-N-(2-butilil)amino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

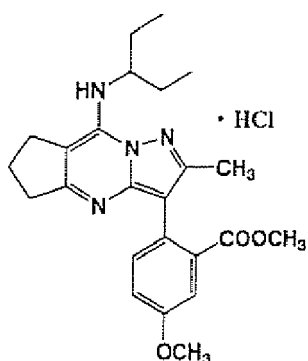


- 15 CCF: Rf 0,41 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,37 (s, 1H), 7,71 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,05 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,92 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 5,34 (s, 2H), 4,97 (s, 2H), 4,44 (q, J = 2,4 Hz, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,52 (m, 2H), 1,82 (t, J = 2,4 Hz, 3H), 1,80 - 1,62 (m, 2H), 0,98 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(333)

- 20 Clorhidrato de 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metoxicarbonil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

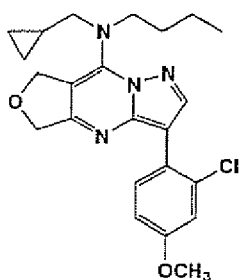


CCF: Rf 0,26 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,70 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,34 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,30 - 7,16 (m) y 7,19 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz) 2H total, 4,03 - 3,83 (m) y 3,89 (s) 4H total, 3,77 (s, 3H), 3,54 - 3,36 (m, 2H), 3,11 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,33 - 2,00 (m) y 2,25 (s) 4H total, 1,90 - 1,58 (m, 4H), 1,05 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(334)

8-(N-Butil-N-ciclopropilmetilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

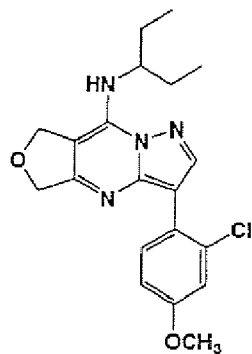


CCF: Rf 0,45 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,37 (s, 1H), 7,74 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,05 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,91 (dd, J = 9,0, 2,7 Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 4,96 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,66 - 3,52 (m, 4H), 1,66 - 1,48 (m, 2H), 1,44 - 1,22 (m, 2H), 1,04 (m, 1H), 0,91 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,60 - 0,44 (m, 2H), 0,22 - 0,08 (m, 2H).

Ejemplo 2(335)

8-(3-Pentilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



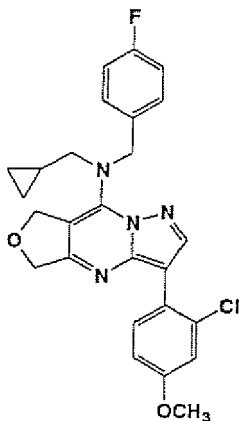
15

CCF: Rf 0,57 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,32 (s, 1H), 7,74 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,04 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,91 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 6,42 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 5,31 (s, 2H), 4,97 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,28 (m, 1H), 1,84 - 1,54 (m, 4H), 1,01 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(336)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

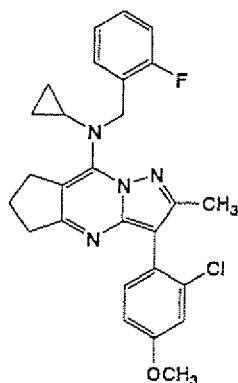


5 CCF: Rf 0,41 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,41 (s, 1H), 7,74 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,38 - 7,24 (m, 2H), 7,12 - 6,96 (m, 3H), 6,92 (dd, J = 9,0, 2,7 Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 4,95 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,39 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 1,02 (m, 1H), 0,60 - 0,44 (m, 2H), 0,16 - 0,02 (m, 2H).

Ejemplo 2(337)

10 8-(N-Ciclopropil-N-(2-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

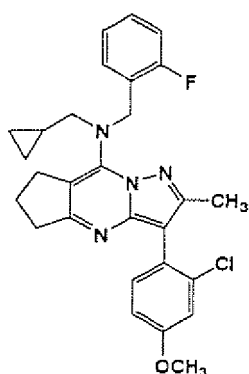


CCF: Rf 0,41 (tolueno:acetato de etilo = 10:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,23 (m, 1H), 7,13 - 6,97 (m, 3H), 7,06 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,15 (sa, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,98 - 2,86 (m, 4H), 2,83 (m, 1H), 2,40 (s, 3H), 2,02 (m, 2H), 0,84 - 0,72 (m, 4H).

Ejemplo 2(338)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-(2-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

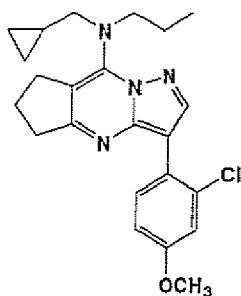


CCF: Rf 0,49 (tolueno:acetato de etilo = 10:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,35 - 7,16 (m, 2H), 7,06 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,08 - 6,97 (m, 2H), 6,89 (dd, J = 8,7 Hz, 2,4 Hz, 1H), 5,02 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,41 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 2,98 - 2,84 (m, 4H), 2,40 (s, 3H), 2,07 (m, 2H), 1,05 (m, 1H), 0,48 (m, 2H), 0,10 (m, 2H).

Ejemplo 2(339)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-propilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

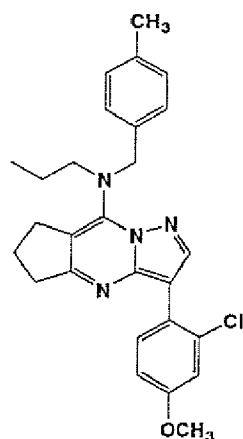


CCF: Rf 0,76 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,32 (s, 1H), 7,78 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,03 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,91 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,68 - 3,58 (m, 2H), 3,52 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 3,06 - 2,90 (m, 4H), 2,26 - 2,08 (m, 2H), 1,66 - 1,46 (m, 2H), 1,01 (m, 1H), 0,90 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,52 - 0,42 (m, 2H), 0,16 - 0,04 (m, 2H).

Ejemplo 2(340)

8-(N-Propil-N-(4-metilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



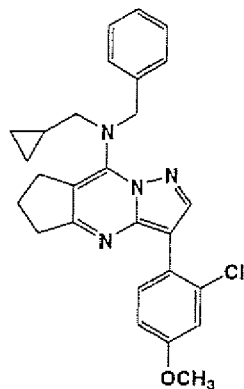
15

CCF: Rf 0,61 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,37 (s, 1H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,18 - 7,07 (m, 4H), 7,04 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,92 (dd, J = 9,0, 2,7 Hz, 1H), 4,79 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,45 - 3,36 (m, 2H), 2,96 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,89 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,20 - 2,04 (m, 2H), 1,66 - 1,46 (m, 2H), 0,87 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(341)

5 8-(N-Bencil-N-ciclopropilmetilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

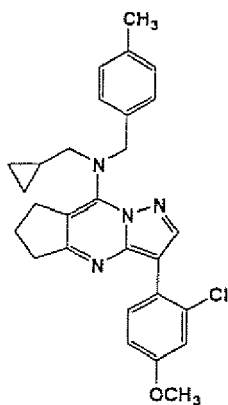


CCF: Rf 0,67 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,38 (s, 1H), 7,79 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,38 - 7,18 (m, 5H), 7,05 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,92 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 4,92 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,40 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 3,01 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,97 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,22 - 2,06 (m, 2H), 1,02 (m, 1H), 0,54 - 0,42 (m, 2H), 0,12 - 0,02 (m, 2H).

Ejemplo 2(342)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-(4-metilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

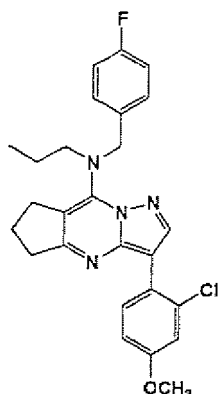


15 CCF: Rf 0,71 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,37 (s, 1H), 7,79 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,20 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,11 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,05 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,92 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,88 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,39 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 3,01 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,97 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,22 - 2,06 (m, 2H), 1,02 (m, 1H), 0,54 - 0,42 (m, 2H), 0,14 - 0,02 (m, 2H).

20 Ejemplo 2(343)

8-(N-Propil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

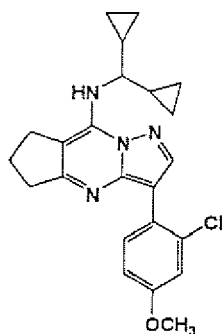


CCF: Rf 0,54 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,37 (s, 1H), 7,79 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,30 - 7,22 (m, 2H), 7,05 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,04 - 6,96 (m, 2H), 6,92 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 4,78 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,46 - 3,34 (m, 2H), 2,97 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,89 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,20 - 2,04 (m, 2H), 1,66-1,48 (m, 2H), 0,87 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(344)

8-Diciclopropilmetilamino-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

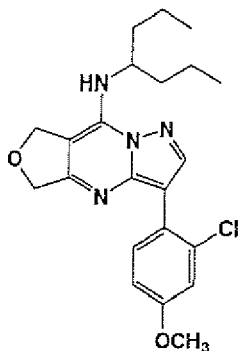


CCF: Rf 0,58 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,28 (s, 1H), 7,78 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,03 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,91 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 6,42 (d, J = 9,6 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,44 (m, 1H), 3,10 - 3,00 (m, 2H), 2,98 - 2,88 (m, 2H), 2,22 - 2,06 (m, 2H), 1,20 - 1,06 (m, 2H), 0,68 - 0,48 (m, 4H), 0,48 - 0,34 (m, 4H).

Ejemplo 2(345)

8-(4-Heptilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



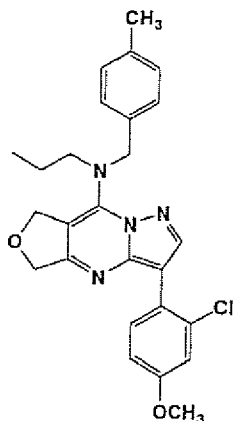
15

CCF: Rf 0,54 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,32 (s, 1H), 7,74 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,04 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,92 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 6,42 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 5,32 (s, 2H), 4,97 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,42 (m, 1H), 1,78 - 1,26 (m, 8H), 0,95 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(346)

5 8-(N-Propil-N-(4-metilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

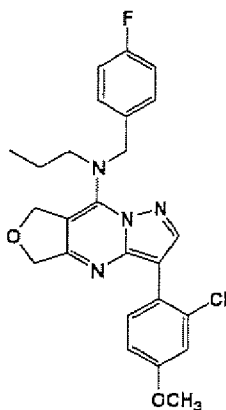


CCF: Rf 0,53 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,41 (s, 1H), 7,75 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,16 - 7,08 (m, 4H), 7,06 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,92 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 5,14 (s, 2H), 4,95 (s, 2H), 4,88 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,42 - 3,28 (m, 2H), 2,33 (s, 3H), 1,72 - 1,50 (m, 2H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 2(347)

8-(N-Propil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

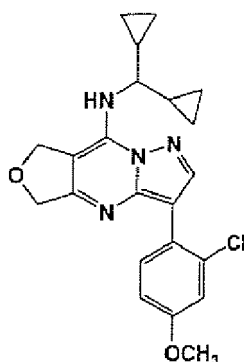


CCF: Rf 0,50 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,41 (s, 1H), 7,74 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,32 - 7,18 (m, 2H), 7,08 - 6,97 (m, 3H), 6,93 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,15 (s, 2H), 4,95 (s, 2H), 4,88 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,40 - 3,26 (m, 2H), 1,70 - 1,48 (m, 2H), 0,89 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(348)

8-Diciclopropilmetilamino-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

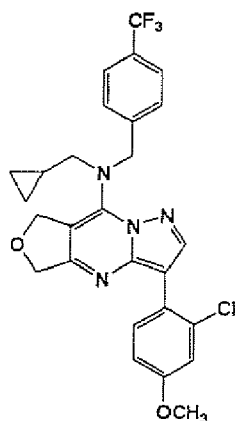


CCF: Rf 0,47 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,33 (s, 1H), 7,73 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,04 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,91 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 6,55 (d, J = 9,6 Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 4,94 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 2,92 (m, 1H), 1,22 - 1,06 (m, 2H), 0,70 - 0,48 (m, 4H), 0,48 - 0,30 (m, 4H).

Ejemplo 2(349)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-(4-trifluorometilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

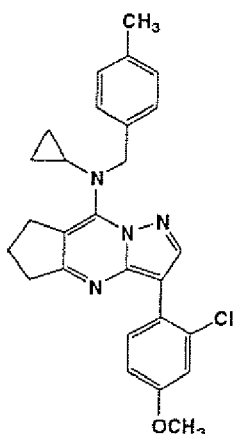


10 CCF: Rf 0,42 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,41 (s, 1H), 7,73 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,60 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,06 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,93 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,27 (s, 2H), 5,02 (s, 2H), 4,96 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,40 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 1,02 (m, 1H), 0,60 - 0,46 (m, 2H), 0,16 - 0,04 (m, 2H).

Ejemplo 2(350)

15 8-(N-Ciclopropil-N-(4-metilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

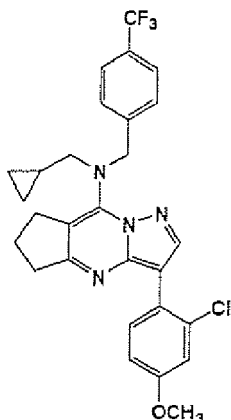


CCF: Rf 0,60 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,36 (s, 1H), 7,80 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,12 - 6,99 (m, 5H), 6,93 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,96 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 2,97 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,94 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,78 (m, 1H), 2,32 (s, 3H), 2,16 - 2,00 (m, 2H), 0,82 - 0,68 (m, 4H).

Ejemplo 2(351)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-(4-trifluorometilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

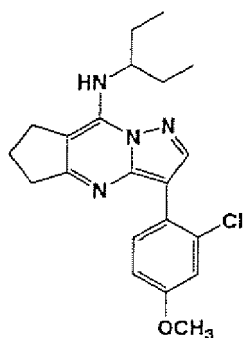


10 CCF: Rf 0,55 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,37 (s, 1H), 7,78 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,58 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,05 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,92 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 4,97 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,39 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 3,04 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,99 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,18 (m, 2H), 1,01 (m, 1H), 0,56-0,42 (m, 2H), 0,14-0,02 (m, 2H).

Ejemplo 2(352)

15 8-(3-Pentilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

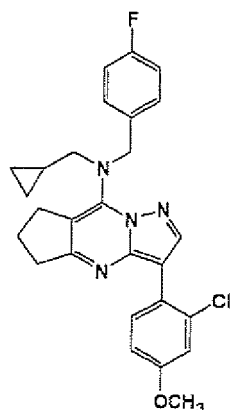


CCF: Rf 0,53 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,27 (s, 1H), 7,79 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,03 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,91 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 6,30 (d, J = 10,2 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,82 (m, 1H), 3,11 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,96 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,24-2,08 (m, 2H), 1,84-1,52 (m, 4H), 1,01 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 2(353)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

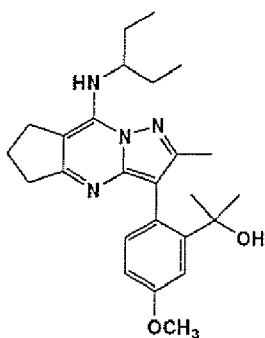


10 CCF: Rf 0,46 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,37 (s, 1H), 7,78 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,38-7,24 (m, 2H), 7,05 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,05-6,93 (m, 2H), 6,92 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 4,87 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,37 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 3,01 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,97 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,22-2,06 (m, 2H), 1,00 (m, 1H), 0,54-0,40 (m, 2H), 0,12-0,02 (m, 2H).

Ejemplo 2(354)

15 8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-(1-metil-1-hidroxi-etil)-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



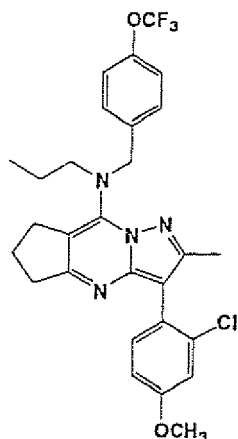
CCF: Rf 0,50 (hexano:acetato de etilo = 1:2);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,23 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,03 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 6,26 (d, J = 10,2 Hz, 1H), 5,00-4,85 (m, 1H), 3,85-3,75 (m) y 3,84 (s) 4H total, 3,06 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,85 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,11 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,80-1,50 (m) y 1,64 (s) 7H total, 1,30 (s, 3H), 1,03 (t, J = 7,2 Hz) y 1,00 (t, J = 7,2 Hz) 6H total.

5

Ejemplo 2(355)

8-(N-Propil-N-(4-trifluorometiloxifenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

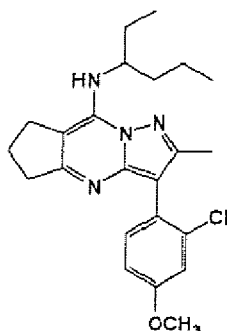


10 CCF: Rf 0,52 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,32 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,15 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,07 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,84 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,44-3,32 (m, 2H), 2,91 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,84 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,39 (s, 3H), 2,06-1,98 (m, 2H), 1,66-1,48 (m, 2H), 0,88 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(356)

15 8-(3-Hexilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



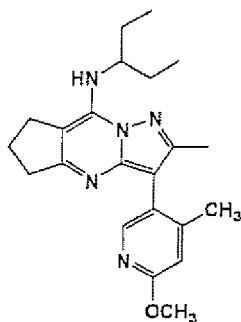
CCF: Rf 0,44 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,30 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,05 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,88 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 6,22 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 3,84 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,08 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,90 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,20-2,04 (m, 2H), 1,80-1,32 (m, 6H), 1,00 (t, J = 6,9 Hz, 3H), 0,95 (t, J = 6,9 Hz, 3H).

20

Ejemplo 2(357)

8-(3-Pentilamino)-2-metil-3-(2-metoxi-4-metilpiridin-5-il)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



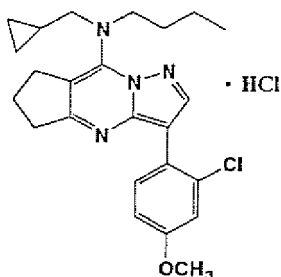
CCF: Rf 0,23 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,00 (s, 1H), 6,69 (s, 1H), 6,23 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,82 (m, 1H), 3,08 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,89 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,20-2,06 (m, 2H), 2,18 (s, 3H), 1,82-1,54 (m, 4H), 1,02 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

5

Ejemplo 2(358)

Clorhidrato de 8-(N-butil-N-ciclopropilmetilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

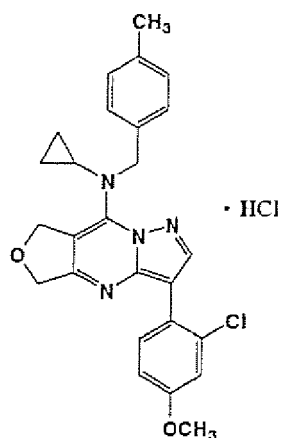


10 CCF: Rf 0,61 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,27 (s, 1H), 7,71 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,04 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,94 (m, 1H), 3,90-3,70 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,64 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 3,30-3,12 (m, 2H), 3,12-2,96 (m, 2H), 2,32-2,12 (m, 2H), 1,68-1,50 (m, 2H), 1,46-1,20 (m, 2H), 1,06 (m, 1H), 0,91 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,62-0,46 (m, 2H), 0,24-0,10 (m, 2H).

Ejemplo 2(359)

15 Clorhidrato de 8-(N-ciclopropil-N-(4-metilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

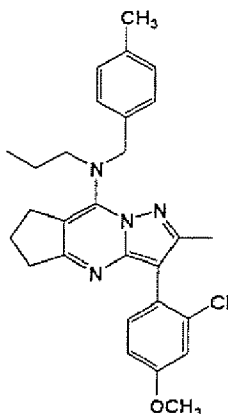


CCF: Rf 0,49 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,42 (s, 1H), 7,76 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,09 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,06 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,99 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 6,93 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 5,19 (s, 2H), 5,11 (s, 2H), 4,96 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,58 (m, 1H), 2,32 (s, 3H), 0,86-0,76 (m, 4H).

Ejemplo 2(360)

- 5 8-(N-Propil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

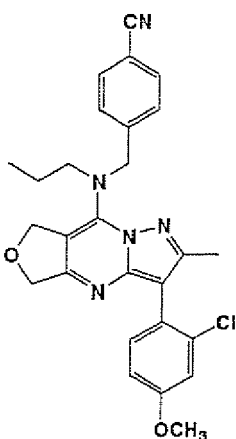


CCF: Rf 0,74 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,32 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,16-7,06 (m, 4H), 7,07 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,7, 3,0 Hz, 1H), 4,80 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,42-3,30 (m, 2H), 2,89 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,82 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,39 (s, 3H), 2,33 (s, 3H), 2,04-1,98 (m, 2H), 1,70-1,48 (m, 2H), 0,87 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(361)

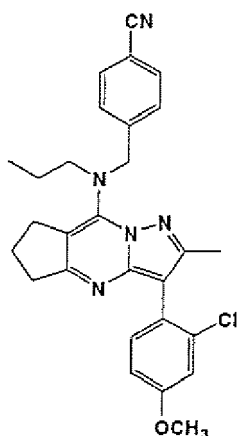
- 8-(N-Propil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



- 15 CCF: Rf 0,38 (hexano:acetato de etilo = 2:1);
 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,64 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,30 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,14 (s, 2H), 5,01 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,36-3,22 (m, 2H), 2,38 (s, 3H), 1,70-1,50 (m, 2H), 0,89 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

20 Ejemplo 2(362)

- 8-(N-Propil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

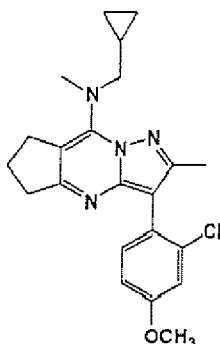


CCF: Rf 0,46 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,61 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,31 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 4,90 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,44-3,32 (m, 2H), 2,92 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,88 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,38 (s, 3H), 2,20-2,02 (m, 2H), 1,66-1,46 (m, 2H), 0,88 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 2(363)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

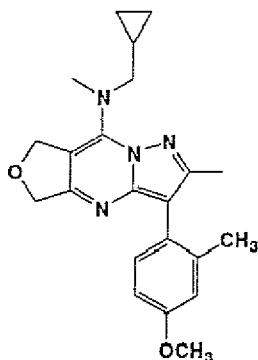


10 CCF: Rf 0,30 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,30 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,05 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,88 (dd, J = 8,4, 3,0 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,61 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 3,30 (s, 3H), 3,12 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,92 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,20-2,06 (m, 2H), 1,09 (m, 1H), 0,60-0,46 (m, 2H), 0,24-0,12 (m, 2H).

Ejemplo 2(364)

15 8-(N-Ciclopropilmetil-N-metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

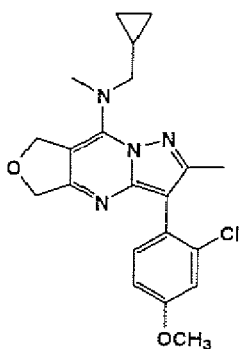


CCF: Rf 0,22 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,4, 3,0 Hz, 1H), 5,35 (s, 2H), 4,89 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,72 (dd, J=6,9, 1,5 Hz, 2H), 3,27 (s, 3H), 2,34 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,10 (m, 1H), 0,60-0,48 (m, 2H), 0,24-0,14 (m, 2H).

5 Ejemplo 2(365)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

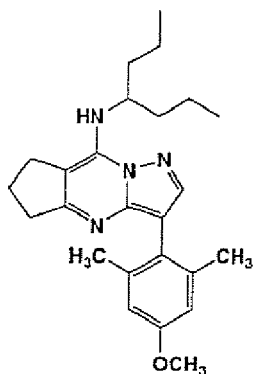


CCF: Rf 0,18 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,88 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 5,35 (s, 2H), 4,91 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,71 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 3,27 (s, 3H), 2,38 (s, 3H), 1,10 (m, 1H), 0,62-0,50 (m, 2H), 0,26-0,16 (m, 2H).

Ejemplo 2(366)

8-(4-Heptilamino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

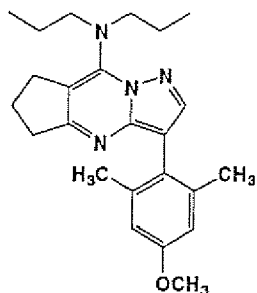


15 CCF: Rf 0,55 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,80 (s, 1H), 6,83 (s, 2H), 6,27 (d, J = 11,1 Hz, 1H), 3,98 (m, 1H), 3,80 (s, 3H), 3,11 (t; J = 7,5 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,22-2,04 (m, 2H), 2,13 (s, 6H), 1,76-1,30 (m, 8H), 0,96 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 2(367)

8-Dipropilamino-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

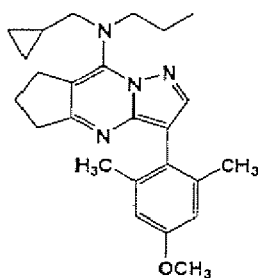


CCF: Rf 0,54 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,86 (s, 1H), 6,69 (s, 2H), 3,80 (s, 3H), 3,64-3,46 (m, 4H), 2,98 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,92 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,22-2,00 (m, 2H), 2,12 (s, 6H), 1,68-1,48 (m, 4H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

5 Ejemplo 2(368)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-propilamino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

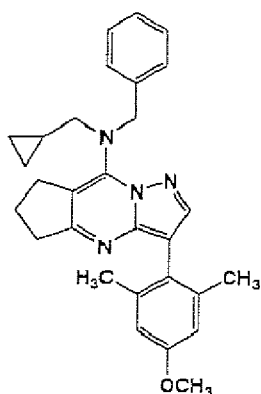


CCF: Rf 0,51 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,86 (s, 1H), 6,69 (s, 2H), 3,80 (s, 3H), 3,68-3,58 (m, 2H), 3,54 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 3,03 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,93 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,04-2,00 (m, 2H), 2,12 (s, 6H), 1,68-1,50 (m, 2H), 1,02 (m, 1H), 0,91 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 0,54-0,40 (m, 2H), 0,18-0,04 (m, 2H).

Ejemplo 2(369)

8-(N-Bencil-N-ciclopropilmetilamino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

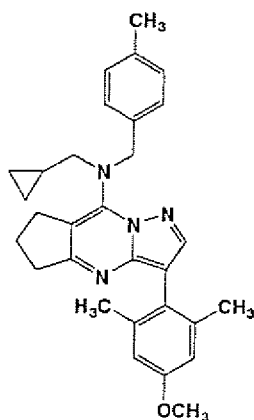


15 CCF: Rf 0,49 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,93 (s, 1H), 7,42-7,08 (m, 5H), 6,70 (s, 2H), 4,94 (s, 2H), 3,81 (s, 3H), 3,41 (d, J=6,6 Hz, 2H), 3,02 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,92 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,22-2,04 (m, 2H), 2,13 (s, 6H), 1,03 (m, 1H), 0,54-0,38 (m, 2H), 0,12-0,01 (m, 2H).

Ejemplo 2(370)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-(4-metilfenilmetil)amino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

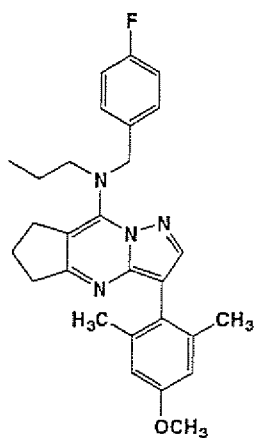


CCF: Rf 0,53 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,92 (s, 1H), 7,21 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,11 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 6,70 (s, 2H), 4,89 (s, 2H), 3,81 (s, 3H), 3,40 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 3,02 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,92 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,22-2,04 (m, 2H), 2,13 (s, 6H), 1,03 (m, 1H), 0,54-0,40 (m, 2H), 0,10-0,01 (m, 2H).

Ejemplo 2(371)

- 10 8-(N-Propil-N-(4-fluorofenilmetil)amino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

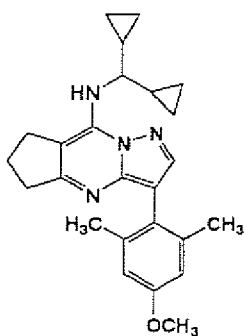


CCF: Rf 0,46 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,92 (s, 1H), 7,36-7,18 (m, 2H), 7,06-6,88 (m, 2H), 6,70 (s, 2H), 4,80 (s, 2H), 3,81 (s, 3H), 3,46-3,32 (m, 2H), 3,00-2,80 (m, 4H), 2,22-2,00 (m, 2H), 2,13 (s, 6H), 1,70-1,48 (m, 2H), 0,88 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

- 15 Ejemplo 2(372)

8-Diciclopropilmetilamino-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

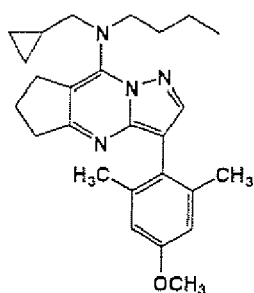


CCF: Rf 0,45 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,81 (s, 1H), 6,68 (s, 2H), 6,40 (d, J = 9,9 Hz, 1H), 3,80 (s, 3H), 3,46 (m, 1H), 3,05 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,89 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,22-2,02 (m, 2H), 2,13 (s, 6H), 1,20-1,06 (m, 2H), 0,68-0,36 (m, 8H).

5 Ejemplo 2(373)

8-(N-Butil-N-ciclopropilmetilamino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

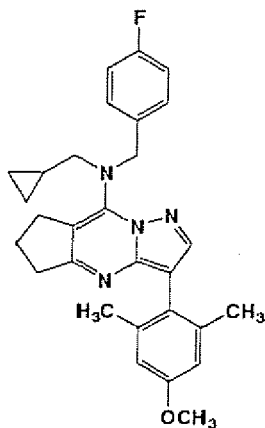


CCF: Rf 0,61 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,87 (s, 1H), 6,69 (s, 2H), 3,80 (s, 3H), 3,76-3,60 (m, 2H), 3,53 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 3,03 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,93 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,22-2,00 (m, 2H), 2,12 (s, 6H), 1,64-1,46 (m, 2H), 1,42-1,22 (m, 2H), 1,02 (m, 1H), 0,90 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,56-0,38 (m, 2H), 0,18-0,02 (m, 2H).

Ejemplo 2(374)

8-(N-Ciclopropilmetil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



15

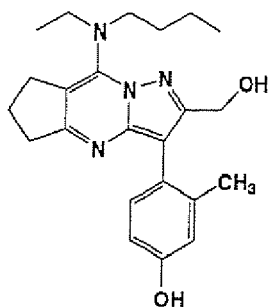
CCF: Rf 0,51 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,92 (s, 1H), 7,38-7,26 (m, 2H), 7,06-6,94 (m, 2H), 6,71 (s, 2H), 4,89 (s, 2H), 3,81 (s, 3H),

3,39 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 3,02 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,93 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,22-2,00 (m, 2H), 2,13 (s, 6H), 1,01 (m, 1H), 0,54-0,40 (m, 2H), 0,10-0,01 (m, 2H).

Ejemplo 3

8-(N-Etil-N-n-butilamino)-2-hidroximetil-3-(2-metil-4-hidroxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



5

A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo 2(1) (506 mg) en cloruro de metileno (14 ml) que se enfrió hasta -78°C , se le añadió tribromuro de boro 1 M en cloruro de metileno (12 ml). Se agitó la mezcla durante 30 minutos a -78°C y durante 5 horas a -30°C . Se vertió la mezcla de reacción en una disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se extrajo la disolución resultante con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 1:1 \rightarrow 2:3) para dar el compuesto del título (303 mg) que tiene los siguientes datos físicos

10

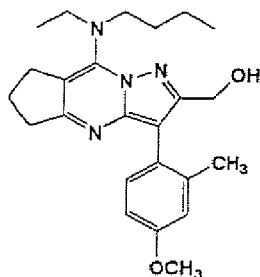
CCF: Rf 0,14 (n-hexano:acetato de etilo = 1:1);

15

RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 9,41 (sa, 1 H), 6,90 (d, J = 9,0 Hz, 1 H), 6,42 (m, 2 H), 4,71 (sa, 2 H), 3,70 (q, J = 7,5 Hz, 2 H), 3,64 (t, J = 7,5 Hz, 2 H), 3,01 (t, J = 7,8 Hz, 4 H), 2,39 (sa, 1 H), 2,18 (m, 2 H), 2,01 (s, 3 H), 1,58 (m, 2 H), 1,35 (m, 2 H), 1,21 (t, J = 7,5 Hz, 3 H), 0,91 (t, J = 7,5 Hz, 3 H).

Ejemplo 4

8-(N-Etil-N-n-butilamino)-2-hidroximetil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo 3 (985 mg) en cloruro de metileno (10 ml) que se enfrió hasta 0°C , se le añadió hidruro de sodio (95 mg; dispersión al 63,1% en aceite). Se agitó la mezcla durante 30 minutos. Se añadió yoduro de metilo (0,18 ml) a la mezcla de reacción y se agitó la mezcla resultante durante 2 horas a 0°C . Se añadió una disolución acuosa saturada de cloruro de amonio a la mezcla de reacción y se extrajo la disolución resultante con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con una disolución acuosa 1 M de hidróxido de sodio y una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, sucesivamente, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (tolueno:acetato de etilo = 5:1 \rightarrow 4:1 \rightarrow 7:2) para dar el compuesto del título (947 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

25

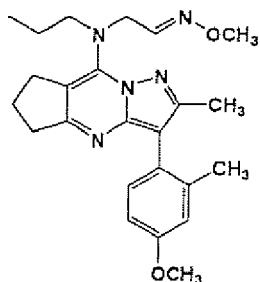
CCF: Rf 0,35 (n-hexano:acetato de etilo = 1:1);

30

RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,19 (d, J = 8,4 Hz, 1 H), 6,85 (d, J = 2,7 Hz, 1 H), 6,78 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1 H), 4,73 (d, J = 5,7 Hz, 2 H), 3,82 (s, 3 H), 3,65 (q, J = 7,2 Hz, 2 H), 3,59 (t, J = 7,2 Hz, 2 H), 2,98 (t, J = 6,9 Hz, 2 H), 2,92 (t, J = 7,8 Hz, 2 H), 2,35 (m, 1 H), 2,19 (s, 3 H), 2,15 (m, 2 H), 1,55 (m, 2 H), 1,35 (m, 2H), 1,18 (t, J = 7,2 Hz, 3 H), 0,90 (t, J = 7,2 Hz, 3 H).

Ejemplo 5

8-(N-Propil-N-(2-metoxiiminoetil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



- 5 A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo 2(2) (186 mg) en dimetilsulfóxido (5 ml), se le añadieron trietilamina (0,39 ml) y complejo trióxido de azufre-piridina (225 mg). Se agitó la mezcla durante 2 horas a temperatura ambiente. Se vertió la mezcla de reacción en agua y se extrajo con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró. A una disolución del residuo en piridina (5 ml) se le añadió clorhidrato de o-metilhidroxilamina (28 mg). Se agitó la mezcla durante 15 horas a temperatura ambiente. Se concentró la mezcla de reacción y se diluyó con acetato de etilo. Se lavó la disolución diluida con una disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, sucesivamente, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 4:1 → 3:1) para dar el compuesto del título (16 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,78 (n-hexano:acetato de etilo = 1:1);

- 15 RMN (300 MHz, CDCl₃):

isómero mayoritario

δ 7,57 (t, J = 5,7 Hz, 1H), 7,15 (d, J=8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 4,35 (d, J = 6,0 Hz, 2H), 3,86 (s, 3H), 3,82 (s, 3H), 3,49 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,99 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,14 (m, 2H), 1,58 (m, 2H), 0,90 (t, J = 7,2 Hz, 3H)

- 20 isómero minoritario

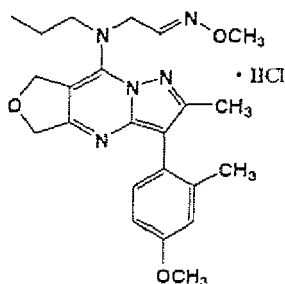
δ 7,15 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,95 (t, J = 3,9 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 4,47 (d, J=4,2 Hz, 2H), 3,90 (s, 3H), 3,82 (s, 3H), 3,54 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,99 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,91 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,14 (m, 2H), 1,58 (m, 2H), 0,92 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 5(1)-5(2)

- 25 Se obtuvieron los siguientes compuestos mediante el mismo procedimiento que una reacción del ejemplo 5, usando el compuesto preparado en el ejemplo 2(26), o el compuesto preparado en el ejemplo 4 y clorhidrato de hidroxilamina en lugar de clorhidrato de o-metilhidroxilamina.

Ejemplo 5(1)

- 30 Clorhidrato de 8-(N-propil-N-(2-metoxiiminoetil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



CCF: Rf 0,22 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, 0,5 ml de piridina-d₅ + 0,1 ml de CDCl₃):

isómero mayoritario

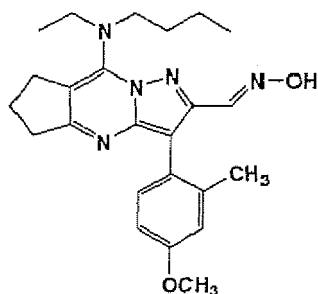
5 δ 7,87 (t, J = 5,4 Hz, 1H), 7,38 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,03 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,95 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,27 (s, 2H), 4,97 (s, 2H), 4,59 (d, J = 5,4 Hz, 2H), 3,86 (s, 3H), 3,74 (s, 3H), 3,38 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,44 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 1,65-1,50 (m, 2H), 0,81 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

isómero minoritario

δ 7,38 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,31 (t, J = 4,2 Hz, 1H), 7,03 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,95 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 4,95 (s, 2H), 4,71 (d, J = 4,2 Hz, 2H), 3,92 (s, 3H), 3,74 (s, 3H), 3,43 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,43 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 1,65-1,50 (m, 2H), 0,84 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

10 Ejemplo 5(2)

8-(N-Etil-N-n-butilamino)-2-hidroxiiminometil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

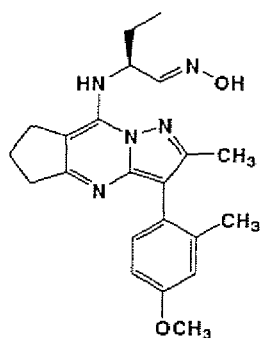


CCF: Rf 0,19 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,15 (s, 1H), 7,96 (sa, 1H), 7,18 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,67 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 3,61 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,99 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,92 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,18 (s, 3H), 2,16 (m, 2H), 1,55 (m, 2H), 1,33 (m, 2H), 1,18 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 6

20 8-[(2S)-1-Hidroxiiminobutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo 2(15) (290 mg) en ácido acético (4 ml), se le añadió ácido clorhídrico 1 M (1,4 ml) y se agitó la mezcla durante 1 hora a 80°C. Se vertió la mezcla de reacción en una disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio (100 ml) en un baño de hielo, se extrajo la mezcla resultante con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró. Se añadió clorhidrato de hidroxilamina (52 mg) a una disolución del residuo en piridina (3 ml) y se agitó la mezcla durante 15 horas a temperatura ambiente. Se concentró la mezcla de reacción y se diluyó con acetato de etilo. Se lavó la disolución diluida con una disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, sucesivamente, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 1:1) para dar el compuesto del título (143 mg) que tiene los siguientes datos físicos como mezclas isoméricas.

CCF: Rf 0,32 (n-hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃):

isómero mayoritario

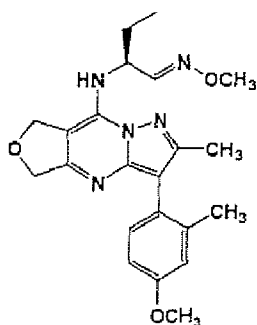
5 δ 7,80 (sa, 1 H), 7,47 (d, J = 6,0 Hz, 1 H), 7,14 (d, J = 8,4 Hz, 1 H), 6,84 (d, J = 2,7 Hz, 1 H), 6,78 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1 H), 6,53 (d, J = 9,6 Hz, 1 H), 4,60 (m, 1 H), 3,82 (s, 3 H), 3,25-3,00 (m, 2 H), 2,88 (t, J = 7,5 Hz, 2 H), 2,31 (s, 3 H), 2,17 (s, 3 H), 2,10 (m, 2 H), 1,90 (m, 2 H), 1,11 (t, J = 7,2 Hz, 3 H).

isómero minoritario

δ 8,52 (sa, 1 H), 7,14 (d, J = 8,4 Hz, 1 H), 6,84 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,80 (m, 1 H), 6,78 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1 H), 6,44 (d, J = 9,6 Hz, 1 H), 5,23 (m, 1 H), 3,82 (s, 3 H), 3,25-3,00 (m, 2 H), 2,88 (t, J = 7,5 Hz, 2 H), 2,31 (s, 3 H), 2,17 (s, 3 H), 2,10 (m, 2 H), 1,90 (m, 2 H), 1,11 (t, J = 7,2 Hz, 3 H).

10 Ejemplo 6(1)

8-[(2S)-1-Metoxiiminobutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



Se obtuvo el compuesto del título (128 mg), que tiene los siguientes datos físicos, mediante el mismo procedimiento que una reacción del ejemplo 5, usando el compuesto preparado en el ejemplo 2(14) (365 mg) y clorhidrato de o-metilhidroxilamina en lugar de clorhidrato de hidroxilamina.

15

CCF: Rf 0,20 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃):

isómero mayoritario

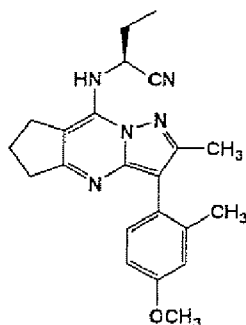
20 δ 7,36 (d, J = 6,0 Hz, 1H), 7,14 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 6,60 (d, J = 9,9 Hz, 1H), 5,47 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 5,31 (d, J = 10,5 Hz, 1H), 4,89 (s, 2H), 4,07 (m, 1H), 3,86 (s, 3H), 3,82 (s, 3H), 2,33 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,96-1,87 (m, 2H), 1,10 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

isómero minoritario

25 δ 7,14 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 6,76 (m, 1H), 6,53 (d, J = 9,9 Hz, 1H), 5,30 (m, 2H), 4,89 (s, 2H), 4,72 (m, 1H), 3,96 (s, 3H), 3,82 (s, 3H), 2,33 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,96-1,87 (m, 2H), 1,10 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 7

8-[(1S)-1-Cianopropilamino]-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



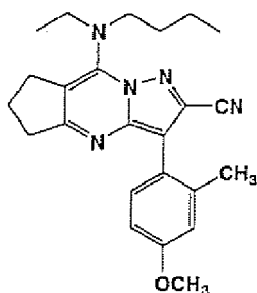
- 5 A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo 6 (137 mg) en cloruro de metileno (1 ml) que se enfrió hasta -78°C , se le añadieron trietilamina (0,32 ml) y anhídrido trifluorometanosulfónico (0,13 ml). Se agitó la mezcla durante 2 horas a temperatura ambiente. Se añadió una disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio a la mezcla de reacción y se extrajo la disolución resultante con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 3:1 \rightarrow 2:1) para dar el compuesto del título (100 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,27 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 10 RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,15 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 6,50 (d, J = 9,6 Hz, 1H), 4,78 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,33 (ddd, J = 14,4, 7,5, 6,3 Hz, 1H), 3,11 (ddd, J = 14,4, 8,1, 6,3 Hz, 1H), 2,93 (m, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,25-2,10 (m, 7H), 1,29 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 7(1)

8-(N-Etil-N-n-butilamino)-2-ciano-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



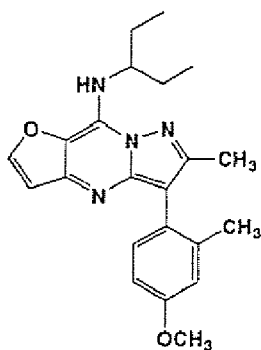
- 15 Se obtuvo el compuesto del título (195 mg), que tiene los siguientes datos físicos, mediante el mismo procedimiento que una reacción del ejemplo 7, usando el compuesto preparado en el ejemplo 5(2) (211 mg).

CCF: Rf 0,34 (n-hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 20 RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,28 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,65 (q, J = 6,9 Hz, 2H), 3,58 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,00 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,96 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,18 (m, 2H), 1,57 (m, 2H), 1,33 (m, 2H), 1,20 (t, J = 6,9 Hz, 3H), 0,91 (t, J = 7,2 Hz, 3H).

Ejemplo 8

9-(3-Pentilamino)-6-metil-5-(2-metil-4-metoxifenil)-furo[3,2-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



- 25 A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo 2(6) (215 mg) en difenil éter (3 ml), se le añadió paladio sobre carbono al 10% (150 mg) y se agitó la mezcla durante 4 horas a 250°C . Tras enfriar la mezcla de reacción hasta temperatura ambiente, se diluyó con metanol (10 ml). Se filtró la disolución diluida a través de Celite (marca registrada). Se concentró el filtrado y se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (n-hexano:acetona = 9:1) para dar el compuesto del título (150 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

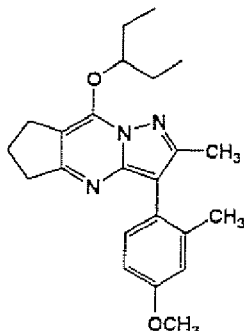
CCF: Rf 0,42 (n-hexano:acetato de etilo = 2:1);

- 30 RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,76 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,20 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1H), 6,78 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,28 (da, J = 10,2 Hz, 1H), 4,30 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,37 (s, 3H), 2,21 (s,

3H), 1,92-1,65 (m, 4H), 1,05 (m, 6H).

Ejemplo 9

8-(3-Pentiloxi)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



- 5 Se añadió gota a gota 3-pentanol (202 mg) a una disolución de hidruro de sodio (92,0 mg; al 60% en aceite) en tolueno y se agitó la mezcla durante 2 minutos a 80°C. Se añadió el compuesto preparado en el ejemplo de referencia 7 (250 mg) a esta mezcla y se agitó la mezcla resultante durante 5 horas. Se añadieron agua y acetato de etilo a la mezcla de reacción y se agitó. Se separó la fase orgánica. Mientras tanto, se extrajo la fase acuosa con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica combinada con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 5:1) para dar el compuesto del título (128 mg) que tiene los siguientes datos físicos.
- 10

CCF: Rf 0,58 (tolueno:acetona = 5:1);

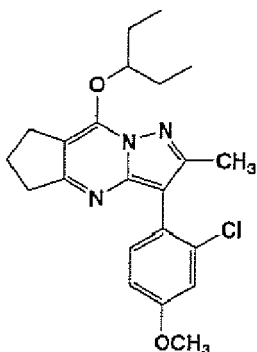
- 15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,16 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,05 (quint., J = 6,0 Hz, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,05 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,94 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,22 - 2,10 (m, 2H), 2,16 (s, 3H), 1,92 - 1,78 (m, 4H), 1,05 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 9(1) - 9(5)

Se obtuvieron los siguientes compuestos mediante el mismo procedimiento que una reacción del ejemplo 9, usando un compuesto correspondiente.

- 20 Ejemplo 9(1)

8-(3-Pentiloxi)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

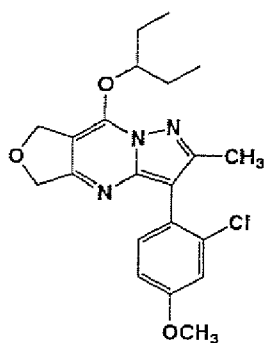


CCF: Rf 0,50 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 25 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,06 (quint., J = 6,0 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,05 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,95 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,38 (s, 3H), 2,16 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 1,94 - 1,74 (m, 4H), 1,04 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 9(2)

8-(3-Pentiloxi)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

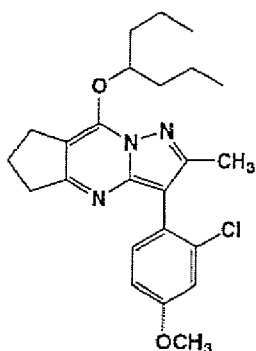


CCF: Rf 0,25 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,28 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,90 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,29 (s, 2H), 4,93 (s, 2H), 4,56 (m, 1H), 3,84 (s, 3H), 2,41 (s, 3H), 1,99 - 1,80 (m, 4H), 1,05 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

5 Ejemplo 9(3)

8-(4-Heptiloxi)-2-metil-3-(2-cloro-5-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

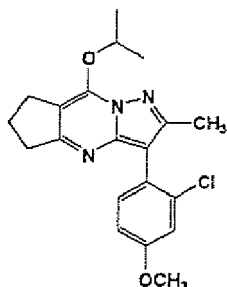


CCF: Rf 0,85 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,7, 2,7 Hz, 1H), 5,22 (quint., J = 6,0 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,05 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,95 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,37 (s, 3H), 2,16 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,90 - 1,66 (m, 4H), 1,58 - 1,42 (m, 4H), 0,95 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 9(4)

8-Isopropiloxi-2-metil-3-(2-cloro-5-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

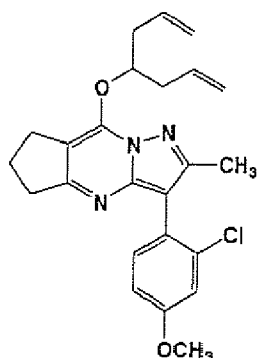


15 CCF: Rf 0,36 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,43 (sept., J = 6,3 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,06 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,96 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,38 (s, 3H), 2,16 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,51 (d, J = 6,3 Hz, 6H).

Ejemplo 9(5)

8-(1,6-Heptadien-4-il)oxi-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

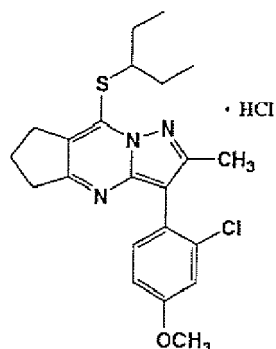


CCF: Rf 0,58 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 5,90 (ddt, J = 17,1, 10,2, 6,9 Hz, 2H), 5,34 (quint., J = 6,3 Hz, 1H), 5,17 (m, 2H), 5,11 (dd, m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,01 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,95 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,70 - 2,50 (m, 4H), 2,38 (s, 3H), 2,15 (quint., J = 7,5 Hz, 2H).

Ejemplo 10

Clorhidrato de 8-(3-pentiltio)-2-metil-3-(2-cloro-5-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



10 Se añadieron 3-acetiltiopentano (252 mg) y el compuesto preparado en el ejemplo de referencia 7 (300 mg) a una disolución de hidruro de sodio (68,9 mg; al 60% en aceite) en etanol (17 ml) a 0°C. Tras agitar la mezcla durante 1 hora, se concentró la mezcla de reacción. Se añadieron agua y acetato de etilo al residuo y se agitó. Se separó la fase orgánica. Mientras tanto, se extrajo la fase acuosa con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica combinada con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró.

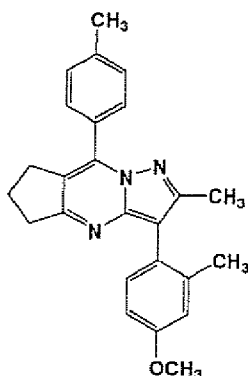
15 Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 5:1), se añadió ácido clorhídrico 4 N - acetato de etilo (0,2 ml) a la materia purificada y se agitó la disolución durante 10 minutos y se concentró para dar el compuesto del título (271,1 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,57 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,29 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 4,27 (quint., J = 6,3 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,05 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,00 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,40 (s, 3H), 2,17 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,72 - 1,64 (m, 4H), 1,02 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo 11

8-(4-Metilfenil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



- 5 Al compuesto preparado en el ejemplo de referencia 7 (300 mg) en dimetoxietano (3 ml), ácido 4-metilfenilborónico (131 mg), acetato de paladio (11 mg), trifenilfosfina (48 mg) y una disolución acuosa saturada de carbonato de sodio (2 ml), y se sometió la mezcla a reflujo con calentamiento durante 5 horas. Tras enfriar la mezcla de reacción, se diluyó con acetato de etilo. Se lavó la disolución diluida con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y agua, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 5:1) para dar el compuesto del título (222 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,41 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

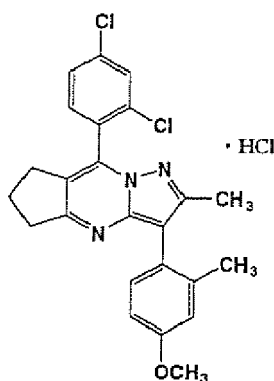
- 10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,72 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,36 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,19 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,01 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,94 (t, J = 6,6 Hz, 2H), 2,45 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 2,14 (m, 2H).

Ejemplo 11(1) - 11(5)

- 15 Se obtuvieron los siguientes compuestos mediante el mismo procedimiento que una reacción del ejemplo 11, usando un compuesto correspondiente.

Ejemplo 11(1)

Clorhidrato de 8-(2,4-diclorofenil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

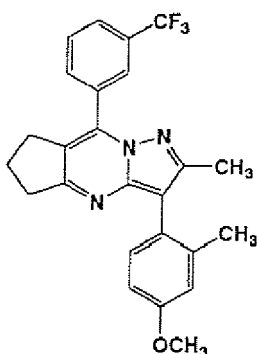


- 20 CCF: Rf CCF: Rf 0,38 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, DMSO-d₆): δ 7,91 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,70 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 1,8, 8,4 Hz, 1H), 7,11 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 3,77 (s, 3H), 2,94 (m, 2H), 2,68 (m, 2H), 2,14 (s, 3H), 2,12 (m, 2H), 2,09 (s, 3H).

Ejemplo 11(2)

- 25 8-(3-Trifluorometilfenil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

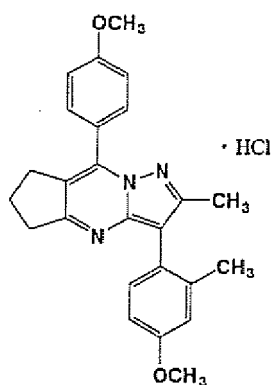


CCF: Rf 0,27 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,08 (sa, 1 H), 8,06 (da, J = 8,1 Hz, 1 H), 7,79 (da, J = 7,8 Hz, 1 H), 7,70 (dda, J = 8,1, 7,8 Hz, 1 H), 7,19 (d, J = 8,1 Hz, 1 H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1 H), 6,82 (dd, J = 8,1, 2,7 Hz, 1 H), 3,84 (s, 3 H), 3,04 (t, J = 7,5 Hz, 2 H), 2,94 (t, J = 7,5 Hz, 2 H), 2,31 (s, 3 H), 2,20 (s, 3 H), 2,18 (m, 2 H).

Ejemplo 11(3)

Clorhidrato de 8-(4-metoxifenil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

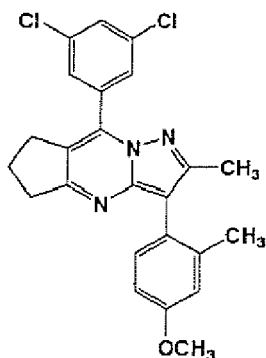


CCF: Rf 0,23 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,92 (d, J = 9,0 Hz, 2 H), 7,16 (d, J = 9,0 Hz, 2 H), 7,16 (d, J = 9,0 Hz, 1 H), 6,92 (d, J = 2,7 Hz, 1 H), 6,86 (dd, J = 9,0, 2,7 Hz, 1 H), 3,95 (s, 3 H), 3,85 (s, 3 H), 3,61 (t, J = 7,5 Hz, 2 H), 3,09 (t, J = 7,5 Hz, 2 H), 2,38 (s, 3 H), 2,30 (m, 2 H), 2,20 (s, 3 H).

Ejemplo 11(4)

8-(3,5-Diclorofenil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



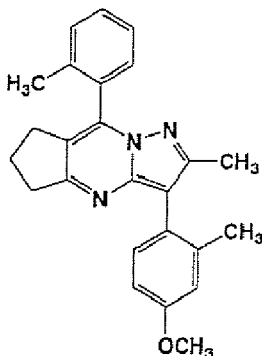
15

CCF: Rf 0,50 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,69 (d, J = 1,8 Hz, 2H), 7,52 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,17 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,02 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,93 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,17 (m, 2H).

Ejemplo 11(5)

5 8-(2-Metilfenil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

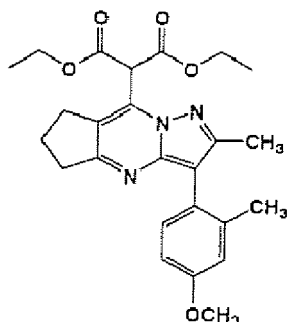


CCF: Rf 0,38 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,34 - 7,48 (m, 4H), 7,20 (m, 1H), 6,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 2,7, 8,1 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,04 (m, 2H), 2,81 (m, 1H), 2,62 (m, 1H), 2,27 (s, 3H), 2,20 (m, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,15 (m, 2H).

10 Ejemplo 12

8-Bis(etoxicarbonil)metil-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



15 Se añadió malonato de dietilo (880 mg) a una suspensión de hidruro de sodio (210 mg; al 63,1% en aceite) en tetrahidrofurano (10 ml) y se agitó la mezcla durante 30 minutos a temperatura ambiente. Se añadió el compuesto preparado en el ejemplo de referencia 7 (820 mg) a la mezcla de reacción y se sometió la mezcla resultante a reflujo con calentamiento durante 4 horas. Se añadió una disolución acuosa saturada de cloruro de amonio (10 ml) a la mezcla de reacción y se extrajo con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 8:1 \rightarrow 7:1) para dar el compuesto del título (1,10 g) que tiene los siguientes datos físicos.

20

CCF: Rf 0,48 (hexano:acetato de etilo = 2:1);

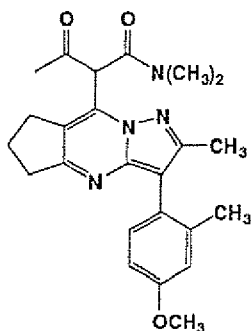
RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,15 (d, J = 8,1 Hz, 1 H), 6,87 (d, J = 3,0 Hz, 1 H), 6,80 (dd, J = 8,1, 3,0 Hz, 1 H), 6,02 (s, 1 H), 4,32 (m, 4 H), 3,82 (s, 3 H), 2,96 (t, J = 7,8 Hz, 2 H), 2,91 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,32 (s, 3 H), 2,21 - 2,09 (m, 2 H), 2,17 (s, 3 H), 1,32 (t, J = 7,2 Hz, 6 H).

25 Ejemplo 12(1) - 12(4)

Se obtuvieron los siguientes compuestos mediante el mismo procedimiento que una reacción del ejemplo 12, usando un compuesto correspondiente.

Ejemplo 12(1)

8-(1-Dimetilamino-1,3-dioxo-2-butil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

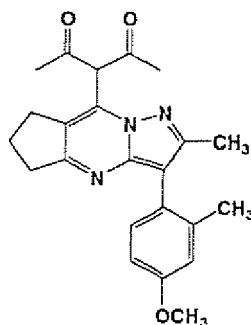


CCF: Rf 0,55 (acetato de etilo);

- 5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,14 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,83 - 6,74 (m, 1H), 6,29 (s, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,05 (s, 3H), 3,05 - 2,60 (m, 6H), 2,41 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,16 (sa, 6H).

Ejemplo 12(2)

8-(2,4-Dioxo-3-pentil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

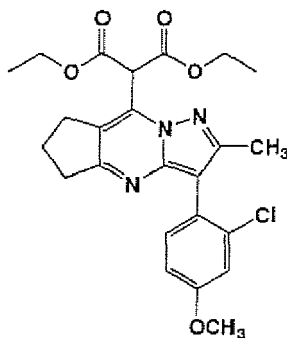


- 10 CCF: Rf 0,34 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 16,93 (s, 1H), 7,19 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 8,4, 3,0 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,04 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,81 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,20 (quint., J = 7,2 Hz, 2H), 2,18 (s, 3H), 1,95 (s, 6H).

Ejemplo 12(3)

- 15 8-Bis(etoxicarbonil)metil-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

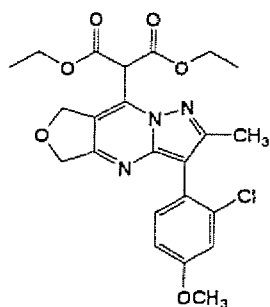


CCF: Rf 0,18 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,28 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 6,02 (s, 1H), 4,40 - 4,20 (m, 4H), 3,84 (s, 3H), 2,98 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,92 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,17 (quint., J = 7,5 Hz, 2H), 1,31 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 12(4)

8-bis(Etoxicarbonil)metil-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina

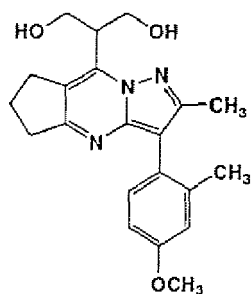


CCF: Rf 0,28 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

- 5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,28 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,08 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,91 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 6,12 (s, 1H), 5,11 (s, 2H), 4,95 (s, 2H), 4,41 - 4,20 (m, 4H), 3,84 (s, 3H), 2,39 (s, 3H), 1,33 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 13

8-(1,3-Hidroxi-2-propil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



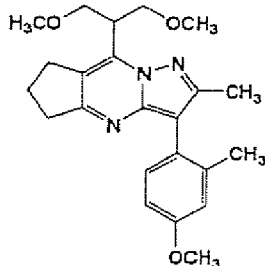
- 10 Bajo una atmósfera de argón, se añadió gota a gota hidruro de diisopropilaluminio 1 M (3,94 ml; en hexano) a una disolución del compuesto preparado en el ejemplo 12 (355 mg) en dietil éter anhidro (7 ml) a -78°C. Se calentó la mezcla a 0°C y se agitó durante 4,5 horas. Se añadió gota a gota metanol a la mezcla y entonces se calentó a temperatura ambiente. Se añadió ácido clorhídrico 1 N a la mezcla de reacción y se extrajo la mezcla con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 3:1) para dar el compuesto del título (260 mg) que tiene los siguientes datos físicos.
- 15

CCF: Rf 0,50 (cloroformo:metanol = 9:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,13 (da, J = 8,7 Hz, 1H), 6,87 (s, 1H), 6,80 (da, J = 8,7 Hz, 1H), 4,97 (m, 1H), 4,90 (m, 1H), 4,24 (m, 2H), 4,13 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,59 (m, 1H), 2,98 (ta, J = 7,2 Hz, 4H), 2,31 (s, 3H), 2,28-2,00 (m, 5H).

20 Ejemplo 14

8-(1,3-Dimetoxi-2-propil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



Se añadió gota a gota una disolución del compuesto preparado en el ejemplo 13 (120 mg) en DMF (2 ml) a una

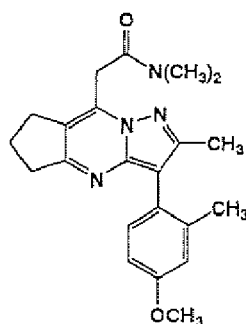
5 disolución de hidruro de sodio (26,0 mg; al 60% en aceite) en DMF a 0°C. Se añadió gota a gota yoduro de metilo (81,0 μ l) a la mezcla, y entonces se agitó durante 1 hora. Se añadieron agua y acetato de etilo a la mezcla de reacción y se separó la fase orgánica. Además, se extrajo la fase acuosa con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica combinada con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró tras añadir benceno (5 ml). Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 3:1) para dar el compuesto del título (58,7 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,80 (acetato de etilo);

10 RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,15 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,79 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 4,28 - 4,16 (m, 1H), 4,14 - 4,06 (m, 2H), 3,96 - 3,86 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,35 (s, 6H), 3,06 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,94 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,17 - 2,08 (m, 2H).

Ejemplo 15

8-(N,N-Dimetilcarbamoilmetil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina



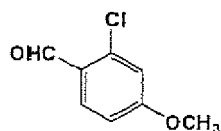
15 A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo 12 (410 mg) en metanol (1 ml), se le añadió una disolución acuosa al 50% de dimetilamino (491 mg) a 24°C y se agitó la mezcla durante 20 horas a 90°C. Se enfrió la mezcla de reacción hasta temperatura ambiente, y se añadieron agua y acetato de etilo a la mezcla y se agitó. Se separó la fase orgánica. Además, se extrajo la fase acuosa con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica combinada con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 5:1) para dar el compuesto del título (102,7 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

20 CCF: Rf 0,55 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 7,16 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,27 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 3,04 - 2,94 (m, 5H), 2,72 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 2,24 - 2,10 (m, 8H).

Ejemplo de referencia 8

25 2-Cloro-4-metoxibenzaldehído



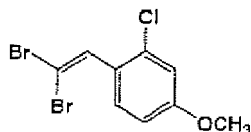
30 A una suspensión de hidruro de sodio (2,6 g; al 62,6% en aceite) en dimetilformamida (80 ml), se le añadió gota a gota una disolución de 2-cloro-4-hidroxibenzaldehído (10,0 g) en dimetilformamida (50 ml) a lo largo de 15 minutos. Se agitó la mezcla durante 30 minutos. Se añadió gota a gota yoduro de metilo (4,2 ml) a la mezcla de reacción a lo largo de 10 minutos a 0°C y se agitó durante 1 hora. Se vertió la mezcla de reacción en agua y se extrajo con hexano / acetato de etilo (1:1). Se lavó la fase orgánica con agua y una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró para dar el compuesto del título (10,7 g) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,61 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

35 RMN (300 MHz, CDCl_3): δ 10,33 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 6,94 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,89 (ddd, J = 9,0, 2,4, 0,6 Hz, 1H), 3,89 (s, 3H).

Ejemplo de referencia 9

1-(2,2-Dibromoetenil)-2-cloro-4-metoxibenceno



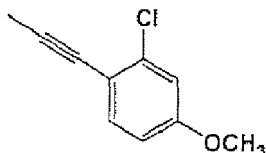
5 Se añadió tetrabromuro de carbono (10,7 g) a una disolución del compuesto preparado en el ejemplo de referencia 8 (5,0 g) en cloruro de metileno. Se añadió trifenilfosfina (16,9 g) en porciones a la mezcla manteniendo una temperatura interna de 5 grados o inferior. Se agitó la mezcla durante 30 minutos a 0°C. Se vertió una suspensión de la mezcla de reacción en hexano (500 ml) en gel de sílice (30 g) y entonces se filtró. Se lavó el gel de sílice con hexano / acetato de etilo (10:1). Se combinaron el filtrado y los lavados y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 10:1) para dar el compuesto del título (6,6 g) que tiene los siguientes datos físicos.

10 CCF: Rf 0,82 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,62 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,51 (s, 1H), 6,94 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 9,0, 2,1 Hz, 1H), 3,81 (s, 3H).

Ejemplo de referencia 10

1-(1-Propinil)-2-cloro-5-metoxibenceno



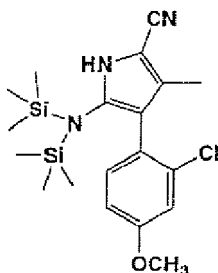
15 A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo de referencia 9 (1,98 g) en tetrahydrofurano (20 ml), se le añadió una disolución 1,57 M de n-butil-litio en hexano (8,2 ml) a -78°C. Se agitó la mezcla durante 30 minutos y 1 hora a 0°C. Se enfrió la mezcla de reacción hasta -78°C y se añadió yoduro de metilo (0,46 ml) y se agitó durante 1 hora a 0°C. Se vertió la mezcla de reacción en agua y se extrajo con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 10:1) para dar el compuesto del título (0,89 g) que tiene los siguientes datos físicos.

20 CCF: Rf 0,69 (hexano:acetato de etilo = 5:1);

25 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,34 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,91 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,73 (d, J = 8,7 Hz, 2,7 Hz, 1H), 3,79 (s, 3H), 2,10 (s, 3H).

Ejemplo de referencia 11

5-Bis(trimetilsilil)amino-2-ciano-3-metil-4-(2-cloro-4-metoxifenil)pirrol



30 Bajo una atmósfera de argón, se añadió lentamente hidruro de diisobutilaluminio (13,8 ml) a cloruro de níquel (832 g), que se secó con calentamiento durante 30 minutos y entonces se agitó la mezcla durante 15 minutos. Después de que el color de la mezcla cambió a negro, se añadió el compuesto preparado en el ejemplo de referencia 10 (11,6 g) en cianuro de trimetilsililo (46 ml) a lo largo de 25 minutos a la mezcla de reacción. Se calentó la mezcla y se eliminó el hexano mediante destilación. Se agitó la disolución durante 2,5 horas a 130°C. Se enfrió la mezcla de reacción a temperatura ambiente y se diluyó con cloruro de metileno. Se purificó la disolución diluida mediante

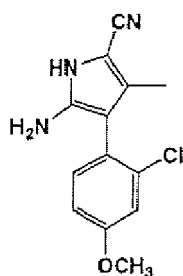
cromatografía en columna en gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 10:1) para dar el compuesto del título (9,5 g) que tiene los siguientes datos físicos y 2-bis(trimetilsilil)amino-5-ciano-3-metil-4-(2-cloro 4-metoxifenil)pirrol (5,2 g) como subproducto.

CCF: Rf 0,34 (hexano:acetato de etilo = 10:1);

- 5 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,76 (sa, 1H), 7,10 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,00 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 0,14 (s, 9H), -0,14 (s, 9H).

Ejemplo de referencia 12

5-Amino-2-ciano-3-metil-4-(2-cloro-4-metoxifenil)pirrol



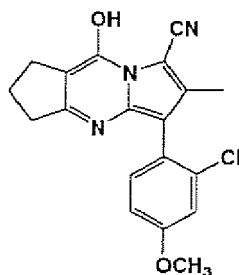
- 10 A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo de referencia 11 (6,27 g) en metanol (50 ml) se le añadió una disolución acuosa 1 N de hidróxido de sodio (15,4 ml) a temperatura ambiente. Se sometió a reflujo la mezcla con calentamiento durante 1,5 horas. Tras enfriar la mezcla de reacción hasta temperatura ambiente, se vertió la mezcla de reacción en una disolución acuosa de carbonato de sodio y se extrajo con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró para dar el compuesto del título (4,78 g) que tiene los siguientes datos físicos.
- 15

CCF: Rf 0,20 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 8,61 (sa, 1H), 7,14 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,03 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,86 (dd, J = 8,7, 2,4 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,71 (sa, 2H), 2,04 (s, 3H).

Ejemplo 16

- 20 1-Ciano-2-metil-8-hidroxi-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,2-a]pirimidina



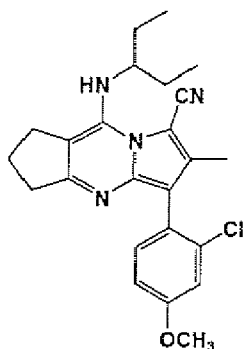
Se obtuvo el compuesto del título (1,35 g) mediante el mismo procedimiento que una reacción del ejemplo 1, usando el compuesto preparado en el ejemplo de referencia 12 (4,15 g).

CCF: Rf 0,15 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

- 25 RMN (300 MHz, DMSO-d₆): δ 12,25 (sa, 1H), 7,31 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 7,20 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,02 (dd, J = 7,8, 2,7 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,83 (m, 2H), 2,66 (m, 2H), 2,06 (s, 3H), 2,03 (m, 2H).

Ejemplo 17

1-Ciano-2-metil-8-(3-pentilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,2-a]pirimidina



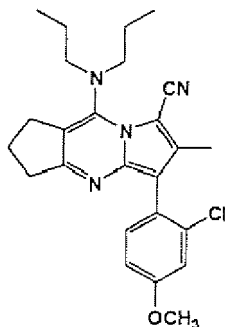
- 5 Se obtuvo el compuesto del título (112 mg) mediante el mismo procedimiento que una reacción del ejemplo 2, usando 1-ciano-2-metil-8-cloro-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirrolo[1,2-a]pirimidina (180 mg) que se preparó mediante el mismo procedimiento que una reacción del ejemplo de referencia 7 usando el compuesto preparado en el ejemplo de referencia 16.

CCF: Rf 0,36 (tolueno:acetato de etilo = 9:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,25 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,05 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,88 (dd, J = 8,4, 2,4 Hz, 1H), 5,94 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,82 (m, 1H), 3,04 (m, 2H), 2,87 (m, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,11 (m, 2H), 1,82-1,60 (m, 4H), 1,04 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 1,03 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

10 Ejemplo 17(1)

1-Ciano-2-metil-8-dipropilamino-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,2-a]pirimidina



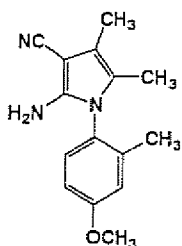
- 15 Se obtuvo el compuesto del título que tiene los siguientes datos físicos mediante el mismo procedimiento que una serie de reacciones Ejemplo de referencia 8 → Ejemplo de referencia 9 → Ejemplo de referencia 10 → Ejemplo de referencia 11 → Ejemplo de referencia 12 → Ejemplo 16 → Ejemplo 17, usando un compuesto correspondiente.

CCF: Rf 0,39 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,26 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,89 (dd, J = 8,1, 2,4 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,35-3,13 (m, 4H), 3,00-2,80 (m, 4H), 2,32 (s, 3H), 2,14 (m, 2H), 1,81-1,38 (m, 4H), 0,91 (t, J = 7,5 Hz, 6H).

Ejemplo de referencia 13

20 5-Amino-4-ciano-2,3-dimetil-1-(2-metil-4-metoxifenil)pirrol



A una disolución de 2-metil-4-metoxianilina (10 g) en tolueno (120 ml), se le añadieron acetona y ácido p-

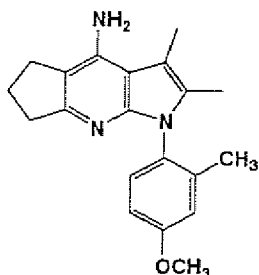
toluenosulfónico hidratado (44 mg). Se sometió a reflujo la mezcla con calentamiento durante 2 horas. Tras enfriar la mezcla de reacción hasta temperatura ambiente, se añadió malononitrilo (4,6 ml) a la mezcla de reacción y se sometió a reflujo con calentamiento durante 12 horas. Se concentró la mezcla de reacción enfriada. Se diluyó el residuo con éter y se filtró para dar el compuesto del título (5,73 g) que tiene los siguientes datos físicos.

5 CCF: Rf 0,65 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,07 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 3,0, 8,4 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,71 (sa, 2H), 2,06 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,73 (s, 3H).

Ejemplo 18

2,3-Dimetil-4-amino-1-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[e]pirrolo[2,3-b]piridina



10

A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo de referencia 13 (4,0 g) en benceno (40 ml), se le añadieron ciclopentanona (1,46 ml) y ácido p-toluenosulfónico hidratado (40 mg). Se sometió a reflujo la mezcla con calentamiento y deshidratación durante 12 horas. Se retiró la materia insoluble mediante filtración a través de Celite y se concentró el filtrado. Bajo una atmósfera de argón, se añadió diisopropilamida de litio 2 M (15,7 ml; en THF) a una disolución del residuo en tetrahidrofurano anhidro (80 ml) a 0°C, y entonces se calentó la mezcla hasta temperatura ambiente y se agitó durante 5 días. Se añadió agua a la mezcla de reacción y se extrajo la mezcla con acetato de etilo. Se lavó el extracto con agua y una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, sucesivamente, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (acetato de etilo) para dar el compuesto del título (2,85 g) que tiene los siguientes datos físicos

15

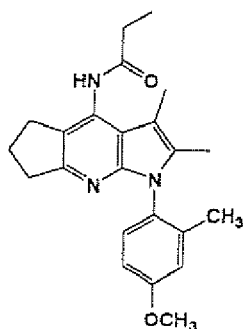
20

CCF: Rf 0,51 (cloroformo:metanol = 10:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,10 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 3,0 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 3,0, 8,4 Hz, 1H), 4,31 (s, 2H), 3,83 (s, 3H), 2,90 (m, 2H), 2,74 (m, 2H), 2,48 (s, 3H), 2,10 (m, 2H), 1,97 (s, 3H), 1,90 (s, 3H).

Ejemplo 19

25 2,3-Dimetil-4-etilcarbonilamino-1-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[e]pirrolo[2,3-b]piridina



30

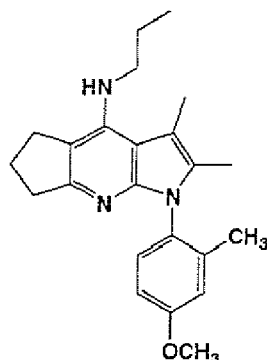
A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo 18 (600 mg) en THF (60 ml), se le añadieron trietilamina (520 μl) y cloruro de propionilo (180 μl). Se agitó la mezcla durante 2 horas. Se diluyó la mezcla de reacción con acetato de etilo y se lavó la disolución diluida con una disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, sucesivamente, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró. Se lavó el residuo con hexano para dar el compuesto del título (451 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,60 (cloroformo:metanol = 10:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,30 (m, 1H), 7,08 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 2,7, 8,4 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 2,98 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,87 (m, 2H), 2,51 (m, 2H), 2,37 (s, 3H), 2,09 (m, 2H), 2,02 (s, 3H), 1,88 (s, 3H), 1,33 (m, 3H).

Ejemplo 20

5 2,3-Dimetil-4-propilamino-1-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[e]pirrolo[2,3-b]piridina



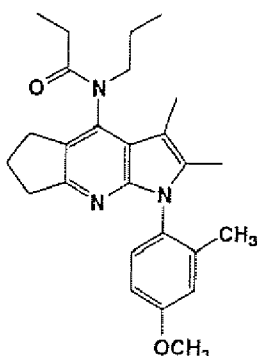
10 A una disolución del compuesto preparado en el ejemplo 19 (451 mg) en THF (5,0 ml), se le añadió complejo de borano-dimetilsulfuro 2 M (4,8 ml; en THF) y se sometió la mezcla a reflujo con calentamiento durante 5 horas. Se añadió metanol a la mezcla de reacción y entonces se sometió la mezcla a reflujo con calentamiento durante 2 horas. Tras enfriar la mezcla de reacción, se diluyó la mezcla con acetato de etilo. Se lavó la disolución diluida con agua y una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 1:1) para dar el compuesto del título (268 mg) que tiene los siguientes datos físicos.

CCF: Rf 0,47 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

15 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,09 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,80 (dd, J = 2,7, 8,7 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,43 (m, 2H), 3,05 (m, 2H), 2,84 (m, 2H), 2,48 (s, 3H), 2,04 (m, 2H), 1,97 (s, 3H), 1,90 (s, 3H), 1,65 (m, 2H), 1,02 (t, J = 7,5 Hz, 3H).

Ejemplo 21

2,3-Dimetil-4-(N-etilcarbonil-N-propilamino)-1-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[e]pirrolo[2,3-b]piridina



20 Bajo una atmósfera de argón, se añadieron trietilamina (360 μ l) y cloruro de propionilo (134 μ l) a una disolución del compuesto preparado en el ejemplo 20 (234 mg) en cloruro de metileno (3,0 ml) a 0°C. Se agitó la mezcla durante 1 hora. Se diluyó la mezcla de reacción con acetato de etilo y se lavó la disolución diluida con una disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio, agua y una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio, sucesivamente, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 2:1) para dar el compuesto del título (242 g) que tiene los siguientes datos físicos.

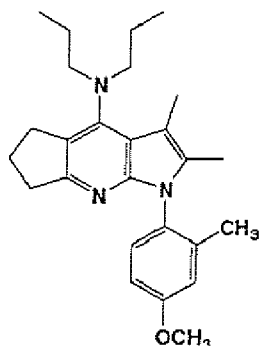
CCF: Rf 0,57 (hexano:acetato de etilo = 1:1);

RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,11 (m, 1H), 6,90 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,85 (dd, J = 2,4, 8,4 Hz, 1H), 3,92 (m, 1H), 3,86 (s,

3H), 3,42 (m, 1H), 3,01 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,87 (m, 2H), 2,20 (s, 3H), 1,94-2,20 (m, 4H), 2,05 (s, 3H), 1,92 y 1,90 (s, 3H total), 1,63 (m, 2H), 0,99-1,10 (m, 3H), 0,85-0,94 (m, 3H).

Ejemplo 22

2,3-Dimetil-4-dipropilamino-1-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[e]pirrolo[2,3-b]piridina



5

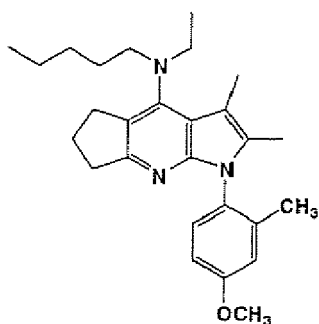
Se obtuvo el compuesto del título (182 mg) que tiene los siguientes datos físicos mediante el mismo procedimiento que una reacción del ejemplo 20, usando el compuesto preparado en el ejemplo 21 (242 mg).

CCF: Rf 0,45 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

10 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,10 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,17 (m, 4H), 2,95 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,88 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 2,44 (s, 3H), 2,05 (m, 2H), 2,01 (s, 3H), 1,92 (s, 3H), 1,52 (m, 4H), 0,85 (t, J = 7,2 Hz, 6H).

Ejemplo 22(1)

2,3-Dimetil-4-(N-etil-N-pentilamino)-1-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[e]pirrolo[2,3-b]piridina



15 Se obtuvo el compuesto del título que tiene los siguientes datos físicos mediante el mismo procedimiento que una serie de reacciones Ejemplo 19 → Ejemplo 20 → Ejemplo 21 → Ejemplo 22, usando un compuesto preparado en el ejemplo 18 y un compuesto correspondiente.

CCF: Rf 0,41 (hexano:acetato de etilo = 3:1);

20 RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,10 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 6,81 (dd, J = 8,4, 2,7 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,27 (q, J = 6,9 Hz, 2H), 3,18 (m, 2H), 2,95 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,88 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,44 (s, 3H), 2,05 (m, 2H), 2,00 (s, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,50 (m, 2H), 1,38-1,20 (m, 4H), 1,05 (t, J = 6,9 Hz, 3H), 0,86 (t, J = 6,9 Hz, 3H).

Ejemplo de formulación

Ejemplo de formulación 1

25 Se mezclaron los siguientes componentes con un método convencional y se troquelaron para obtener 100 comprimidos que contenían cada uno 50 mg de principio activo.

· 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina5,0 g

· carboximetilcelulosa cálcica (agente disgregante)0,2 g
· estearato de magnesio (agente lubricante)0,1 g
· celulosa microcristalina4,7 g

Ejemplo de formulación 2

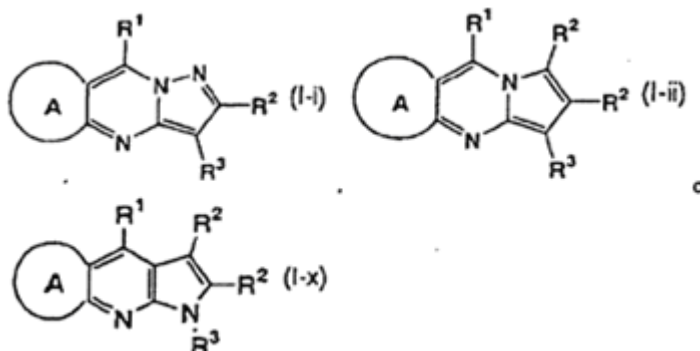
Se mezclaron los siguientes componentes con un método convencional. Se esterilizó la disolución de una manera convencional, se colocó en porciones de 5 ml en ampollas y se liofilizó para obtener 100 ampollas que contenían cada una 20 mg del principio activo.

5

· 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina2,0 g
· manitol20 g
· agua destilada500 ml

REIVINDICACIONES

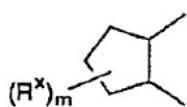
1. Compuesto de fórmulas (I-i), (I-ii) o (I-x)



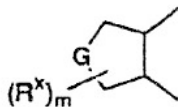
en las que

- 5 R^2 es
- (i) hidrógeno,
 - (ii) alquilo C1-8,
 - (iii) alqueno C2-8,
 - (iv) alquino C2-8,
 - 10 (v) átomo de halógeno,
 - (vi) CF_3 ,
 - (vii) ciano,
 - (viii) nitro,
 - (ix) NR^9R^{10} en el que R^9 y R^{10} son cada uno independientemente,
 - 15 (i) hidrógeno,
 - (ii) alquilo C1-4,
 - (iii) anillo mono o bicarbocíclico C3-10,
 - (iv) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) o
 - 20 (v) alquilo C1-4 sustituido con anillo mono o bicarbocíclico C3-10 o anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s),
 - (x) OR^{11} en el que R^{11} es
 - 25 (i) hidrógeno,
 - (ii) alquilo C1-4,
 - (iii) anillo carbocíclico C5-6,
 - (iv) anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre o
 - 30 (v) alquilo C1-4 sustituido con anillo carbocíclico C5-6 o anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre,
 - (xi) SH,
 - (xii) $S(O)_nR^{12}$ en el que n es 0, 1 ó 2, R^{12} es

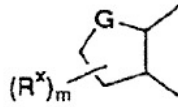
- (i) alquilo C1-4,
- (ii) anillo carbocíclico C5-6,
- (iii) anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre o
- 5 (iv) alquilo C1-4 sustituido con anillo carbocíclico C5-6 o anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre,
- (xiii) COR¹¹,
- (xiv) COOR¹¹,
- (xv) CONR⁹R¹⁰,
- 10 (xvi) anillo mono o bicarbocíclico C3-10,
- (xvii) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) o
- 15 (xviii) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁹R¹⁰, OR¹¹, =N-OR¹¹, SH, S(O)_nR¹², COR¹¹, COOR¹¹, CONR⁹R¹⁰, anillo mono o bicarbocíclico C3-10 y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s),



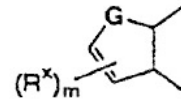
(A-1)



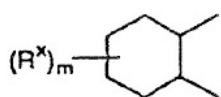
(A-2)



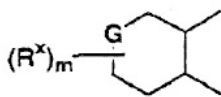
(A-3)



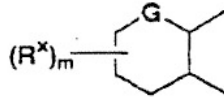
(A-4)



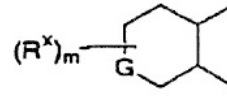
(A-5)



(A-6)



(A-7)



(A-8)

en los que G es O, S o NH; R^x es alquilo C1-4, alcoxilo C1-4, átomo de halógeno o CF₃; m es 0-3, R¹ es

- 20 (i) alquilo C1-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁴,
- (ii) alqueno C2-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁴,
- (iii) alquino C2-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁴,
- (iv) NR⁴R⁵ en el que R⁴ y R⁵ son cada uno independientemente,
- 25 (i) hidrógeno,
- (ii) alquilo C1-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁷,
- (iii) alqueno C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁷,
- (iv) alquino C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁷,
- (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,

- (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,

(v) OR⁶ en el que R⁶ es

- 5 (i) hidrógeno,
 (ii) alquilo C1-10,
 (iii) alqueno C2-10,
 (iv) alquino C2-10,
 (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
 10 (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
 15 (vii) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁹R¹⁰, OR¹¹, =N-OR¹¹, SH, S(O)nR¹², COR¹¹, COOR¹¹, CONR⁹R¹⁰, anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸, y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,

(vi) SH,

(vii) S(O)nR⁷ en el que n es tal como se definió anteriormente en el presente documento, R⁷ es

- (i) alquilo C1-8,
 (ii) anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
 20 (iii) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
 25 (iv) alquilo C1-4 sustituido con anillo mono o bicarbocíclico C3-10, que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸ o anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,

(viii) COR⁶,

(ix) COOR⁶,

(x) CONR⁴R⁵,

(xi) NR⁸COR^{6a} en el que R^{6a} es

- 30 (i) hidrógeno,
 (ii) alquilo C1-10,
 (iii) alqueno C2-10,
 (iv) alquino C2-10 o
 35 (v) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁹R¹⁰, OR^{11a}, =N-OR¹¹, SH, S(O)nR¹², COR¹¹, COOR¹¹ y CONR⁹R¹⁰,

(xii) NR⁸COOR⁶ en el que R⁶ es tal como se definió anteriormente en el presente documento, R⁸ es

- (i) hidrógeno,
 (ii) alquilo C1-8,
 (iii) alqueno C2-8,
 40 (iv) alquino C2-8,
 (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,

- (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸ o
- (vii) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁹R¹⁰, OR¹¹, =N-OR¹¹, SH, S(O)_nR¹², COR¹¹, COOR¹¹, CONR⁹R¹⁰, anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸ y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
- (xiii) NR⁸CONR⁴R⁵,
- (xiv) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁵ o
- (xv) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁵, R^{11a} es (i) hidrógeno, (ii) alquilo C1-4 o (iii) alquilo C1-4 sustituido con anillo carbocíclico C5-6 o anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre,
- R¹⁴ es (a) átomo de halógeno, (b) CF₃, (c) OCF₃, (d) ciano, (e) nitro, (f) NR⁴R⁵, (g) OR⁶, (h) =N-OR⁶, (j) SH, (k) S(O)_nR⁷, (l) COR⁶, (m) COOR⁶, (n) CONR⁴R⁵, (o) NR⁸COR⁶, (p) NR⁸COOR⁶, (q) NR⁸CONR⁴R⁵, (r) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁵ o (s) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁵,
- R¹⁵ es (a) alquilo C1-8, (b) alqueno C2-8, (c) alquino C2-8, (d) alcoxi C1-4-alquilo (C1-4), (e) átomo de halógeno, (f) CF₃, (g) OCF₃, (h) ciano, (j) nitro, (k) NR⁴R⁵, (l) OR⁶, (m) SH, (n) S(O)_nR⁷, (o) COR⁶, (p) COOR⁶, (q) CONR⁴R⁵, (r) NR⁸COR⁶, (s) NR⁸COOR⁶, (t) NR⁸CONR⁴R⁵, (u) anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R²⁰, (v) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R²⁰ o (w) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁴R⁵, OR⁶, =N-OR⁶, SH, S(O)_nR⁷, COR⁶, COOR⁶, CONR⁴R⁵, NR⁸COR⁶, NR⁸COOR⁶, NR⁸CONR⁴R⁵, anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R²⁰, y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R²⁰, R¹⁷ es (a) átomo de halógeno, (b) CF₃, (c) OCF₃, (d) ciano, (e) nitro, (f) NR⁹R¹⁰, (g) OR^{11a}, (h) =N-OR¹¹, (j) SH, (k) S(O)_nR¹², (l) COR¹¹, (m) COOR¹¹, (n) CONR⁹R¹⁰, (o) NR⁸COR¹¹, (p) NR⁸COOR¹¹, (q) NR⁸CONR⁹R¹⁰, (r) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18a} o (s) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18a},
- R¹⁸ es (a) alquilo C1-4, (b) alqueno C2-4, (c) alquino C2-4, (d) átomo de halógeno, (e) CF₃, (f) OCF₃, (g) ciano, (h) nitro, (j) SH, (k) S(O)_nR¹², (l) NR⁹R¹⁰, (m) OR¹¹, (n) COR¹¹, (o) COOR¹¹, (p) CONR⁹R¹⁰, (q) anillo carbocíclico C5-6, (r) anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre o (s) alquilo C1-4 sustituido con anillo carbocíclico C5-6 o anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre,
- R^{18a} es (a) alquilo C1-4, (b) alqueno C2-4, (c) alquino C2-4, (d) átomo de halógeno, (e) CF₃, (f) OCF₃, (g) ciano, (h) nitro, (j) SH, (k) S(O)_nR¹², (l) NR⁹R¹⁰, (m) OR^{11a}, (n) COR¹¹, (o) COOR¹¹ o (p) CONR⁹R¹⁰,
- R²⁰ es alquilo C1-4, alcoxi C1-4, átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, amino, NH(alquilo C1-4) o N(alquilo C1-4)₂,
- R³ es (i) anillo mono o bicarbocíclico C5-10 sustituido con 1-5 R¹⁶ o
- (ii) anillo mono o biheterocíclico C5-10 que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) sustituido con 1-5 R¹⁶,
- R¹⁶ es (a) alquilo C1-8,
- (b) alqueno C2-8,
- (c) alquino C2-8,
- (d) átomo de halógeno,
- (e) CF₃,
- (f) OCF₃,

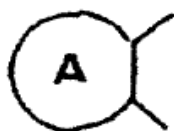
- (g) ciano,
 (h) nitro,
 (j) NR^9R^{10} ,
 (k) OR^{11} ,
 5 (l) SH,
 (m) $\text{S(O)}_n\text{R}^{12}$, con la excepción de feniltio,
 (n) COR^{11} ,
 (o) COOR^{11} ,
 (p) $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$,
 10 (q) $\text{NR}^8\text{COR}^{11}$,
 (r) $\text{NR}^8\text{COOR}^{11}$,
 (s) $\text{NR}^8\text{CONR}^9\text{R}^{10}$,
 (t) anillo mono o bicarbocíclico C3-10,
 15 (u) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s)
 (v) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF_3 , OCF_3 , ciano, nitro, NR^9R^{10} , OR^{11} , $=\text{N-OR}^{11}$, SH, $\text{S(O)}_n\text{R}^{12}$, COR^{11} , COOR^{11} , $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$, $\text{NR}^8\text{COR}^{11}$, $\text{NR}^8\text{COOR}^{11}$, $\text{NR}^8\text{CONR}^9\text{R}^{10}$, anillo mono o bicarbocíclico C3-10, y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s),
 20 con la condición de que cuando R^1 en la fórmula (I-i) es OR^6 , entonces R^3 no es fenilo sustituido con 1 átomo de halógeno, fenilo sustituido con 1 trifluorometilo y fenilo sustituido con trifluorometilo y nitro,
 una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo, con la condición de que el compuesto 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina esté excluido.

- 25 2. Compuesto según la reivindicación 1, en el que



es de fórmula (A-1) o (A-5), una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.

3. Compuesto según la reivindicación 1, en el que



30 es de fórmula (A-2), (A-3), (A-4), (A-6), (A-7) o (A-8), una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.

4. Compuesto según la reivindicación 1, en el que R^1 es

- (i) alquilo C1-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{14} ,
 (ii) alqueno C2-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{14} ,
 (iii) alquino C2-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{14} ,

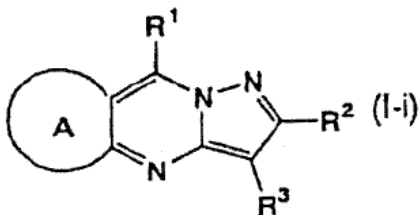
(iv) NR^4R^5 ,

(v) OR^6 ,

(vi) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{15} , o

5 (vii) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{15} , en los que R^{14} y R^{15} son tal como se definieron en la reivindicación 1, una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.

5. Compuesto de fórmula (I-i)



10 en la que todos los símbolos son tal como se definieron en la reivindicación 1, según la reivindicación 1, una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.

6. Compuesto según la reivindicación 5, en el que



es de fórmula (A-1) o (A-5), una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.

7. Compuesto según la reivindicación 5, en el que



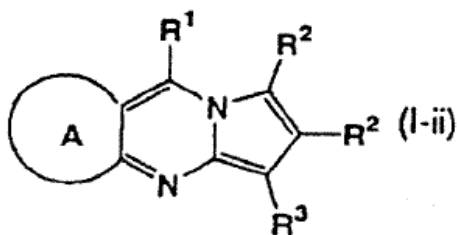
15 es de fórmula (A-2), (A-3), (A-4), (A-6), (A-7) o (A-8), una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.

20 8. Compuesto según la reivindicación 5, en el que R^1 es NR^4R^5 , y (a) R^4 es (i) átomo de hidrógeno y R^5 es (ii) alquilo C1-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iii) alqueno C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iv) alquino C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18} o (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18} o

25 (b) R^4 es (ii) alquilo C1-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iii) alqueno C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iv) alquino C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} o (v-1) anillo monocarbocíclico C3-6 y R^5 es (ii) alquilo C1-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iii) alqueno C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iv) alquino C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18} o (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18} , una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.

30

9. Compuesto de fórmula (I-ii)



en la que todos los símbolos son tal como se definieron en la reivindicación 1, según la reivindicación 1, una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.

10. Compuesto según la reivindicación 9, en el que



5

es de fórmula (A-1) o (A-5), una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.

11. Compuesto según la reivindicación 9, en el que



10

es de fórmula (A-2), (A-3), (A-4), (A-6), (A-7), o (A-8), una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.

12. Compuesto según la reivindicación 9, en el que R^1 es NR^4R^5 , y (a) R^4 es (i) átomo de hidrógeno y R^5 es (ii) alquilo C1-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iii) alqueno C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iv) alquínilo C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18} o (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18} o

15

(b) R^4 es (ii) alquilo C1-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iii) alqueno C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iv) alquínilo C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} o (v-1) anillo monocarbocíclico C3-6 y R^5 es (ii) alquilo C1-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iii) alqueno C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (iv) alquínilo C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{17} , (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18} o (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18} , una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.

20

- 25 13. Compuesto según la reivindicación 1, que se selecciona de

(1) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

(2) 8-(N-etil-N-n-butilamino)-2-metoximetil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

30

(3) 8-(N-propil-N-(2-hidroxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

(4) 9-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,6,7,8-tetrahidro-pirazolo[3,2-b]quinazolina,

(5) 8-[(2S)-1,1-dimetoxibutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

35

(6) 8-(1,3-dimetoxipropan-2-il)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

(7) 8-bis(2-metoxietil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-

- a]pirimidina,
- (8) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2, 4-diclorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (9) 8-dietilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina
- 5 (10) 8-(N-etil-N-n-butilamino)-2-metil-3-(2,4-diclorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (11) 8-diciclopropilmetilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (12) 8-(3-pentilamino)-2-metoximetil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (13) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(1,3-dioxaindan-5-il)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (14) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(3,4-dimetoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (15) 8-(3-pentilamino)-2-ciclobutil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (16) 8-(3-pentilamino)-2-etil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (17) 8-(3-pentilamino)-2-isopropil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (18) 8-(2-etilbutilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (19) 8-(3-pentilamino)-2-metiltimetil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (20) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,4-dimetilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (21) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,5-dimetilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (22) 8-ciclobutilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (23) 8-(N-etil-N-ciclobutilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (24) 8-(propan-1,3-diol-2-il)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (25) 8-(3-pentilamino)-2-(2-furil)-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (26) 8-(3-pentilamino)-2-fenil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (27) 8-(2-dimetilaminoetil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (28) 8-(N-metil-N-(2-dimetilaminoetil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (29) 8-(N-etil-N-(2-dimetilaminoetil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (30) 8-(4-heptilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (31) 8-(2-butilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 40 (32) 8-(N-propil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (33) 8-(3-pentilamino)-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (34) 8-[(2R)-1-metoxibutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

- (35) 8-[(2S)-1-metoxibutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (36) 8-ciclopentilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (37) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,4-difluorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (38) 8-(3-pentilamino)-2-trifluorometil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (39) 8-(N-etil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (40) 8-ciclohexilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (41) 8-(N-propil-N-(3-pentil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (42) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (43) 8-(3-pentilamino)-2-isopropil-3-(4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (44) 8-t-butilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (45) 8-(3-pentilamino)-3-(2,4,6-trimetilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (46) 8-(1-ciclobutiletal)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (47) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,3-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (48) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,5-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (49) 8-(N-(2,2,2-trifluoroetil)-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (50) 8-(2,2,2-trifluoroetil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (51) 8-(3-pentilamino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (52) 8-(3-pentilamino)-3-(4,6-dimetil-2-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (53) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (54) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(4,6-dimetil-2-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (55) 8-(3-metilpentan-3-il)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (56) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(5-cloro-1,3-dioxaindan-6-il)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (57) 8-(N-etil-N-bencilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (58) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-trifluorometoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 40 (60) 8-(N-bencil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (61) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metoksi-4,5-dimetilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (62) 8-fenilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

- (63) 8-(2-metilfenil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (64) 8-(3-metilfenil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (65) 8-(4-metilfenil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (66) 8-(N-fenil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (67) 8-(N-bencil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (68) 8-(N,N-dialilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (69) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-dimetilaminofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (70) 8-(1-fenilpropilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (71) 8-(N-(2-feniletil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (72) 8-(N-(3-fenilpropil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (73) 8-(N-(4-fenilbutil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (74) 8-(1-fenil-2-butil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (75) 8-(1-fenil-3-pentil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (76) 8-(N-(4-metilfenil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (77) 8-(N-(4-metilfenil)metil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (78) 8-(N-(3-metilfenil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (79) 8-(N-(4-metoxifenil)metil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (80) 8-(N-(4-clorofenil)metil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (81) 8-(N-(2-metilfenil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 40 (82) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-dimetilamino-4-metilpiridin-5-il)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (83) 8-((2S)-1-metoxi-3-fenil-2-propil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (84) 8-(N-(4-metiltiofenil)metil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 45 (85) 8-(N,N-dibutilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

- (86) 8-(N-metil-N-butilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (87) 8-(N-(4-metilfenil)metil-N-butilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (88) 8-(N-(4-metilfenil)metil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (89) 8-(N-ciclopropil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (90) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (91) 8-(N,N-dipropilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (92) 8-(N-(4-metilfenil)metil-N-(2-butiril)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (93) 8-(N-propil-N-(2-butiril)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (94) 8-(5-nonilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (95) 8-(N-ciclopentil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (96) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-metiltiofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (97) 8-(N-(4-fluorofenil)metil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (98) 8-(N-ciclobutil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (99) 8-(N-etil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (100) 8-(N-propil-N-(4-trifluorometilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (101) 8-(N-propil-N-(tetrahidrofurano-2-il)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (102) 8-(N-butil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (103) 8-(N-propil-N-ciclopropilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (104) 8-(N-ciclobutilmetil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (105) 8-(4-heptilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 40 (106) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(2-butiril)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (107) 8-(N-(2-metoxietil)-N-(2-butiril)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (108) 8-(2-butirilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 45 (109) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (110) 8-(N-propil-N-(4-trifluorometiloxifenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-

- ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (111) 8-(N-(2-butiril)-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (112) 8-(N-propil-N-(3-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (113) 8-(N-propil-N-(2-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (114) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-etoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (115) 8-(N-metil-N-hexilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (116) 8-(N-metil-N-(3-pentil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (117) 8-(N-metil-N-(4-heptil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (118) 8-(N-ciclobutil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (119) 8-(N-isobutil-N-(2-dimetilaminoetil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (120) 8-(N-propil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (121) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (122) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(3-cloro-5-trifluorometilpiridin-2-il)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (123) 8-(N-butil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (124) 8-(N-ciclopropil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (125) 8-(N-propil-N-(2-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (126) 8-(N-propil-N-(3-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (127) 8-diciclopropilmetilamino-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (128) 8-(N-butil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (129) 8-(N-ciclopropilmetil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 40 (130) 8-(N-(2-butiril)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (131) 8-(N-butil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (132) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 45 (133) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(3,5-dicloropiridin-2-il)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (134) 8-(N-butil-N-etilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-

- a]pirimidina,
- (135) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-trifluorometilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (136) 8-(N-bencil-N-(2-dimetilaminoetil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (137) 8-(N-bencil-N-(2-dimetilaminoetil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (138) 8-(N-(2-butinil)-N-etilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (139) 8-(N-(2-butinil)-N-etilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (140) 8-(N,N-dipropilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (141) 8-(N-propil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (142) 8-(N-propil-N-(3-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (143) 8-dipropilamino-2-metil-3-(2,5-diclorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (144) 8-dipropilamino-2-metil-3-(2,4-diclorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (145) 8-dipropilamino-2-metil-3-(4-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (146) 8-dipropilamino-2-metil-3-(3-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (147) 8-dipropilamino-2-metil-3-(2-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (148) 8-(N-propil-N-(benz[d]1,3-dioxolan-5-il)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (149) 8-(N-propil-N-(benz[d]1,3-dioxolan-5-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (150) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (151) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(3-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (152) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(4-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (153) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (154) 8-(N-bencil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (155) 8-(N-bencil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (156) 8-(N-butil-N-(2-butinil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (157) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-fluorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (158) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,5-diclorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 40 (159) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,4-dimetoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (160) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-fluoro-4-metilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (161) 8-(N-butil-N-(2-butinil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

- (162) 8-(3-metil-2-butilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (163) 8-(1-ciclohexiletilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (164) 8-(2-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (165) 8-(2-heptilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (166) 8-(1-metoxi-2-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (167) 8-(2-octilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (168) 8-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (169) 8-((1S,2S,3S,5R)-2,6,6-trimetilbiciclo[3,1,1]-3-heptil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (170) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-clorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (171) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,5-dimetoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (172) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (173) 8-(N-etil-N-(4-hidroxibutil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (174) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metoxi-5-isopropilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (175) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metoxi-5-fluorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (176) 8-(N-butil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-5-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (177) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metoxi-5-clorofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (178) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-trifluorometilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-5-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (179) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-cianofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (180) 8-(N-propil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-5-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (181) 8-(N-etil-N-(4-metiltiofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (182) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(4-metiltiofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (183) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(4-dimetilaminofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (184) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metiltiofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (185) 8-(N-(2-metoxietil)-N-(2-butilil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 40 (186) 8-(N-propil-N-(5-metilfurano-2-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (187) 8-(N-bencil-N-ciclopropilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (188) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

- (189) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-bromofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (190) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,5-dicloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (191) 8-dibutilamino-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (192) 8-bis(2-metoxietil)amino-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (193) 8-(N-etil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (194) 8-(N-ciclopropil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (195) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (196) 8-(N-butil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (197) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-etoxicarbonilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (198) 8-(N-propil-N-(2-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (199) 8-(N-propil-N-(5-metiltiofen-2-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (200) 8-(N-propil-N-(tiofen-3-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (201) 8-(N-etil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (202) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-carbamoilfenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (203) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-(N-metilcarbamoil)fenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (204) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-(N,N-dimetilcarbamoil)fenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (205) 8-(N-etil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (206) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4,6-dimetoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (207) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-aminofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (208) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metilaminofenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (209) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-formil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 40 (210) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-ciano-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (211) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-etil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (212) 8-(4-heptilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (213) 8-(N,N-dipropilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 45 (214) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metoxicarbonil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-

- a]pirimidina,
- (215) 8-(N-ciclopropil-N-(2-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (216) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(2-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (217) 8-(N-ciclopropilmetil-N-propilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (218) 8-(N-propil-N-(4-metilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (219) 8-(N-bencil-N-ciclopropilmetilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (220) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-metilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (221) 8-(N-propil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (222) 8-diciclopropilmetilamino-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (223) 8-(N-ciclopropil-N-(4-metilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (224) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-trifluorometilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (225) 8-(3-pentilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (226) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (227) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-(1-metil-1-hidroxi-etil)-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (228) 8-(N-propil-N-(4-trifluorometiloxifenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (229) 8-(3-hexilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (230) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metoxi-4-metilpiridin-5-il)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (231) 8-(N-butil-N-ciclopropilmetilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (232) 8-(N-propil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (233) 8-(N-propil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (234) 8-(N-ciclopropilmetil-N-metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 40 (235) 8-(N-etil-N-n-butilamino)-2-hidroximetil-3-(2-metil-4-hidroxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (236) 8-(N-etil-N-n-butilamino)-2-hidroximetil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 45 (237) 8-(N-propil-N-(2-metoxiiminoetil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (238) 8-(N-etil-N-n-butilamino)-2-hidroxiiminometil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-

- ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (239) 8-[(2S)-1-hidroxiiminobutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (240) 8-[(1S)-1-cianopropilamino]-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (241) 8-(N-etil-N-n-butilamino)-2-ciano-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (242) 1-ciano-2-metil-8-(3-pentilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,2-a]pirimidina,
- 10 (243) 1-ciano-2-metil-8-dipropilamino-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,2-a]pirimidina,
- (244) 2,3-dimetil-4-amino-1-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[e]pirrolo[2,3-b]piridina,
- (245) 2,3-dimetil-4-etilcarbonilamino-1-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[e]pirrolo[2,3-b]piridina,
- 15 (246) 2,3-dimetil-4-propilamino-1-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[e]pirrolo[2,3-b]piridina,
- (247) 2,3-dimetil-4-(N-etilcarbonil-N-propilamino)-1-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[e]pirrolo[2,3-b]piridina,
- (248) 2,3-dimetil-4-dipropilamino-1-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[e]pirrolo[2,3-b]piridina,
- (249) 8-(4-heptilamino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (250) 8-dipropilamino-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (251) 8-(N-ciclopropilmetil-N-propilamino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (252) 8-(N-bencil-N-ciclopropilmetilamino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (253) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-metilfenilmetil)amino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (254) 8-(N-propil-N-(4-fluorofenilmetil)amino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (255) 8-diciclopropilmetilamino-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (256) 8-(N-butil-N-ciclopropilmetilamino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (257) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina y
- 35 (258) 2,3-dimetil-4-(N-etil-N-pentilamino)-1-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[e]pirrolo[2,3-b]piridina,
- una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.
14. Compuesto según la reivindicación 1, que se selecciona de
- 40 (1) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-tieno[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (2) 9-(3-pentilamino)-6-metil-5-(2-metil-4-metoxifenil)-2,3-dihidro-tieno[3,2-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (3) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (4) 9-(3-pentilamino)-6-metil-5-(2-metil-4-metoxifenil)-2,3-dihidro-furo[3,2-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (5) 9-(3-pentilamino)-6-metil-5-(2-metil-4-metoxifenil)-2,3-dihidro-pirrolo[3,2-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

- (6) 8-isopropilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (7) 8-[(2S)-1,1-dimetoxibutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (8) 8-(1,3-dimetoxipropan-2-il)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (9) 8-bis(2-metoxietil)amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (10) (5RS)-8-(3-pentilamino)-2,5-dimetil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (11) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-pirrol[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (12) 8-(N-propil-N-(2-hidroxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (13) 8-ciclopropilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (14) 8-(N-metil-N-ciclopropilamino)-2-metil-8-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (15) 8-[(2R)-1-metoxibutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (16) 8-[(2R)-1-metoxibutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-2,3-dihidro-furo[3,2-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (17) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (18) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-etoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (19) 8-(N-ciclopropil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidrofuro[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (20) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (21) 8-(N-propil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (22) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-metiltiofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (23) 8-(N,N-dipropilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (24) 8-(N,N-dibutilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (25) 8-(N-propil-N-(4-metilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (26) 8-(N-butil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (27) 8-(4-heptilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (28) 8-(N-butil-N-etilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (29) 8-diciclopropilmetilamino-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 40 (30) 8-(N-ciclopropilmetil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (31) 8-(N-(2-butilil)-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (32) 8-(N-butil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-

- a]pirimidina,
- (33) 8-(N-propil-N-(4-trifluorometiloxifenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (34) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (35) 8-(N-ciclopropilmetilamino-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (36) 8-(N-bencil-N-(2-dimetilaminoetil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (37) 8-(N-(2-butilil)-N-etilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (38) 8-(N-(2-butilil)-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (39) 8-(N-ciclopropil-N-(4-metiltiofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (40) 8-(N-propil-N-(4-metiltiofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (41) 8-(N-ciclopropil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (42) 8-(N-propil-N-(3-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (43) 8-(N-propil-N-(benz[d]1,3-dioxolan-5-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (44) 8-(N-bencil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (45) 8-(N-butil-N-(2-butilil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (46) 8-diciclopropilmetilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (47) 8-(N-butil-N-etilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (48) 8-(N-butil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (49) 8-(N,N-dipropilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (50) 8-bis(2-metoxietil)amino-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (51) 8-(N-butil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (52) 8-(N-butil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (53) 8-(N-etil-N-(2-butilil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 40 (54) 8-(N-propil-N-(2-butilil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (55) 8-(N-propil-N-(4-metiltiofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 45 (56) 8-(N-propil-N-(benz[d]1,3-dioxolan-5-il)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

- (57) 8-(N-bencil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (58) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-trifluorometilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (59) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-trifluorometilfenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (60) 8-(N-propil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (61) 8-(N-ciclopropil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidrofuro[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (62) 8-(N-ciclopropil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidrofuro[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (63) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (64) 8-(N-propil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (65) 8-(N-propil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (66) 8-(N-etil-N-(4-metiltiofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (67) 8-(N-etil-N-(4-metiltiofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (68) 8-(N-butil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (69) 8-(N-ciclopropilmetil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (70) 8-(N-propil-N-(5-metilfuran-2-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (71) 8-(N-propil-N-(5-metilfuran-2-il)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (72) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (73) 8-(N-propil-N-(4-trifluorometiloxifenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (74) 8-(N-propil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (75) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(2-butinil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 40 (76) 8-(N-(2-metoxietil)-N-(2-butinil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (77) 8-(N-(2-metoxietil)-N-(2-butinil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (78) 8-(N-bencil-N-ciclopropilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 45 (79) 8-(N-bencil-N-ciclopropilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

- (80) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(2-metoxietil)amino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (81) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,5-dicloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (82) 8-(N-ciclopropil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (83) 8-(N-ciclopropil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (84) 8-dibutilamino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (85) 8-(N-etil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (86) 8-(N-etil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (87) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (88) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (89) 8-(N-propil-N-(tiofen-3-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (90) 8-(N-propil-N-(5-metiltiofen-2-il)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidrofuro[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (91) 8-(N-butil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (92) 8-(N-butil-N-ciclopropilmetilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (93) 8-(N-propil-N-(tiofen-3-il)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (94) 8-(N-propil-N-(5-metiltiofen-2-il)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (95) 8-(N-propil-N-(2-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (96) 8-(N-propil-N-(2-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (97) 8-(N-etil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (98) 8-(N-etil-N-propilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (99) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2,6-dimetil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (100) 8-(N-etil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (101) 8-(N-etil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 40 (102) 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4,6-dimetoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (103) 8-(4-heptilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (104) 8-(N,N-dipropilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (105) 8-(N-ciclopropilmetil-N-propilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

- (106) 8-(N-bencil-N-ciclopropilmetilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (107) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-metilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidrofuro[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (108) 8-(N-propil-N-(2-butilil)amino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (109) 8-(N-butil-N-ciclopropilmetilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (110) 8-(3-pentilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (111) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidrofuro[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (112) 8-(4-heptilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (113) 8-(N-propil-N-(4-metilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (114) 8-(N-propil-N-(4-fluorofenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (115) 8-diciclopropilmetilamino-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (116) 8-(N-ciclopropilmetil-N-(4-trifluorometilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (117) 8-(N-ciclopropil-N-(4-metilfenil)metilamino)-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (118) 8-(N-propil-N-(4-cianofenil)metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (119) 8-(N-ciclopropilmetil-N-metilamino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (120) 8-(N-ciclopropilmetil-N-metilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (121) 8-(N-propil-N-(2-metoxiiminoetil)amino)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (122) 8-[(2S)-1-metoxiiminobutan-2-il]amino-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina y
- (123) 9-(3-pentilamino)-6-metil-5-(2-metil-4-metoxifenil)-furo[3,2-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.
15. Compuesto según la reivindicación 1, que se selecciona de
- (1) 8-hidroxi-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (2) 2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-8-[(2S,4R)-4-metoxi-2-metoximetilpirrolidin-1-il]-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (3) 8-(1,2,5,6-tetrahidropiridil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 40 (4) 8-(1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-2-il)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (5) 8-((3S)-3-metoximetil-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-2-il)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (6) 8-(4-fenilpiperazin-1-il)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

- (7) 8-(4-(2-clorofenil)piperazin-1-il)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (8) 8-(3-etoxicarbonil-1,2,5,6-tetrahidropiridil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 5 (9) 8-(3-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1,2,5,6-tetrahidropiridil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (10) 8-(4-(4-clorofenil)-1,2,5,6-tetrahidropiridil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (11) 8-(3-pentiloxi)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 10 (12) 8-(3-pentiloxi)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (13) 8-(4-heptiloxi)-2-metil-3-(2-cloro-5-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (14) 8-isopropiloxi-2-metil-3-(2-cloro-5-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (15) 8-(1,6-heptadien-4-il)oxi-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 15 (16) 8-(3-pentiltio)-2-metil-3-(2-cloro-5-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (17) 8-(4-metilfenil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (18) 8-(2,4-diclorofenil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (19) 8-(3-trifluorometilfenil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 20 (20) 8-(4-metoxifenil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (21) 8-(3,5-diclorofenil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (22) 8-(2-metilfenil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (23) 8-bis(etoxicarbonil)metil-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 25 (24) 8-(1-dimetilamino-1,3-dioxo-2-butil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (25) 8-(2,4-dioxo-3-pentil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 30 (26) 8-bis(etoxicarbonil)metil-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (27) 8-(1,3-hidroxi-2-propil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (28) 8-(1,3-dimetoxi-2-propil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- 35 (29) 8-(N,N-dimetilcarbamoilmetil)-2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina y
- (30) 1-ciano-2-metil-8-hidroxi-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1-2-a]pirimidina,
una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.
16. Compuesto según la reivindicación 1, que se selecciona de
- 40 (1) 6-metil-5-(2-metil-4-metoxifenil)-9-[(2S,4R)-4-metoxi-2-metoximetilpirrolidin-1-il]-2,3-dihidro-furo[3,2-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,
- (2) 2-metil-3-(2-metil-4-metoxifenil)-8-[(2S,4R)-4-metoxi-2-metoximetilpirrolidin-1-il]-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

(3) 6-metil-5-(2-metil-4-metoxifenil)-9-[(2S,4R)-4-metoxi-2-metoximetilpirrolidin-1-il]-2,3-dihidro-pirrolo[3,2-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

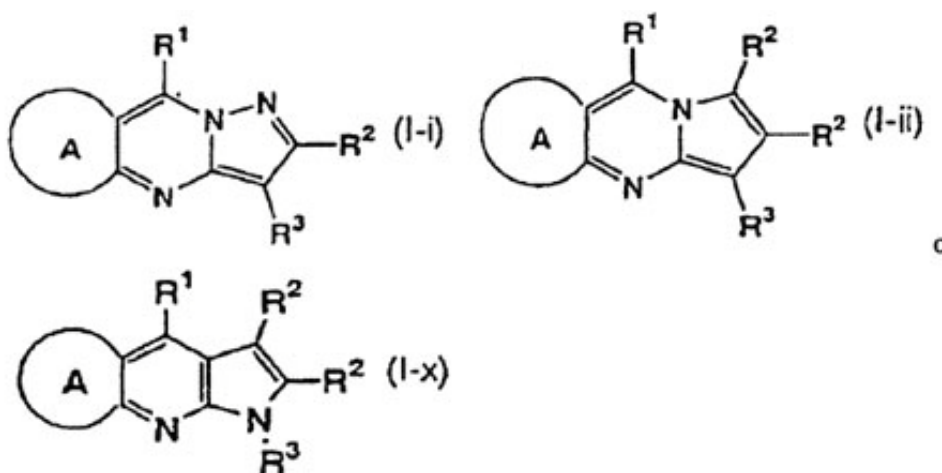
(4) 8-(3-pentiloxi)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina y

(5) 8-bis(etoxicarbonil)metil-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-5,7-dihidro-furo[3,4-d]pirazolo[1,5-a]pirimidina,

5 una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo.

17. Composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmulas (I-i), (I-ii) o (I-x) descritas en la reivindicación 1, una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo como principio activo.

10 18. Uso de un compuesto de fórmulas (I-i), (I-ii) o (I-x) tal como se describieron en la reivindicación 1, una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo para la preparación de una composición farmacéutica para el tratamiento y/o la prevención de enfermedades inducidas por secreción extraordinaria del factor de liberación de corticotropina, en el que las fórmulas (I-i), (I-ii) o (I-x) son



en las que R² es

- 15 (i) hidrógeno,
 (ii) alquilo C1-8,
 (iii) alqueno C2-8,
 (iv) alquino C2-8,
 (v) átomo de halógeno,
 20 (vi) CF₃,
 (vii) ciano,
 (viii) nitro,
 (ix) NR⁹R¹⁰ en el que R⁹ y R¹⁰ son cada uno independientemente,
- 25 (i) hidrógeno,
 (ii) alquilo C1-4,
 (iii) anillo mono o bicarbocíclico C3-10,
 (iv) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) o
 30 (v) alquilo C1-4 sustituido con anillo mono o bicarbocíclico C3-10 o anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s),

(x) OR¹¹ en el que R¹¹ es

- (i) hidrógeno,
- (ii) alquilo C1-4,
- (iii) anillo carbocíclico C5-6,
- (iv) anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre o
- (v) alquilo C1-4 sustituido con anillo carbocíclico C5-6 o anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre,

(xi) SH,

(xii) S(O)_nR¹² en el que n es 0, 1 ó 2, R¹² es

- (i) alquilo C1-4,
- (ii) anillo carbocíclico C5-6,
- (iii) anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre o
- (iv) alquilo C1-4 sustituido con anillo carbocíclico C5-6 o anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre,

(xiii) COR¹¹,

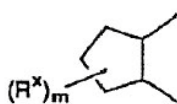
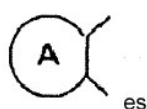
(xiv) COOR¹¹,

(xv) CONR⁹R¹⁰,

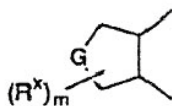
(xvi) anillo mono o bicarbocíclico C3-10,

(xvii) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) o

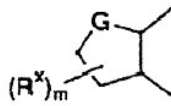
(xviii) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁹R¹⁰, OR¹¹, =N-OR¹¹, SH, S(O)_nR¹², COR¹¹, COOR¹¹, CONR⁹R¹⁰, anillo mono o bicarbocíclico C3-10 y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s)



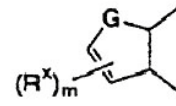
(A-1)



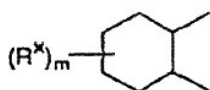
(A-2)



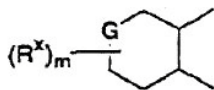
(A-3)



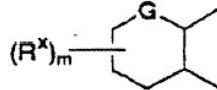
(A-4)



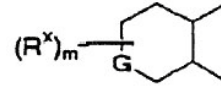
(A-5)



(A-6)



(A-7)



(A-8)

en los que G es O, S o NH; R^x es alquilo C1-4, alcoxilo C1-4, átomo de halógeno o CF₃; m es 0-3;

R¹ es

- (i) alquilo C1-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁴,
- (ii) alqueno C2-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁴,
- (iii) alquino C2-8 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁴,
- (iv) NR⁴R⁵ en el que R⁴ y R⁵ son cada uno independientemente,
 - 5 (i) hidrógeno,
 - (ii) alquilo C1-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁷,
 - (iii) alqueno C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁷,
 - (iv) alquino C2-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁷,
 - (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
 - 10 (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
- (v) OR⁶ en el que R⁶ es
 - (i) hidrógeno,
 - (ii) alquilo C1-10,
 - 15 (iii) alqueno C2-10,
 - (iv) alquino C2-10,
 - (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
 - (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
 - 20 (vii) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁹R¹⁰, OR¹¹, =N-OR¹¹, SH, S(O)_nR¹², COR¹¹, COOR¹¹, CONR⁹R¹⁰, anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸, y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
 - 25 (vi) SH,
 - (vii) S(O)_nR⁷ en el que n es tal como se definió anteriormente en el presente documento, R⁷ es
 - (i) alquilo C1-8,
 - (ii) anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
 - 30 (iii) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
 - (iv) alquilo C1-4 sustituido con anillo mono o bicarbocíclico C3-10, que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸ o anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
 - 35 (viii) COR⁶,
 - (ix) COOR⁶,
 - (x) CONR⁴R⁵,
 - (xi) NR⁸COR^{6a} en el que R^{6a} es
 - (i) hidrógeno,
 - 40 (ii) alquilo C1-10,
 - (iii) alqueno C2-10,

- (iv) alquinilo C2-10 o
- (v) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁹R¹⁰, OR^{11a}, =N-OR¹¹, SH, S(O)_nR¹², COR¹¹, COOR¹¹ y CONR⁹R¹⁰,
- (xii) NR⁸COOR⁶ en el que R⁶ es tal como se definió anteriormente en el presente documento, R⁸ es
- 5 (i) hidrógeno,
- (ii) alquilo C1-8,
- (iii) alqueno C2-8,
- (iv) alquinilo C2-8,
- (v) anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
- 10 (vi) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸ o
- (vii) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁹R¹⁰, OR¹¹, =N-OR¹¹, SH, S(O)_nR¹², COR¹¹, COOR¹¹, CONR⁹R¹⁰,
 15 anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸, y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁸,
- (xiii) NR⁸CONR⁴R⁵,
- (xiv) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁵
- o
- 20 (xv) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁵,
- R^{11a} es (i) hidrógeno, (ii) alquilo C1-4 o (iii) alquilo C1-4 sustituido con anillo carbocíclico C5-6 o anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre,
- 25 R¹⁴ es (a) átomo de halógeno, (b) CF₃, (c) OCF₃, (d) ciano, (e) nitro, (l) NR⁴R⁵, (g) OR⁶, (h) =N-OR⁶, (j) SH, (k) S(O)_nR⁷, (l) COR⁶, (m) COOR⁶, (n) CONR⁴R⁵, (o) NR⁸COR⁶, (p) NR⁸COOR⁶, (q) NR⁸CONR⁴R⁵, (r) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁵ o (s) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R¹⁵,
- 30 R¹⁵ es (a) alquilo C1-8, (b) alqueno C2-8, (c) alquinilo C2-8, (d) alcoxi C1-4-alquilo (C1-4), (e) átomo de halógeno, (f) CF₃, (g) OCF₃, (h) ciano, (j) nitro, (k) NR⁴R⁵, (l) OR⁶, (m) SH, (n) S(O)_nR⁷, (o) COR⁶, (p) COOR⁶, (q) CONR⁴R⁵, (r) NR⁸COR⁶, (s) NR⁸COOR⁶, (t) NR⁸CONR⁴R⁵, (u) anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R²⁰, (v) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R²⁰ o (w) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁴R⁵, OR⁶, =N-OR⁶, SH, S(O)_nR⁷, COR⁶, COOR⁶, CONR⁴R⁵, NR⁸COR⁶, NR⁸COOR⁶, NR⁸CONR⁴R⁵, anillo mono o bicarbocíclico C3-10 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R²⁰, y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R²⁰,
- 35 R¹⁷ es (a) átomo de halógeno, (b) CF₃, (c) OCF₃, (d) ciano, (e) nitro, (f) NR⁹R¹⁰, (g) OR^{11a}, (h) =N-OR¹¹, (j) SH, (k) S(O)_nR¹², (l) COR¹¹, (m) COOR¹¹, (n) CONR⁹R¹⁰, (o) NR⁸COR¹¹, (p) NR⁸COOR¹¹, (q) NR⁸CONR⁹R¹⁰, (r) anillo mono o bicarbocíclico C3-15 que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18a} o (s) anillo mono o biheterocíclico de 3-15 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) que no está sustituido o está sustituido con 1-5 R^{18a},
- 40 R¹⁸ es (a) alquilo C1-4, (b) alqueno C2-4, (c) alquinilo C2-4, (d) átomo de halógeno, (e) CF₃, (f) OCF₃, (g) ciano, (h) nitro, (j) SH, (k) S(O)_nR¹², (l) NR⁹R¹⁰, (m) OR¹¹, (n) COR¹¹, (o) COOR¹¹, (p) CONR⁹R¹⁰, (q) anillo carbocíclico C5-6, (r) anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre o (s) alquilo C1-4 sustituido con anillo carbocíclico C5-6 o anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene 1-2 nitrógeno(s), 1 oxígeno y/o 1 azufre,
- 45 R^{18a} es (a) alquilo C1-4, (b) alqueno C2-4, (c) alquinilo C2-4, (d) átomo de halógeno, (e) CF₃, (f) OCF₃, (g) ciano, (h) nitro, (j) SH, (k) S(O)_nR¹², (l) NR⁹R¹⁰, (m) OR^{11a}, (n) COR¹¹, (o) COOR¹¹ o (p) CONR⁹R¹⁰,
- 50

R²⁰ es alquilo C1-4, alcoxilo C1-4, átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, amino, NH(alquilo C1-4) o N(alquilo C1-4)₂,

R³ es (i) anillo mono o bicarbocíclico C5-10 sustituido con 1-5 R¹⁶ o

5 (ii) anillo mono o biheterocíclico C5-10 que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s) sustituido con 1-5 R¹⁶,

R¹⁶ es (a) alquilo C1-8,

(b) alqueno C2-8,

(c) alquino C2-8,

(d) átomo de halógeno,

10 (e) CF₃,

(f) OCF₃,

(g) ciano,

(h) nitro,

(j) NR⁹R¹⁰,

15 (k) OR¹¹,

(l)SH,

(m) S(O)_nR¹², con la excepción de feniltio,

(n) COR¹¹,

(o) COOR¹¹,

20 (p) CONR⁹R¹⁰,

(q) NR⁸COR¹¹,

(r) NR⁸COOR¹¹,

(s) NR⁸CONR⁹R¹⁰,

(t) anillo mono o bicarbocíclico C3-10,

25 (u) anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s)

(v) alquilo C1-4 sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de átomo de halógeno, CF₃, OCF₃, ciano, nitro, NR⁹R¹⁰, OR¹¹, =N-OR¹¹, SH, S(O)_nR¹², COR¹¹, COOR¹¹, CONR⁹R¹⁰, NR⁸COR¹¹, NR⁸COOR¹¹, NR⁸CONR⁹R¹⁰, anillo mono o bicarbocíclico C3-10, y anillo mono o biheterocíclico de 3-10 miembros que contiene 1-4 nitrógeno(s), 1-2 oxígeno(s) y/o 1-2 azufre(s),

30 con la condición de que (1) cuando cada uno de X y W es carbono, cada uno de Y y Z es nitrógeno, U es CR⁴ y R¹ es OR⁶, entonces R³ no es fenilo sustituido con 1 átomo de halógeno, fenilo sustituido con 1 trifluorometilo y fenilo sustituido con trifluorometilo y nitro, (2) cuando cada uno de X, Y y Z son carbonos y cada uno de U y W es nitrógeno, entonces R³ es anillo mono o bicarbocíclico C5-10 sustituido con 1-5 R¹⁶;

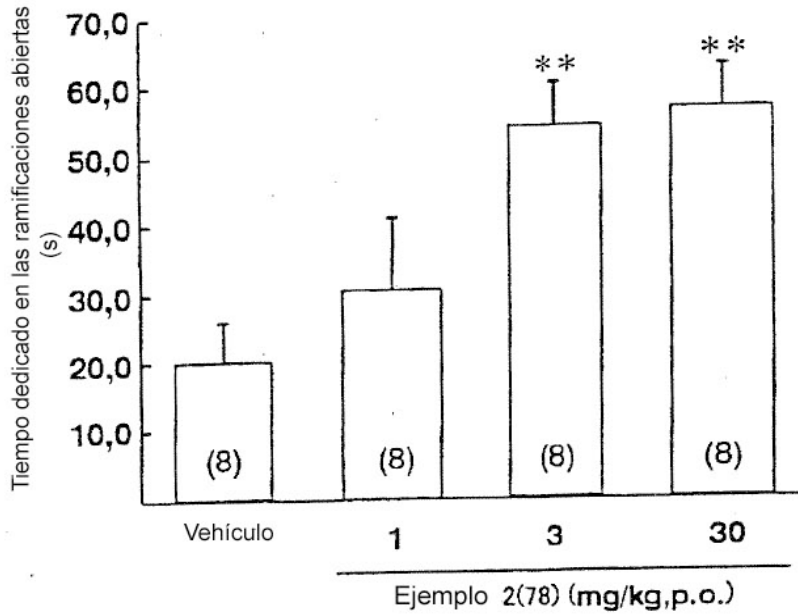
35 una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo como principio activo, con la condición de que el compuesto 8-(3-pentilamino)-2-metil-3-(2-cloro-4-metoxifenil)-6,7-dihidro-5H-ciclopenta[d]pirazolo[1,5-a]pirimidina esté excluido.

19. 40 Uso según la reivindicación 18, en el que las enfermedades inducidas por la secreción extraordinaria de factor de liberación de corticotropina se seleccionan del grupo que consiste en depresión, depresión de episodio único, depresión recurrente, depresión puerperal, depresión inducida por abusos a menores, ansiedad, trastornos relacionados con la ansiedad (trastorno de pánico, fobia particular, miedo a caer, fobia social, trastorno obsesivo compulsivo), trastorno emocional, trastorno bipolar, trastorno de estrés postraumático, úlcera péptica, diarrea, estreñimiento, síndrome del intestino irritable, enfermedad inflamatoria del intestino (colitis ulcerosa, enfermedad de Crohn), alteración gastrointestinal inducida por

5 estrés, vómito nervioso, trastorno alimenticio (anorexia nerviosa, bulimia nerviosa), obesidad, trastorno del sueño inducido por estrés, trastorno del sueño inducido por dolor de fibra muscular, inmunosupresión inducida por estrés, cefalea inducida por estrés, fiebre inducida por estrés, dolor inducido por estrés, estrés posoperatorio, artritis reumatoide, osteoartritis, osteoporosis, psoriasis, disfunción tiroidea, uveítis, asma, trastorno inducido por hormona antidiarreica inapropiada, dolor, inflamación, enfermedad alérgica, lesión de la cabeza, lesión de la médula espinal, lesión neuronal isquémica, lesión neuronal por toxicidad, enfermedad de Cushing, convulsiones, espasmos, espasmos musculares, epilepsia, enfermedad isquémica, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Huntington, incontinencia urinaria, enfermedad de Alzheimer, demencia senil tipo Alzheimer, demencia vascular, esclerosis lateral amiotrófica, hipoglucemia, enfermedades relacionadas al corazón o cardiovasculares (hipertensión, taquicardia, insuficiencia cardiaca congestiva), drogadicción o síndrome de dependencia al alcohol.

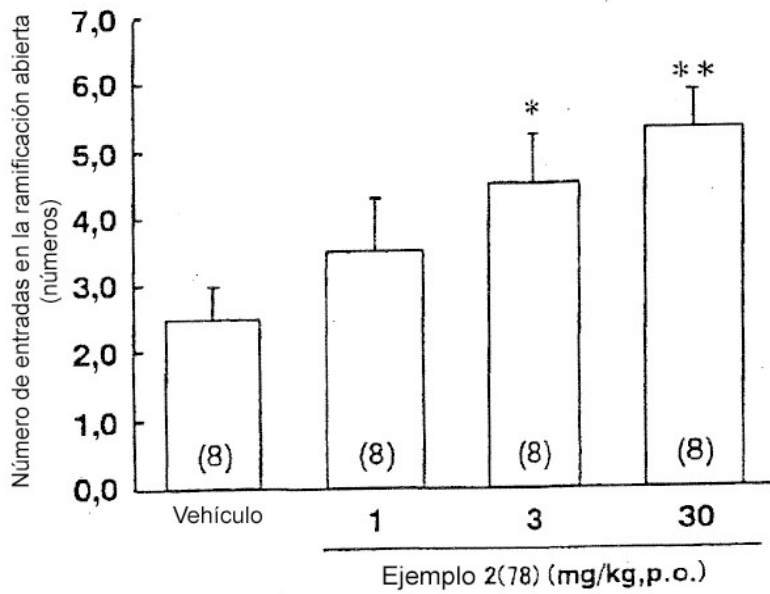
10

Figura 1



**p<0,01 (Prueba de U de Mann Whitney)

Figura 2



*p<0,05, **p<0,01
(Prueba de U de Mann Whitney)