

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 371 277**

51 Int. Cl.:  
**C07D 307/66** (2006.01)  
**C07D 233/88** (2006.01)  
**C07D 277/42** (2006.01)  
**C07D 285/12** (2006.01)  
**A61K 31/495** (2006.01)  
**A61K 31/41** (2006.01)  
**A61P 29/00** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **06829854 .6**  
96 Fecha de presentación: **22.12.2006**  
97 Número de publicación de la solicitud: **1968963**  
97 Fecha de publicación de la solicitud: **17.09.2008**

54 Título: **AMIDAS DE ÁCIDO PROPIÓLICO SUSTITUIDAS Y SU UTILIZACIÓN PARA LA PRODUCCIÓN DE ANALGÉSICOS.**

30 Prioridad:  
**28.12.2005 DE 102005062986**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**29.12.2011**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**29.12.2011**

73 Titular/es:  
**GRÜNENTHAL GMBH  
ZIEGLERSTRASSE 6  
52078 AACHEN, DE**

72 Inventor/es:  
**HAURAND, Michael;  
SCHIENE, Klaus;  
KÜHNERT, Sven;  
REICH, Melanie y  
ZEMOLKA, Saskia**

74 Agente: **Aznárez Urbietta, Pablo**

ES 2 371 277 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**

Amidas de ácido propiólico sustituidas y su utilización para la producción de analgésicos.

La presente invención se refiere a amidas de ácido propiólico sustituidas, a procedimientos para su preparación, a medicamentos que contienen estos compuestos y a su utilización para la producción de medicamentos.

5 El dolor forma parte de los síntomas clínicos básicos. Existe una necesidad mundial de terapias eficaces contra el dolor. La necesidad de una acción urgente para lograr un tratamiento satisfactorio para el paciente y selectivo de estados de dolor crónicos y no crónicos, debiendo entenderse con ello un tratamiento del dolor eficaz y satisfactorio para el paciente, se pone de manifiesto en la gran cantidad de trabajos científicos que han aparecido últimamente en el campo de la analgesia aplicada o de la investigación fundamental sobre la nocicepción.

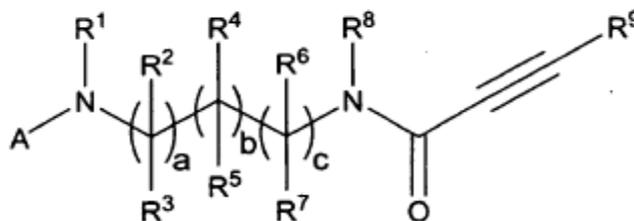
10 Los opioides clásicos, por ejemplo la morfina, son eficaces para la terapia de dolores severos a muy severos. Sin embargo, frecuentemente presentan efectos secundarios no deseables, por ejemplo depresión respiratoria, vómitos, sedación, estreñimiento o desarrollo de tolerancia. Además, a menudo no son lo suficientemente eficaces en caso de dolor neuropático, padecido en particular por pacientes tumorales.

15 Los documentos WO 2005/016323 y WO 2004/014903 dan a conocer amidas de ácido propiólico. Los documentos WO 2004/029044 y WO 03/093236 dan a conocer otras amidas de ácido propiólico adecuadas como analgésicos.

Por ello, un objetivo de la presente invención consistía en poner a disposición nuevos compuestos que fueran particularmente adecuados como principios activos farmacéuticos en medicamentos, preferentemente en medicamentos para el tratamiento del dolor.

20 Sorprendentemente se ha comprobado que las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I mostrada más abajo son adecuadas para la regulación de los receptores mGluR5 y, en consecuencia, se pueden utilizar en particular como principios activos farmacéuticos en medicamentos para la profilaxis y/o el tratamiento de trastornos o enfermedades relacionados con estos receptores o procesos.

Por consiguiente, un objeto de la presente invención consiste en amidas de ácido propiólico sustituidas de fórmula general I,

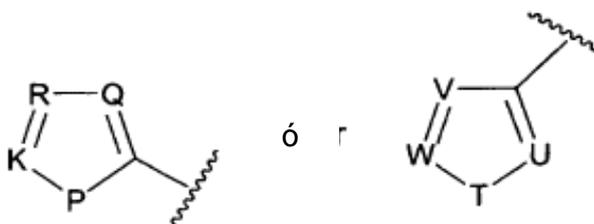


I,

25 donde

a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 1, 2 o 3;

A representa uno de los siguientes grupos



- 30 Q y U representan en cada caso CR<sup>10</sup> o N;
- R y V representan en cada caso CR<sup>11</sup> o N;
- K y W representan en cada caso CR<sup>12</sup> o N;
- P y T representan en cada caso O, S o NR<sup>13</sup>;

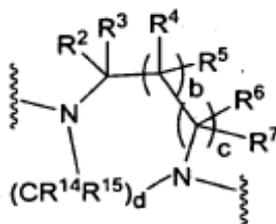
quedando excluidos los compuestos en los que P representa S, Q representa N, R representa CR<sup>11</sup> y K representa CR<sup>12</sup> o N;

R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)-heterocicloalquilo, -(alquenilen)-heterocicloalquilo, -(alquinilen)-heterocicloalquilo, -(alquilen)-heterocicloalquenilo, -(alquenilen)-heterocicloalquenilo o -(alquinilen)-heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)-heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)-heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)-heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)-heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; heteroarilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)-arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)-heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido o no sustituido;

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>, R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup>, R<sup>25</sup>, R<sup>26</sup> y R<sup>27</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -NO<sub>2</sub>; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -NH-C(=O)-H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; -NH-R<sup>35</sup>; -NR<sup>36</sup>R<sup>37</sup>; -O-C(=O)-R<sup>38</sup>; -NH-C(=O)-R<sup>39</sup>; -NR<sup>40</sup>-C(=O)-R<sup>41</sup>; -O-R<sup>42</sup>; -S-R<sup>43</sup>; -NH-C(=O)-NH-R<sup>44</sup>; -NH-C(=S)-NH-R<sup>45</sup>; -NH-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>46</sup>; -NR<sup>47</sup>-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>48</sup>; alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)-cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)-cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)heterocicloalquilo, -(alquenilen)-heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)-heterocicloalquenilo o -(alquinilen)heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(heteroalquilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; arilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)-arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)-heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido;

o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup>, o R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup>, o R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup>, o R<sup>14</sup> y R<sup>15</sup>, o R<sup>16</sup> y R<sup>17</sup>, o R<sup>18</sup> y R<sup>19</sup>, o R<sup>20</sup> y R<sup>21</sup>, o R<sup>22</sup> y R<sup>23</sup>, o R<sup>24</sup> y R<sup>25</sup>, o R<sup>26</sup> y R<sup>27</sup>, independientemente entre sí, representan juntos en cada caso un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en un grupo oxo (=O) y un grupo tioxo (=S);

o R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>(CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>)<sub>b</sub>-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>c</sub> que los une, forman un grupo de fórmula general B,



B

donde d representa 1, 2 o 3, b representa 0 o 1 y c representa 0 o 1;

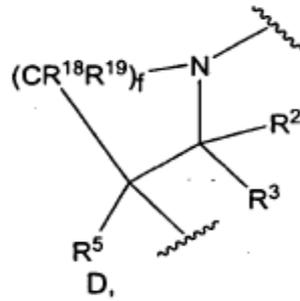
o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>3</sup> que los une, forman un grupo de fórmula general C,



C

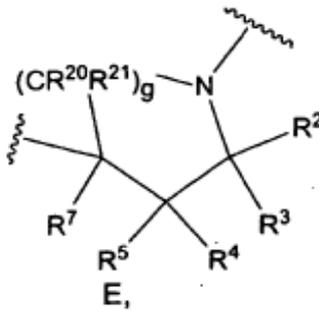
donde e representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, b representa 0 o 1 y c representa 0;

o  $R^1$  y  $R^4$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^5$  que los une, forman un grupo de fórmula general D,



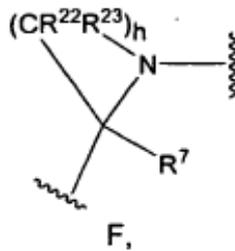
en la que f representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, c representa 0;

5 o  $R^1$  y  $R^6$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^4R^5-CR^7$  que los une, forman un grupo de fórmula general E,



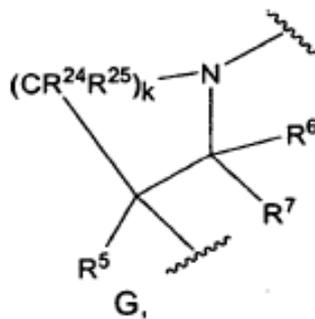
en la que g representa 1, 2 o 3;

o  $R^6$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^7$  que los une, forman un grupo de fórmula general F,



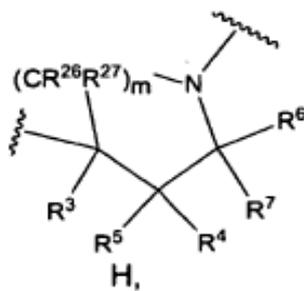
10 en la que h representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, b representa 0 o 1 y a representa 0;

o  $R^4$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^6R^7-CR^5$  que los une, forman un grupo de fórmula general G,



en la que k representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, a representa 0;

o  $R^2$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^6R^7-CR^4R^5-CR^3$  que los une, forman un grupo de fórmula general H,



en la que m representa 1, 2 o 3;

R<sup>9</sup> representa arilo sustituido o no sustituido o heteroarilo sustituido o no sustituido;

R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> y R<sup>12</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -NO<sub>2</sub>; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -NH-C(=O)-H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; -NH-R<sup>35</sup>; -NR<sup>36</sup>R<sup>37</sup>; -O-C(=O)-R<sup>38</sup>; -NH-C(=O)-R<sup>39</sup>; -NR<sup>40</sup>-C(=O)-R<sup>41</sup>; -O-R<sup>42</sup>; -S-R<sup>43</sup>; -NH-C(=O)-NH-R<sup>44</sup>; -NH-C(=S)-NH-R<sup>45</sup>; -NH-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>46</sup>; -NR<sup>47</sup>-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>48</sup>; alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)-cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)-cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)heterocicloalquilo, -(alquenilen)-heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)-heterocicloalquenilo o -(alquinilen)heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(heteroalquilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; arilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroarilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)-arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)-heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido;

R<sup>13</sup> representa H; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)-cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)-cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)heterocicloalquilo, -(alquenilen)-heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)-heterocicloalquenilo o -(alquinilen)heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(heteroalquilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; arilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroarilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)-arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)-heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido;

y R<sup>28</sup>, R<sup>29</sup>, R<sup>30</sup>, R<sup>31</sup>, R<sup>32</sup>, R<sup>33</sup>, R<sup>34</sup>, R<sup>35</sup>, R<sup>36</sup>, R<sup>37</sup>, R<sup>38</sup>, R<sup>39</sup>, R<sup>40</sup>, R<sup>41</sup>, R<sup>42</sup>, R<sup>43</sup>, R<sup>44</sup>, R<sup>45</sup>, R<sup>46</sup>, R<sup>47</sup> y R<sup>48</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)-heterocicloalquilo, -(alquenilen)-heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)heterocicloalquenilo o -(alquinilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; arilo sustituido o no sustituido; heteroarilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)-arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido o no sustituido;

refiriéndose el concepto "sustituido" en relación con los grupos "alquilo", "alquenilo", "alquinilo", "heteroalquilo", "heteroalquenilo" y "heteroalquinilo" a que el grupo correspondiente está sustituido de forma simple o múltiple con sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-fenilo), -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-fenilo), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-fenilo, -C(=S)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=S)-fenilo, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-O-fenilo, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub> y -SO<sub>3</sub>H, pudiendo estar sustituidos los grupos fenilo arriba mencionados ser en cada caso lineales o ramificados y pudiendo estar sustituidos los grupos fenilo arriba mencionados con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo ;

refiriéndose el concepto "sustituido" en relación con los grupos "cicloalquilo", "heterocicloalquilo", "cicloalquenilo" y "heterocicloalquenilo" a que el grupo correspondiente está sustituido de forma simple o múltiple con sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alquenilo(C<sub>2-5</sub>), -alquinilo(C<sub>2-5</sub>), -C=C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, oxo (=O), tioxo (=S), -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -N(H)(alquilo(C<sub>1-5</sub>)), -NO<sub>2</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-N(H)(alquilo(C<sub>1-5</sub>)) y fenilo, pudiendo los grupos alquilo(C<sub>1-5</sub>) arriba mencionados ser en cada caso lineales o ramificados y pudiendo cada uno de los grupos fenilo arriba mencionados no estar sustituido o estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alquenilo(C<sub>2-5</sub>), -alquinilo(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>) y -C(=O)-CF<sub>3</sub>;

refiriéndose el concepto "sustituido" en relación con los grupos "arilo" y "heteroarilo" a que el grupo correspondiente está sustituido de forma simple o múltiple con sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alquenilo(C<sub>2-5</sub>), -alquinilo(C<sub>2-5</sub>), -C=C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub>, -S-CH<sub>2</sub>F, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-O-fenilo, -C(=O)-H; -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-fenilo, -O-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-C(=O)-fenilo, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -C(=O)-NH-fenilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclohexilo, pirazolilo, fenilo, furilo (furanilo), tiadiazolilo, tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo), bencilo y fenetilo, pudiendo los grupos alquilo(C<sub>1-5</sub>) arriba mencionados ser en cada caso lineales o ramificados y pudiendo los sustituyentes cíclicos o los grupos cíclicos de estos sustituyentes estar sustituidos a su vez en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alquenilo(C<sub>2-5</sub>), -alquinilo(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -OCHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub> y -S-CH<sub>2</sub>F;

refiriéndose el concepto "sustituido" en relación con los grupos "alquilenilo", "alquenilenilo", "alquinilenilo", "heteroalquilenilo" y "heteroalquenilenilo" a que el grupo correspondiente está sustituido de forma simple o múltiple con sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en fenilo, F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -SH, -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -NH<sub>2</sub>, -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -NH-fenilo, -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-fenilo), -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-fenilo), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-fenilo, -C(=S)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=S)-fenilo, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-O-fenilo, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub> y -SO<sub>3</sub>H, pudiendo los grupos alquilo(C<sub>1-5</sub>) arriba mencionados ser en cada caso lineales o ramificados y pudiendo estar sustituidos los grupos fenilo arriba mencionados con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alquenilo(C<sub>2-5</sub>), -alquinilo(C<sub>2-5</sub>), -C=C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub> y -S-CH<sub>2</sub>F;

en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

En el sentido de la presente invención, el concepto "alquilo" incluye grupos hidrocarburo saturados acíclicos que pueden ser ramificados o de cadena lineal y que pueden estar sustituidos al menos de forma simple o no estar sustituidos, de 1 a 12 (es decir, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12) átomos de C, como en el caso del alquilo(C<sub>1-12</sub>), o 1 a 6 (es decir, 1, 2, 3, 4, 5 o 6) átomos de C, como en el caso del alquilo(C<sub>1-6</sub>). Si uno o más de los sustituyentes representan un grupo alquilo o presentan un grupo alquilo sustituido de forma simple o múltiple, éste está sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5, de forma especialmente preferente por 1, 2 o 3 sustituyentes, seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -N(alquil(C<sub>1-</sub>

5)) $(\text{CH}_2\text{-fenilo})$ ,  $-\text{N}(\text{alquilo}(\text{C}_{1-5}))(\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-fenilo})$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-H}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-fenilo}$ ,  $-\text{C}(=\text{S})\text{-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{C}(=\text{S})\text{-fenilo}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-OH}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-O-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-O-fenilo}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-NH}_2$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-NH-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-N}(\text{alquilo}(\text{C}_{1-5}))_2$ ,  $-\text{S}(=\text{O})\text{-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{S}(=\text{O})\text{-fenilo}$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2\text{-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2\text{-fenilo}$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2\text{-NH}_2$  y  $-\text{SO}_3\text{H}$ , pudiendo los grupos alquilo $(\text{C}_{1-5})$  arriba mencionados ser en cada caso lineales o ramificados y pudiendo estar sustituidos los grupos fenilo arriba mencionados preferentemente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{O-CF}_3$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{O-CH}_3$ ,  $-\text{O-C}_2\text{H}_5$ ,  $-\text{O-C}_3\text{H}_7$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo. Algunos sustituyentes especialmente preferentes se pueden seleccionar, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$  y  $-\text{N}(\text{CH}_3)(\text{C}_2\text{H}_5)$ .

10 Como ejemplos de grupos alquilo $(\text{C}_{1-12})$  adecuados que pueden estar sustituidos de forma simple o múltiple o no estar sustituidos se mencionan: metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, 2-pentilo, 3-pentilo, isopentilo, neopentilo, n-hexilo, 2-hexilo, 3-hexilo, n-heptilo, n-octilo,  $-\text{C}(\text{H})(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ ,  $-\text{C}(\text{H})(\text{n-C}_3\text{H}_7)_2$  y  $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C}(\text{H})(\text{CH}_3)\text{-(CH}_2)_3\text{-CH}_3$ . Como ejemplos de grupos alquilo $(\text{C}_{1-6})$  adecuados se mencionan: metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, 2-pentilo, 3-pentilo, isopentilo, neopentilo, n-hexilo, 2-hexilo y 3-hexilo.

15 Por el concepto "grupos alquilo sustituidos de forma múltiple" se han de entender aquellos grupos alquilo que están sustituidos de forma múltiple, preferentemente doble o triple, en átomos de C iguales o diferentes, por ejemplo de forma triple en el mismo átomo de C, como en el caso del  $-\text{CF}_3$ , o en lugares diferentes, como en el caso del  $-(\text{CHCl})\text{-(CH}_2\text{F)}$ . La sustitución múltiple puede tener lugar con el mismo sustituyente o con sustituyentes diferentes. Como ejemplos de grupos alquilo sustituidos adecuados se mencionan:  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{CF}_2\text{H}$ ,  $-\text{CFH}_2$ ,  $-(\text{CH}_2)\text{-OH}$ ,  $-(\text{CH}_2)\text{-NH}_2$ ,  $-(\text{CH}_2)\text{-CN}$ ,  $-(\text{CH}_2)\text{-(CF}_3)$ ,  $-(\text{CH}_2)\text{-(CHF}_2)$ ,  $-(\text{CH}_2)\text{-(CH}_2\text{F)}$ ,  $-(\text{CH}_2)\text{-(CH}_2)\text{-OH}$ ,  $-(\text{CH}_2)\text{-(CH}_2)\text{-NH}_2$ ,  $-(\text{CH}_2)\text{-(CH}_2)\text{-CN}$ ,  $-(\text{CF}_2)\text{-(CF}_3)$ ,  $-(\text{CH}_2)\text{-(CH}_2)\text{-(CF}_3)$  y  $-(\text{CH}_2)\text{-(CH}_2)\text{-(CH}_2)\text{-OH}$ .

20 En el sentido de la presente invención, el concepto "alqueno" incluye grupos hidrocarburo insaturados acíclicos que pueden ser ramificados o de cadena lineal, que pueden estar sustituidos al menos de forma simple o no estar sustituidos, y que presentan al menos un enlace doble, preferentemente 1, 2 o 3 enlaces dobles, de 2 a 12 (es decir, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12) átomos de C, como en el caso del alqueno $(\text{C}_{2-12})$ , o 2 a 6 (es decir, 2, 3, 4, 5 o 6) átomos de C, como en el caso del alqueno $(\text{C}_{2-6})$ . Si uno o más de los sustituyentes representan un grupo alqueno o presentan un grupo alqueno sustituido de forma simple o múltiple, éste está sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5, de forma especialmente preferente con 1, 2 o 3 sustituyentes, seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{N}(\text{alquilo}(\text{C}_{1-5}))_2$ ,  $-\text{N}(\text{alquilo}(\text{C}_{1-5}))(\text{fenilo})$ ,  $-\text{N}(\text{alquilo}(\text{C}_{1-5}))(\text{CH}_2\text{-fenilo})$ ,  $-\text{N}(\text{alquilo}(\text{C}_{1-5}))(\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-fenilo})$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-H}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-fenilo}$ ,  $-\text{C}(=\text{S})\text{-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{C}(=\text{S})\text{-fenilo}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-OH}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-O-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-O-fenilo}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-NH}_2$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-NH-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-N}(\text{alquilo}(\text{C}_{1-5}))_2$ ,  $-\text{S}(=\text{O})\text{-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{S}(=\text{O})\text{-fenilo}$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2\text{-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2\text{-fenilo}$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2\text{-NH}_2$  y  $-\text{SO}_3\text{H}$ , pudiendo los grupos alquilo $(\text{C}_{1-5})$  arriba mencionados ser en cada caso lineales o ramificados y pudiendo estar sustituidos los grupos fenilo arriba mencionados preferentemente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{O-CF}_3$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{O-CH}_3$ ,  $-\text{O-C}_2\text{H}_5$ ,  $-\text{O-C}_3\text{H}_7$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo. Algunos sustituyentes especialmente preferentes se pueden seleccionar, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$  y  $-\text{N}(\text{CH}_3)(\text{C}_2\text{H}_5)$ .

30 Como ejemplos de grupos alqueno $(\text{C}_{2-12})$  adecuados se mencionan: etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, hexenilo,  $-\text{CH}=\text{CH-CH}=\text{CH-CH}_3$  y  $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH}_2$ .

35 Por el concepto "grupos alqueno sustituidos de forma múltiple" se han de entender aquellos grupos alqueno que están sustituidos de forma múltiple, preferentemente doble, en átomos de C iguales o diferentes, por ejemplo de forma doble en el mismo átomo de C, como en el caso del  $-\text{CH}=\text{CCl}_2$ , o en lugares diferentes, como en el caso del  $-\text{CCl}=\text{CH}(\text{CH}_2)\text{-NH}_2$ . La sustitución múltiple puede tener lugar con el mismo sustituyente o con sustituyentes diferentes. Como ejemplos de grupos alqueno sustituidos adecuados se mencionan:  $-\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_2)\text{-OH}$ ,  $-\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_2)\text{-NH}_2$  y  $-\text{CH}=\text{CH-CN}$ .

40 En el sentido de la presente invención, el concepto "alquino" incluye grupos hidrocarburo insaturados acíclicos que pueden ser ramificados o de cadena lineal, que pueden estar sustituidos al menos de forma simple o no estar sustituidos, y que presentan al menos un enlace triple, preferentemente 1 o 2 enlaces triples, de 2 a 12 (es decir, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12) átomos de C, como en el caso del alquino $(\text{C}_{2-12})$ , o 2 a 6 (es decir, 2, 3, 4, 5 o 6) átomos de C, como en el caso del alquino $(\text{C}_{2-6})$ . Si uno o más de los sustituyentes representan un grupo alquino o presentan un grupo alquino sustituido de forma simple o múltiple, éste está sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5, de forma especialmente preferente en caso dado con 1 o 2 sustituyentes, seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{N}(\text{alquilo}(\text{C}_{1-5}))_2$ ,  $-\text{N}(\text{alquilo}(\text{C}_{1-5}))(\text{fenilo})$ ,  $-\text{N}(\text{alquilo}(\text{C}_{1-5}))(\text{CH}_2\text{-fenilo})$ ,  $-\text{N}(\text{alquilo}(\text{C}_{1-5}))(\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-fenilo})$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-H}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-fenilo}$ ,  $-\text{C}(=\text{S})\text{-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{C}(=\text{S})\text{-fenilo}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-OH}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-O-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-O-fenilo}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-NH}_2$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-NH-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{-N}(\text{alquilo}(\text{C}_{1-5}))_2$ ,  $-\text{S}(=\text{O})\text{-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{S}(=\text{O})\text{-fenilo}$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2\text{-alquilo}(\text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2\text{-fenilo}$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2\text{-NH}_2$  y  $-\text{SO}_3\text{H}$ , pudiendo los grupos alquilo $(\text{C}_{1-5})$  arriba mencionados ser en cada caso lineales o ramificados y pudiendo estar sustituidos los grupos fenilo arriba mencionados preferentemente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{O-CF}_3$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{O-CH}_3$ ,  $-\text{O-C}_2\text{H}_5$ ,  $-\text{O-C}_3\text{H}_7$ , metilo, etilo, n-

propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo. Algunos sustituyentes especialmente preferentes se pueden seleccionar, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -N(CH<sub>3</sub>)(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>).

5 Como ejemplos de grupos alquinilo(C<sub>2-12</sub>) adecuados se mencionan: etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo y hexinilo.

Por el concepto "grupos alquinilo sustituidos de forma múltiple" se han de entender aquellos grupos alquinilo que están sustituidos de forma múltiple en átomos de C diferentes, por ejemplo de forma doble en átomos de C diferentes, como en el caso del -CHCl-C≡CCl. Como ejemplos de grupos alquinilo sustituidos adecuados se mencionan: -C≡C-F, -C≡CCl y -C≡C-I.

10 El concepto "heteroalquilo" se refiere a un grupo alquilo tal como se describe más arriba en el que uno o más átomos de C han sido sustituidos en cada caso por un heterátomo seleccionado, independientemente entre sí, de entre oxígeno, azufre y nitrógeno (NH). Los grupos heteroalquilo pueden presentar preferentemente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembros de la cadena. Los grupos heteroalquilo pueden tener preferentemente de 2 a 12 miembros, de forma  
15 especialmente preferente de 2 a 6 miembros.

Como ejemplos de grupos heteroalquilo adecuados que pueden estar sustituidos de forma simple o múltiple o no estar sustituidos se mencionan: -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-NH-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>2</sub>-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>2</sub>-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>2</sub>-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-CH<sub>2</sub>-S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-NH-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>2</sub>-NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-C(H)(CH<sub>3</sub>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CH<sub>3</sub>.

20  
25 Como ejemplos de grupos heteroalquilo sustituidos adecuados se mencionan: -(CH<sub>2</sub>)-O-(CF<sub>3</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-O-(CHF<sub>2</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-O-(CH<sub>2</sub>F), -(CH<sub>2</sub>)-S-(CF<sub>3</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-S-(CHF<sub>2</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-S-(CH<sub>2</sub>F), -(CH<sub>2</sub>)-(CH<sub>2</sub>)-O-(CF<sub>3</sub>), -(CF<sub>2</sub>)-O-(CF<sub>3</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-(CH<sub>2</sub>)-S-(CF<sub>3</sub>) y -(CH<sub>2</sub>)-(CH<sub>2</sub>)-(CH<sub>2</sub>)-O-(CF<sub>3</sub>).

El concepto "heteroalqueno" se refiere a un grupo alqueno tal como se describe más arriba en el que uno o más átomos de C han sido sustituidos en cada caso por un heterátomo seleccionado, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH). Los grupos heteroalqueno pueden presentar preferentemente  
30 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembros de la cadena. Los grupos heteroalqueno pueden tener preferentemente de 2 a 12 miembros, de forma especialmente preferente de 2 a 6 miembros.

Como ejemplos de grupos heteroalqueno adecuados se mencionan: -CH<sub>2</sub>-O-CH=CH<sub>2</sub>, -CH=CH-O-CH=CH-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH=CH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-S-CH=CH<sub>2</sub>, -CH=CH-S-CH=CH-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-S-CH=CH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-NH-CH=CH<sub>2</sub>, -CH=CH-NH-CH=CH-CH<sub>3</sub> y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-NH-CH=CH<sub>2</sub>.  
35

Como ejemplos de grupos heteroalqueno sustituidos adecuados se mencionan: -CH<sub>2</sub>-O-CH=CH-(CH<sub>2</sub>)-OH, -CH<sub>2</sub>-S-CH=CH-(CH<sub>2</sub>)-NH<sub>2</sub> y -CH<sub>2</sub>-NH-CH=CH-CN. El concepto "heteroalquino" se refiere a un grupo alquino tal como se describe más arriba en el que uno o más átomos de C han sido sustituidos en cada caso por un heterátomo seleccionado, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH). Los grupos heteroalquino pueden presentar preferentemente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembros de la cadena. Los grupos heteroalquino pueden tener preferentemente de 2 a 12 miembros, de forma especialmente preferente de 2 a 6 miembros.  
40

Como ejemplos de grupos heteroalquino adecuados se mencionan: -CH<sub>2</sub>-O-C≡CH, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-C≡CH, -CH<sub>2</sub>-O-C≡CCH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-C≡C-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-S-C≡CH, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-S-C≡CH, -CH<sub>2</sub>-S-C≡C-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-S-C≡C-CH<sub>3</sub>.  
45

Como ejemplos de grupos heteroalquino sustituidos adecuados se mencionan: -CH<sub>2</sub>-O-C≡C-Cl, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-C≡C-I, -CHF-O-C≡C-CH<sub>3</sub>, -CHF-CH<sub>2</sub>-O-C≡C-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-S-C≡C-Cl, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-S-C≡C-Cl, -CHF-S-C≡C-CH<sub>3</sub>, -CHF-CH<sub>2</sub>-S-C≡C-CH<sub>3</sub>.  
50

En el sentido de la presente invención, el concepto "cicloalquilo" significa un grupo hidrocarburo saturado cíclico preferentemente de 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9 átomos de C, de forma especialmente preferente de 3, 4, 5, 6 o 7 átomos de C, de forma totalmente preferente de 5 o 6 átomos de C, pudiendo el grupo estar sustituido de forma simple o múltiple, igual o diferente, o no estar sustituido.  
55

Como ejemplos de grupos cicloalquilo(C<sub>3-9</sub>) adecuados que pueden estar sustituidos de forma simple o múltiple o no estar sustituidos se mencionan: ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo y ciclónonilo. Como grupos cicloalquilo(C<sub>3-7</sub>) adecuados se mencionan: ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo y cicloheptilo.

En el sentido de la presente invención, el concepto "cicloalqueno" significa un grupo hidrocarburo insaturado cíclico preferentemente de 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9 átomos de C, de forma especialmente preferente de 3, 4, 5, 6 o 7 átomos de C, de forma totalmente preferente de 5 o 6 átomos de C, que presenta al menos un enlace doble, preferentemente un enlace doble, y que puede estar sustituido de forma simple o múltiple, igual o diferente, o no estar sustituido.

- 5 Como grupos cicloalqueno(C<sub>3-9</sub>) adecuados que pueden estar sustituidos de forma simple o múltiple o no sustituidos se mencionan: ciclobutenilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, cicloheptenilo, ciclononenilo y ciclooctenilo. Como grupos cicloalqueno(C<sub>5-6</sub>) adecuados se mencionan: ciclopentenilo y ciclohexenilo.

10 En el sentido de la presente invención, el concepto "heterocicloalquilo" significa un grupo hidrocarburo saturado cíclico preferentemente de 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9 átomos de C, de forma especialmente preferente de 3, 4, 5, 6 o 7 átomos de C, de forma totalmente preferente de 5 o 6 átomos de C, en el que uno o más átomos de C han sido sustituidos en cada caso por un heterátomo seleccionado, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH). Los grupos heterocicloalquilo pueden presentar preferentemente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembros del anillo. El grupo heterocicloalquilo puede estar sustituido de forma simple o múltiple, igual o diferente, o no estar sustituido. Los grupos heterocicloalquilo pueden tener preferentemente de 3 a 9 miembros, de forma especialmente preferente de 3 a 7 miembros y de forma totalmente preferente de 5 a 7 miembros.

15 Como ejemplos de grupos heterocicloalquilo adecuados de 3 a 9 miembros, que pueden estar sustituidos de forma simple o múltiple o no estar sustituidos, se mencionan: imidazolidinilo, tetrahidrofurano, tetrahidrotiofeno, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo, piperazinilo, tiomorfolinilo, tetrahidropirano, oxetano, azepano, azocano, diazepano, ditiolano, (1,3)-dioxolano-2-ilo, isoxazolidinilo, isotiazolidinilo, pirazolidinilo, oxazolidinilo, (1,2,4)-oxadiazolidinilo, (1,2,4)-tiadiazolidinilo, (1,2,4)-triazolidin-3-ilo, (1,3,4)-tiadiazolidin-2-ilo, (1,3,4)-triazolidin-1-ilo, (1,3,4)-triazolidin-2-ilo, tetrahidropiridinilo, tetrahidropirimidinilo, tetrahidropirazinilo, (1,3,5)-tetrahidrotiazinilo, (1,2,4)-tetrahidrotiazin-1-ilo, (1,3)-ditiain-2-ilo y (1,3)-tiazolidinilo. Como ejemplos de grupos heterocicloalquilo adecuados de 5 a 7 miembros se mencionan: imidazolidinilo, tetrahidrofurano, tetrahidrotiofeno, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo, piperazinilo, tiomorfolinilo, tetrahidropirano, oxetano, azepano, diazepano y (1,3)-dioxolano-2-ilo.

20 En el sentido de la presente invención, el concepto "heterocicloalqueno" significa un grupo hidrocarburo insaturado cíclico preferentemente de 4, 5, 6, 7, 8 o 9 átomos de C, de forma especialmente preferente de 4, 5, 6 o 7 átomos de C, de forma totalmente preferente de 5 o 6 átomos de C, que presenta al menos un enlace doble, preferentemente un enlace doble, y en el que uno o más átomos de C han sido sustituidos en cada caso por un heterátomo seleccionado, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH). Los grupos heterocicloalqueno pueden presentar preferentemente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembros del anillo. El grupo heterocicloalqueno puede estar sustituido de forma simple o múltiple, igual o diferente, o no estar sustituido. Los grupos heterocicloalqueno pueden tener preferentemente de 4 a 9 miembros, de forma especialmente preferente de 4 a 7 miembros y de forma totalmente preferente de 5 a 7 miembros.

25 Como ejemplos de grupos heterocicloalqueno adecuados, o como ejemplos de grupos heterocicloalqueno adecuados de 5 a 7 miembros, que pueden estar sustituidos de forma simple o múltiple o no estar sustituidos, se mencionan: (2,3)-dihidrofurano, (2,5)-dihidrofurano, (2,3)-dihidrotieno, (2,5)-dihidrotieno, (2,3)-dihidropirrolilo, (2,5)-dihidropirrolilo, (2,3)-dihidroisoxazolilo, (4,5)-dihidroisoxazolilo, (2,5)-dihidroisotiazolilo, (2,3)-dihidropirazolilo, (4,5)-dihidropirazolilo, (2,5)-dihidropirazolilo, (2,3)-dihidrooxazolilo, (4,5)-dihidrooxazolilo, (2,5)-dihidrooxazolilo, (2,3)-dihidrotiazolilo, (4,5)-dihidrotiazolilo, (2,5)-dihidrotiazolilo, (2,3)-dihidroimidazolilo, (4,5)-dihidroimidazolilo, (2,5)-dihidroimidazolilo, (3,4,5,6)-tetrahidropiridin-2-ilo, (1,2,5,6)-tetrahidropiridin-1-ilo, (1,2)-dihidropiridin-1-ilo, (1,4)-dihidropiridin-1-ilo, dihidropirano y (1,2,3,4)-tetrahidropiridin-1-ilo.

30 En el sentido de la presente invención, los grupos cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalqueno o heterocicloalqueno pueden estar condensados (anillados) con un sistema de anillo monocíclico o bicíclico sustituido al menos de forma simple o no sustituido. En el sentido de la presente invención, por el concepto "sistema de anillo monocíclico o bicíclico" se entienden grupos hidrocarburo monocíclicos o bicíclicos que pueden ser saturados o insaturados o aromáticos, y que en caso dado pueden presentar uno o más heteroátomos como miembros del anillo. Preferentemente, los anillos de los sistemas de anillo monocíclicos o bicíclicos arriba mencionados tienen en cada caso 4, 5 o 6 miembros y en cada caso pueden presentar preferentemente dado el caso 0, 1, 2, 3, 4 o 5 heteroátomos, de forma especialmente preferente dado el caso 0, 1 o 2 heteroátomos, como miembros del anillo seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, nitrógeno y azufre. En caso de presencia de un sistema de anillo bicíclico, los diferentes anillos pueden presentar, en cada caso independientemente entre sí, un grado de saturación diferente, es decir, ser saturados o insaturados o aromáticos.

35 Cuando uno o más de los sustituyentes presentan un sistema de anillo monocíclico o bicíclico sustituido de forma simple o múltiple, éste puede estar sustituido preferentemente en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5, de forma especialmente preferente en caso dado con 1, 2 o 3, sustituyentes que se pueden seleccionar, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, oxo (=O), tioxo (=S), -C(=O)-OH, alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquino(C<sub>2-5</sub>), -C=C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C=C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-

5 CHF<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), N(alquilo(C<sub>1-5</sub>)(alquilo(C<sub>1-5</sub>))), -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-fenilo, -O-C(=O)-fenilo, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, pirazolilo, fenilo, furilo (furanilo), tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo) y bencilo, pudiendo los grupos alquilo(C<sub>1-5</sub>) arriba mencionados ser en cada caso lineales o ramificados y pudiendo los sustituyentes cíclicos o los grupos cíclicos de estos sustituyentes estar sustituidos a su vez en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5, preferentemente en caso dado con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquino(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>) y -C(=O)-CF<sub>3</sub>.

10 De forma especialmente preferente, los sustituyentes se pueden seleccionar, en cada caso independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neopentilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, oxo (=O), -C(=O)-OH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)-CH<sub>3</sub>, -S(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub>, -S-CH<sub>2</sub>F, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, pirazolilo, fenilo, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-fenilo, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-H, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C(=O)-fenilo, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, fenilo, furilo (furanilo), tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo) y bencilo, pudiendo los sustituyentes cíclicos o los grupos cíclicos de estos sustituyentes estar sustituidos a su vez en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5, preferentemente en caso dado con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>) y -C(=O)-CF<sub>3</sub>.

25 Como ejemplos de grupos cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalqueno o heterocicloalqueno adecuados que pueden estar sustituidos de forma simple o múltiple o no estar sustituidos, y que están condensados con un sistema de anillo monocíclico o bicíclico, se mencionan: (1,2,3,4)-tetrahidroquinolinilo, (1,2,3,4)-tetrahidroisoquinolinilo, (2,3)-dihidro-1H-isoindolilo, (1,2,3,4)-tetrahidronaftilo, (2,3)-dihidrobenczo[1.4]dioxinilo, benzo[1.3]dioxolilo, (3,4)-dihidro-2H-benzo[1.4]-oxazinilo y octahidropirrol[3,4-c]pirrolilo.

30 Cuando uno o más de los sustituyentes representan o presentan un grupo cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalqueno o heterocicloalqueno que puede estar sustituido de forma simple o múltiple, éste está sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5, de forma especialmente preferente en caso dado con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquino(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, oxo (=O), tioxo (=S), -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -N(H)(alquilo(C<sub>1-5</sub>)), -NO<sub>2</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-N(H)(alquilo(C<sub>1-5</sub>)) y fenilo, pudiendo los grupos alquilo(C<sub>1-5</sub>) arriba mencionados ser en cada caso lineales o ramificados y pudiendo los grupos fenilo en cada caso no estar sustituidos o estar sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, preferentemente con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquino(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>) y -C(=O)-CF<sub>3</sub>.

45 De forma especialmente preferente, los sustituyentes se pueden seleccionar, en cada caso independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -OH, oxo, tioxo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -(CH<sub>2</sub>)-O-CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)-CH<sub>3</sub>, -S(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-H, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -NH-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> y fenilo, pudiendo el grupo fenilo estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5, preferentemente 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>) y -C(=O)-CF<sub>3</sub>.

55 En el sentido de la presente invención, el concepto "arilo" significa un grupo hidrocarburo aromático monocíclico o policíclico, preferentemente monocíclico o bicíclico, preferiblemente de 6, 10 o 14 átomos de C. El grupo arilo puede estar sustituido de forma simple o múltiple, igual o diferente, o no estar sustituido. Como ejemplos de grupos arilo adecuados se mencionan: fenilo, 1-naftilo y antraceno. De forma especialmente preferente, el grupo arilo es un fenilo.

60 En el sentido de la presente invención, el concepto "heteroarilo" significa un grupo hidrocarburo aromático monocíclico o policíclico, preferentemente monocíclico, bicíclico o tricíclico, preferiblemente de 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13 o 14 átomos de C, de forma especialmente preferente de 5, 6, 9, 10, 13 o 14 átomos de C, de forma totalmente preferente de 5 o 6 átomos de C, en el que uno o más átomos de C han sido sustituidos en cada caso por un heterátomo seleccionado, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH). Los grupos heteroarilo

pueden presentar preferentemente 1, 2, 3, 4 o 5, de forma especialmente preferente 1, 2 o 3, heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembros del anillo. El grupo heteroarilo puede estar sustituido de forma simple o múltiple, igual o diferente, o no estar sustituido.

- 5 Como ejemplos de grupos heteroarilo adecuados se mencionan: indolizínico, bencimidazolilo, tetrazolilo, triazinilo, isoxazolilo, ftalazinilo, carbazolilo, carbolínico, diazananftilo, tienilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, pirazinilo, piranilo, triazolilo, piridinilo, imidazolilo, indolilo, isoindolilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzo[d]tiazolilo, benzodiazolilo, benzotriazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, isoxazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, indazolilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, quinolinilo, naftidinilo e isoquinolinilo.
- 10 Los grupos arilo o heteroarilo pueden estar condensados (anillados) con un sistema de anillo monocíclico o bicíclico en el sentido de la presente invención.

Como ejemplos de grupos arilo condensados con un sistema de anillo monocíclico o bicíclico se mencionan: (2,3)-dihidrobenzo[b]tiofenilo, (2,3)-dihidro-1H-indenilo, indolinilo, (2,3)-dihidrobencofuranilo, (2,3)-dihidrobenzo[d]oxazolilo, benzo[d][1,3]dioxolilo, benzo[d][1,3]oxatiolilo, isoindolinilo, (1,3)-dihidro-isobenzofuranilo, (1,3)-dihidrobenzo[c]tiofenilo, (1,2,3,4)-tetrahidroanftilo, (1,2,3,4)-tetrahidroquinolinilo, cromanilo, tiocromanilo, (1,2,3,4)-tetrahidroisoquinolinilo, (1,2,3,4)-tetrahidroquinoxalinilo, (3,4)-dihidro-2H-benzo[b][1,4]oxazinilo, (3,4)-dihidro-2H-benzo[b][1,4]tiazinilo, (2,3)-dihidrobenzo[b][1,4]dioxinilo, (2,3)-dihidrobenzo[b][1,4]oxatinilo, (6,7,8,9)-tetrahidro-5H-benzo[7]anulenilo, (2,3,4,5)-tetrahidro-1H-benzo[b]azepinilo y (2,3,4,5)-tetrahidro-1H-benzo[c]azepinilo. Si no se indica de otra manera y si uno o más de los sustituyentes representan un grupo arilo o heteroarilo o presentan un grupo arilo o heteroarilo sustituido de forma simple o múltiple, estos grupos arilo o heteroarilo pueden estar sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5, de forma especialmente preferente con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquínico(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub>, -S-CH<sub>2</sub>F, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-C(=O)-fenilo, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -C(=O)-NH-fenilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, pirazolilo, fenilo, furilo (furanilo), tiazolilo, tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo), bencilo y fenetilo, pudiendo los grupos alquilo(C<sub>1-5</sub>) arriba mencionados ser en cada caso lineales o ramificados y pudiendo los sustituyentes cíclicos o los grupos cíclicos de estos sustituyentes estar sustituidos a su vez en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5, preferentemente en caso dado con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquínico(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub> y -S-CH<sub>2</sub>F.

35 De forma especialmente preferente, los sustituyentes se pueden elegir, en cada caso independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neopentilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub>, -S-CH<sub>2</sub>F, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, pirazolilo, fenilo, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-fenilo, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-H, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C(=O)-fenilo, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-fenilo, -O-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -O-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-fenilo, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)-fenilo, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)-fenilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, fenilo, furilo (furanilo), tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo) y bencilo, pudiendo los sustituyentes cíclicos o los grupos cíclicos de estos sustituyentes estar sustituidos a su vez en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5, preferentemente en caso dado con 1, 2, 3 o 4, sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neopentilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub> y -S-CH<sub>2</sub>F.

De forma totalmente preferente, el grupo arilo sustituido se puede seleccionar de entre el grupo consistente en 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 2-fluorfenilo, 3-fluorfenilo, 4-fluorfenilo, 2-cianofenilo, 3-cianofenilo, 4-cianofenilo, 2-hidroxifenilo, 3-hidroxifenilo, 4-hidroxifenilo, 2-aminofenilo, 3-aminofenilo, 4-aminofenilo, 2-dimetilaminofenilo, 3-dimetilaminofenilo, 4-dimetilaminofenilo, 2-metilaminofenilo, 3-metilaminofenilo, 4-metilaminofenilo, 2-acetilfenilo, 3-acetilfenilo, 4-acetilfenilo, 2-metilsulfonilfenilo, 3-metilsulfonilfenilo, 4-metilsulfonilfenilo, 2-metilsulfonilfenilo, 3-metilsulfonilfenilo, 4-metilsulfonilfenilo, 2-metoxifenilo, 3-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2-etoxifenilo, 3-etoxifenilo, 4-etoxifenilo, 2-trifluorometilfenilo, 3-trifluorometilfenilo, 4-trifluorometilfenilo, 2-difluorometilfenilo, 3-difluorometilfenilo, 4-difluorometilfenilo, 2-fluorometilfenilo, 3-fluorometilfenilo, 4-fluorometilfenilo, 2-nitrofenilo, 3-nitrofenilo, 4-nitrofenilo, 2-etilfenilo, 3-etilfenilo, 4-etilfenilo, 2-propilfenilo, 3-propilfenilo, 4-propilfenilo, 2-isopropilfenilo, 3-isopropilfenilo, 4-isopropilfenilo, 2-terc-butilfenilo, 3-terc-butilfenilo, 4-terc-

5 butilfenilo, 2-carboxifenilo, 3-carboxifenilo, 4-carboxifenilo, 2-etenilfenilo, 3-etenilfenilo, 4-etenilfenilo, 2-etinilfenilo, 3-  
 etinilfenilo, 4-etinilfenilo, 2-alilfenilo, 3-alilfenilo, 4-alilfenilo, 2-trimetilsilaniletinil-fenilo, 3-trimetilsilaniletinil-fenilo, 4-  
 trimetilsilaniletinil-fenilo, 2-formilfenilo, 3-formilfenilo, 4-formilfenilo, 2-acetamino-fenilo, 3-acetamino-fenilo, 4-acetamino-  
 10 fenilo, 2-dimetilaminocarbonil-fenilo, 3-dimetilaminocarbonil-fenilo, 4-dimetilaminocarbonil-fenilo, 2-metoximetil-fenilo, 3-  
 metoximetil-fenilo, 4-metoximetil-fenilo, 2-etoximetil-fenilo, 3-etoximetil-fenilo, 4-etoximetil-fenilo, 2-aminocarbonil-fenilo,  
 3-aminocarbonil-fenilo, 4-aminocarbonil-fenilo, 2-metilaminocarbonil-fenilo, 3-metilaminocarbonil-fenilo, 4-  
 metilaminocarbonil-fenilo, 2-carboximetiléster-fenilo, 3-carboximetiléster-fenilo, 4-carboximetiléster-fenilo, 2-carboxietiléster-fenilo, 3-carboxietiléster-fenilo, 4-carboxietiléster-fenilo, 2-carboxi-terc-butiléster-fenilo, 3-carboxi-terc-  
 15 butiléster-fenilo, 4-carboxi-terc-butiléster-fenilo, 2-metilmercapto-fenilo, 3-metilmercapto-fenilo, 4-metilmercapto-fenilo, 2-  
 etilmercapto-fenilo, 3-etilmercapto-fenilo, 4-etilmercapto-fenilo, 2-bifenilo, 3-bifenilo, 4-bifenilo, 2-bromofenilo, 3-  
 bromofenilo, 4-bromofenilo, 2-yodofenilo, 3-yodofenilo, 4-yodofenilo, 2-trifluorometoxi-fenilo, 3-trifluorometoxi-fenilo, 4-  
 trifluorometoxi-fenilo, 2-fluor-3-trifluorometilfenilo, 2-fluor-4-metil-fenilo, (2,3)-difluorofenilo, (2,3)-dimetilfenilo, (2,3)-  
 20 diclorofenilo, 3-fluor-2-trifluorometilfenilo, (2,4)-diclorofenilo, (2,4)-difluorofenilo, 4-fluor-2-trifluorometilfenilo, (2,4)-  
 dimetoxifenilo, 2-cloro-4-fluorofenilo, 2-cloro-4-nitrofenilo, 2-cloro-4-metilfenilo, 2-cloro-5-trifluorometil-fenilo, 2-cloro-5-  
 15 metoxi-fenilo, 2-bromo-5-trifluorometil-fenilo, 2-bromo-5-metoxifenilo, (2,4)-dimetilfenilo, 2-fluor-4-  
 trifluorometil-fenilo, (2,5)-difluorofenilo, 2-fluor-5-trifluorometil-fenilo, 5-fluor-2-trifluorometil-fenilo, 5-cloro-2-trifluorometil-  
 fenilo, 5-bromo-2-trifluorometil-fenilo, (2,5)-dimetoxifenilo, (2,5)-bis-trifluorometil-fenilo, (2,5)-diclorofenilo, (2,5)-  
 dibromofenilo, 2-metoxi-5-nitrofenilo, 2-fluor-6-trifluorometil-fenilo, (2,6)-dimetoxifenilo, (2,6)-dimetilfenilo, (2,6)-  
 25 diclorofenilo, 2-cloro-6-fluorofenilo, 2-bromo-6-clorofenilo, 2-bromo-6-fluorofenilo, (2,6)-difluorofenilo, (2,6)-difluor-3-  
 metilfenilo, (2,6)-dibromofenilo, (2,6)-diclorofenilo, 3-cloro-2-fluorofenilo, 3-cloro-5-metilfenilo, (3,4)-diclorofenilo, (3,4)-  
 dimetilfenilo, 3-metil-4-metoxifenilo, 4-cloro-3-nitrofenilo, (3,4)-dimetoxifenilo, 4-fluor-3-trifluorometilfenilo, 3-fluor-4-  
 trifluorometil-fenilo, (3,4)-difluorofenilo, 3-ciano-4-fluorofenilo, 3-ciano-4-metilfenilo, 3-ciano-4-metoxifenilo, 3-bromo-4-  
 30 fluorofenilo, 3-bromo-4-metilfenilo, 3-bromo-4-metoxifenilo, 4-cloro-2-fluorofenilo, 4-cloro-3-trifluorometil-fenilo, 4-bromo-3-  
 metilfenilo, 4-bromo-5-metilfenilo, 3-cloro-4-fluorofenilo, 4-fluor-3-nitrofenilo, 4-bromo-3-nitrofenilo, (3,4)-dibromofenilo; 4-  
 25 cloro-3-metilfenilo, 4-bromo-3-metilfenilo, 4-fluor-3-metilfenilo, 3-fluor-4-metilfenilo, 3-fluor-5-metilfenilo, 2-fluor-3-  
 metilfenilo, 4-metil-3-nitrofenilo, (3,5)-dimetoxifenilo, (3,5)-dimetilfenilo, (3,5)-bis-trifluorometil-fenilo, (3,5)-difluorofenilo,  
 (3,5)-dinitrofenilo, (3,5)-diclorofenilo, 3-fluor-5-trifluorometil-fenilo, 5-fluor-3-trifluorometil-fenilo, (3,5)-dibromofenilo, 5-  
 cloro-4-fluorofenilo, 5-cloro-4-fluorofenilo, 5-bromo-4-metilfenilo, (2,3,4)-trifluorofenilo, (2,3,4)-triclorofenilo, (2,3,6)-  
 35 trifluorofenilo, 5-cloro-2-metoxifenilo, (2,3)-difluor-4-metilfenilo, (2,4,5)-trifluorofenilo, (2,4,5)-triclorofenilo, (2,4)-dicloro-5-  
 fluorofenilo, (2,4,6)-triclorofenilo, (2,4,6)-trimetilfenilo, (2,4,6)-trifluorofenilo, (2,4,6)-trimetoxifenilo, (3,4,5)-trimetoxifenilo,  
 (2,3,4,5)-tetrafluorofenilo, 4-metoxi-(2,3,6)-trimetilfenilo, 4-metoxi-(2,3,6)-trimetilfenilo, 4-cloro-2,5-dimetilfenilo, 2-cloro-6-  
 30 fluor-3-metilfenilo, 6-cloro-2-fluor-3-metilfenilo, (2,4,6)-trimetilfenilo y (2,3,4,5,6)-pentafluorofenilo.

De forma totalmente preferente, el grupo heteroarilo sustituido se puede seleccionar de entre el grupo consistente en 3-  
 35 metilpirid-2-ilo, 4-metilpirid-2-ilo, 5-metilpirid-2-ilo, 6-metilpirid-2-ilo, 2-metilpirid-3-ilo, 4-metilpirid-3-ilo, 5-metilpirid-3-ilo,  
 6-metilpirid-3-ilo, 2-metilpirid-4-ilo, 3-metilpirid-4-ilo, 3-fluoropirid-2-ilo, 4-fluoropirid-2-ilo, 5-fluoropirid-2-ilo, 6-fluoropirid-  
 2-ilo, 3-cloropirid-2-ilo, 4-cloropirid-2-ilo, 5-cloropirid-2-ilo, 6-cloropirid-2-ilo, 3-trifluorometil-pirid-2-ilo, 4-trifluorometil-  
 40 pirid-2-ilo, 5-trifluorometil-pirid-2-ilo, 6-trifluorometil-pirid-2-ilo, 3-metoxipirid-2-ilo, 4-metoxipirid-2-ilo, 5-metoxipirid-2-ilo,  
 6-metoxipirid-2-ilo, 4-metiliazol-2-ilo, 5-metiliazol-2-ilo, 4-trifluorometil-tiazol-2-ilo, 5-trifluorometil-tiazol-2-ilo, 4-  
 clorotiazol-2-ilo, 5-clorotiazol-2-ilo, 4-bromotiazol-2-ilo, 5-bromotiazol-2-ilo, 4-fluorotiazol-2-ilo, 5-fluorotiazol-2-ilo, 4-  
 cianotiazol-2-ilo, 5-cianotiazol-2-ilo, 4-metoxitiazol-2-ilo, 5-metoxitiazol-2-ilo, 4-metiloxazol-2-ilo, 5-metiloxazol-2-ilo, 4-  
 45 trifluorometil-oxazol-2-ilo, 5-trifluorometil-oxazol-2-ilo, 4-clorooxazol-2-ilo, 5-clorooxazol-2-ilo, 4-bromooxazol-2-ilo, 5-  
 bromooxazol-2-ilo, 4-fluorooxazol-2-ilo, 5-fluorooxazol-2-ilo, 4-cianooxazol-2-ilo, 5-cianooxazol-2-ilo, 4-metoxioxazol-2-  
 ilo, 5-metoxioxazol-2-ilo, 2-metil-(1,2,4)-tiadiazol-5-ilo, 2-trifluorometil-(1,2,4)-tiadiazol-5-ilo, 2-cloro-(1,2,4)-tiadiazol-5-ilo,  
 2-fluor-(1,2,4)-tiadiazol-5-ilo, 2-metoxi-(1,2,4)-tiadiazol-5-ilo, 2-ciano-(1,2,4)-tiadiazol-5-ilo, 2-metil-(1,2,4)-oxadiazol-5-ilo,  
 2-trifluorometil-(1,2,4)-oxadiazol-5-ilo, 2-cloro-(1,2,4)-oxadiazol-5-ilo, 2-fluor-(1,2,4)-oxadiazol-5-ilo, 2-metoxi-(1,2,4)-  
 50 oxadiazol-5-ilo y 2-ciano-(1,2,4)-oxadiazol-5-ilo.

En el sentido de la presente invención, el concepto "alquileo" incluye cadenas de hidrocarburos saturadas acíclicas que  
 55 unen un grupo arilo, heteroarilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalqueno o heterocicloalqueno con los  
 compuestos de fórmula general I o con otro sustituyente. Las cadenas alquileo pueden ser ramificadas o lineales y  
 pueden estar sustituidas al menos de forma simple o no estar sustituidas, de 1 a 12 (es decir, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10,  
 11 o 12) átomos de C, como en el caso del alquileo(C<sub>1-12</sub>), de 1 a 6 (es decir, 1, 2, 3, 4, 5 o 6) átomos de C, como en el  
 caso del alquileo(C<sub>1-6</sub>), o de 1 a 3 (es decir, 1, 2 o 3) átomos de C, como en el caso del alquileo(C<sub>1-3</sub>). Como ejemplos  
 se mencionan grupos alquileo(C<sub>1-6</sub>) tales como: -(CH<sub>2</sub>)-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -C(H)(CH<sub>3</sub>)-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-, -  
 (CH)(CH<sub>3</sub>)-, -C(H)(C(H)(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>)- y C(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)(H)-. Como ejemplos de grupos alquileo(C<sub>1-3</sub>) adecuados se mencionan -  
 (CH<sub>2</sub>)-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- y -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-.

En el sentido de la presente invención, el concepto "alqueniilo" incluye cadenas de hidrocarburos insaturadas acíclicas  
 60 que unen un grupo arilo, heteroarilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalqueno o heterocicloalqueno con los  
 compuestos de fórmula general I o con otro sustituyente. Las cadenas alqueniilo presentan al menos un enlace doble,  
 preferentemente 1, 2 o 3 enlaces dobles, y pueden ser ramificadas o lineales y pueden estar sustituidas al menos de  
 forma simple o no estar sustituidas, de 2 a 12 (es decir, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12) átomos de C, como en el caso  
 del alqueniilo(C<sub>2-12</sub>), de 2 a 6 (es decir, 2, 3, 4, 5 o 6) átomos de C, como en el caso del alqueniilo(C<sub>2-6</sub>), o de 2 a 3  
 (es decir, 2 o 3) átomos de C, como en el caso del alqueniilo(C<sub>2-3</sub>). Como ejemplos se mencionan grupos  
 alqueniilo(C<sub>2-3</sub>) tales como: -CH=CH- y -CH<sub>2</sub>-CH=CH-.

En el sentido de la presente invención, el concepto "alquinileno" incluye cadenas de hidrocarburos insaturadas acíclicas que unen un grupo arilo, heteroarilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalquenilo o heterocicloalquenilo con los compuestos de fórmula general I o con otro sustituyente. Las cadenas alquinileno presentan al menos un enlace triple, preferentemente 1 o 2 enlaces triples, y pueden ser ramificadas o lineales y pueden estar sustituidas al menos de forma simple o no estar sustituidas, de 2 a 12 (es decir, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12) átomos de C, como en el caso del alquinileno(C<sub>2-12</sub>), de 2 a 6 (es decir, 2, 3, 4, 5 o 6) átomos de C, como en el caso del alquinileno(C<sub>2-6</sub>), o de 2 a 3 (es decir, 2 o 3) átomos de C, como en el caso del alquinileno(C<sub>2-3</sub>). Como ejemplos se mencionan grupos alquinileno(C<sub>2-3</sub>) tales como: -C≡C- y -CH<sub>2</sub>-C≡C-.

El concepto "heteroalquileno" designa una cadena alquileno tal como se describe más arriba en la que uno o más átomos de C han sido sustituidos en cada caso por un heterátomo seleccionado, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH). Los grupos heteroalquileno pueden presentar preferentemente 1, 2 o 3 heteroátomos, de forma especialmente preferente un heteroátomo, seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembros de la cadena. Los grupos heteroalquileno pueden tener preferentemente de 2 a 12 miembros, de forma especialmente preferente de 2 a 6 miembros y de forma totalmente preferente 2 o 3 miembros.

Como ejemplos se mencionan grupos heteroalquileno tales como: -(CH<sub>2</sub>)-O-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-O-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-O-, -O-(CH<sub>2</sub>)-, -O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -O-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-, -O-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -C(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)(H)-O-, -O-C(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)(H)-, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-NH-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-NH- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>.

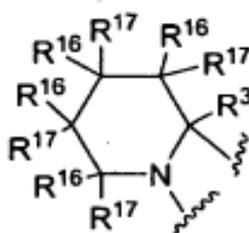
El concepto "heteroalquenileno" designa una cadena alquenileno tal como se describe más arriba en la que uno o más átomos de C han sido sustituidos en cada caso por un heterátomo seleccionado, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH). Los grupos heteroalquenileno pueden presentar preferentemente 1, 2 o 3 heteroátomos, de forma especialmente preferente un heteroátomo, seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembros de la cadena. Los grupos heteroalquenileno pueden tener preferentemente de 2 a 12 miembros, de forma especialmente preferente de 2 a 6 miembros y de forma totalmente preferente 2 o 3 miembros. Como ejemplos se mencionan grupos heteroalquenileno tales como: -CH=CH-NH-, -CH=CH-O- y -CH=CH-S-.

Cuando uno o más de los sustituyentes representan o presentan un grupo alquileno, alquenileno, alquinileno, heteroalquileno o heteroalquinileno que puede estar sustituido de forma simple o múltiple, éste está sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5, de forma especialmente preferente en caso dado con 1, 2 o 3, sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en fenilo, F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -SH, -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -NH<sub>2</sub>, -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -NH-fenilo, -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-fenilo), -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-fenilo), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-fenilo, -C(=S)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=S)-fenilo, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-O-fenilo, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub> y -SO<sub>3</sub>H, pudiendo los grupos alquilo(C<sub>1-5</sub>) arriba mencionados ser en cada caso lineales o ramificados y pudiendo estar sustituidos los grupos fenilo arriba mencionados con 1, 2, 3, 4 o 5, preferentemente con 1, 2, 3 o 4, sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alquenilo(C<sub>2-5</sub>), -alquinilo(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub> y -S-CH<sub>2</sub>F.

De forma especialmente preferente, los grupos alquileno, alquenileno, alquinileno, heteroalquileno o heteroalquinileno pueden estar sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en fenilo, F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -O-fenilo, -SH, -S-fenilo, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -N(CH<sub>3</sub>)(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>), pudiendo estar sustituido el grupo fenilo con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -OH, -SH, -NO<sub>2</sub>, -CN, -O-CH<sub>3</sub>, -O-CF<sub>3</sub> y -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>.

Cuando los compuestos de fórmula general I presentan varios sustituyentes seleccionados de entre el grupo consistente en R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>, R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup>, R<sup>25</sup>, R<sup>26</sup> y R<sup>27</sup> con la misma designación, cada uno de estos sustituyentes se puede seleccionar en cada caso independientemente de otros sustituyentes con la misma designación del sustituyente.

Por ejemplo, el siguiente grupo

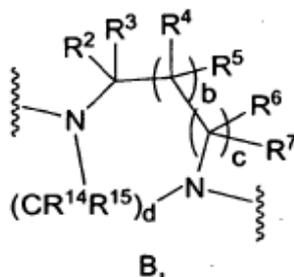




-(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido o no sustituido;

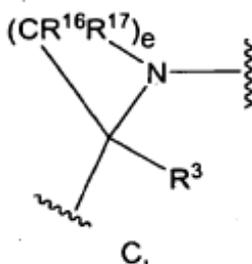
5 o  $R^2$  y  $R^3$ , o  $R^4$  y  $R^5$ , o  $R^6$  y  $R^7$ , o  $R^{14}$  y  $R^{15}$ , o  $R^{16}$  y  $R^{17}$ , o  $R^{18}$  y  $R^{19}$ , o  $R^{20}$  y  $R^{21}$ , o  $R^{22}$  y  $R^{23}$ , o  $R^{24}$  y  $R^{25}$ , o  $R^{26}$  y  $R^{27}$ , independientemente entre sí, representan juntos en cada caso un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en un grupo oxo (=O) y un grupo tioxo (=S);

o  $R^1$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-(CR^4R^5)_b-(CR^6R^7)_c$  que los une, forman un grupo de fórmula general B,



en la que d representa 1, 2 o 3, b representa 0 o 1 y c representa 0 o 1;

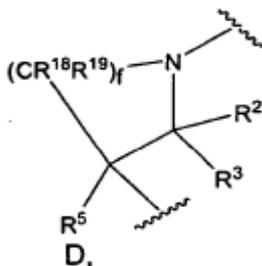
o  $R^1$  y  $R^2$ , junto con el grupo  $-N-CR^3$  que los une, forman un grupo de fórmula general C,



10

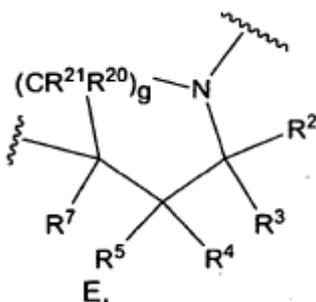
en la que e representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, b representa 0 o 1 y c representa 0;

o  $R^1$  y  $R^4$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^5$  que los une, forman un grupo de fórmula general D,



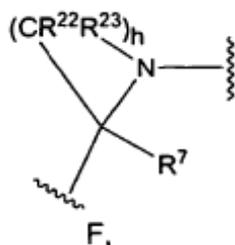
en la que f representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, c representa 0;

15 o  $R^1$  y  $R^6$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^4R^5-CR^7$  que los une, forman un grupo de fórmula general E,



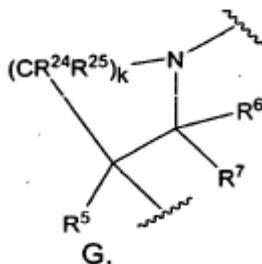
en la que g representa 1, 2 o 3;

o R<sup>6</sup> y R<sup>8</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>7</sup> que los une, forman un grupo de fórmula general F,



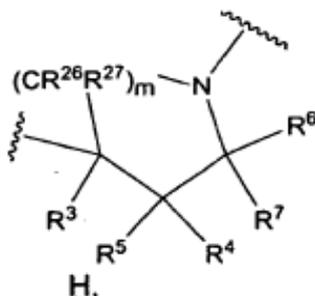
en la que h representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, b representa 0 o 1 y a representa 0;

5 o R<sup>4</sup> y R<sup>8</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>-CR<sup>5</sup> que los une, forman un grupo de fórmula general G,



en la que k representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, a representa 0;

o R<sup>2</sup> y R<sup>8</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>-CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>-CR<sup>3</sup> que los une, forman un grupo de fórmula general H,



10 en la que m representa 1, 2 o 3;

R<sup>9</sup> representa arilo sustituido o no sustituido o heteroarilo sustituido o no sustituido;

R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> y R<sup>12</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -NO<sub>2</sub>; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -NH-C(=O)-H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; -NH-R<sup>35</sup>; -NR<sup>36</sup>R<sup>37</sup>; -O-C(=O)-R<sup>38</sup>; -NH-C(=O)-R<sup>39</sup>; -NR<sup>40</sup>-C(=O)-R<sup>41</sup>; -O-R<sup>42</sup>; -S-R<sup>43</sup>; -NH-C(=O)-NH-R<sup>44</sup>; -NH-C(=S)-NH-R<sup>45</sup>; -NH-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>46</sup>; -NR<sup>47</sup>-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>48</sup>; alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)-cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)-cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)-cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)heterocicloalquilo, -(alquenilen)heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo o -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)heterocicloalquenilo o -(alquinilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)-heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)-heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; arilo sustituido o no sustituido; heteroarilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)-arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido o no sustituido;

R<sup>13</sup> representa H; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)-cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)heterocicloalquilo, -(alquenilen)heterocicloalquilo, -(alquinilen)-heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)heterocicloalquenilo o -(alquinilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)-heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)-heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; arilo sustituido o no sustituido; heteroarilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido o no sustituido;

y R<sup>28</sup>, R<sup>29</sup>, R<sup>30</sup>, R<sup>31</sup>, R<sup>32</sup>, R<sup>33</sup>, R<sup>34</sup>, R<sup>35</sup>, R<sup>36</sup>, R<sup>37</sup>, R<sup>38</sup>, R<sup>39</sup>, R<sup>40</sup>, R<sup>41</sup>, R<sup>42</sup>, R<sup>43</sup>, R<sup>44</sup>, R<sup>45</sup>, R<sup>46</sup>, R<sup>47</sup> y R<sup>48</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)-heterocicloalquilo, -(alquenilen)heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)heterocicloalquenilo o -(alquinilen)-heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; arilo sustituido o no sustituido; heteroarilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)-heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido o no sustituido;

y

los grupos alquilo arriba mencionados son en cada caso ramificados o lineales y presentan 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 átomos de carbono como miembros de la cadena; los grupos alquenilo arriba mencionados son en cada caso ramificados o lineales y presentan 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 átomos de carbono como miembros de la cadena; los grupos alquinilo arriba mencionados son en cada caso ramificados o lineales y presentan 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 átomos de carbono como miembros de la cadena; los grupos heteroalquilo, heteroalquenilo y heteroalquinilo arriba mencionados tienen en cada caso 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 miembros; los grupos heteroalquilo, heteroalquenilo y heteroalquinilo arriba mencionados presentan en cada caso opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno como miembros de la cadena;

los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo, heteroalquilo, heteroalquenilo y heteroalquinilo arriba mencionados pueden estar sustituidos en cada caso opcionalmente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-fenilo), -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-fenilo), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-fenilo, -C(=S)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=S)-fenilo, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-O-fenilo, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub> y -SO<sub>3</sub>H, pudiendo los grupos fenilo estar sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;

los grupos cicloalquilo arriba mencionados presentan en cada caso 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9 átomos de carbono como miembros del anillo;

los grupos cicloalquenilo arriba mencionados presentan en cada caso 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9 átomos de carbono como miembros del anillo;

los grupos heterocicloalquilo arriba mencionados tienen en cada caso 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9 miembros;

los grupos heterocicloalquenilo arriba mencionados tienen en cada caso 4, 5, 6, 7, 8 o 9 miembros;

los grupos heterocicloalquilo y heterocicloalquenilo arriba mencionados presentan en cada caso opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembros del anillo;

los grupos cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalquenilo o heterocicloalquenilo arriba mencionados pueden estar sustituidos en cada caso opcionalmente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de

entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquino(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, oxo (=O), tioxo (=S), -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -N(H)(alquilo(C<sub>1-5</sub>)), -NO<sub>2</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -NH-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-N(H)(alquilo(C<sub>1-5</sub>)) y fenilo, pudiendo los grupos fenilo en cada caso no estar sustituidos o estar sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquino(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-CF<sub>3</sub>, pudiendo los grupos fenilo arriba mencionados estar sustituidos preferentemente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;

los grupos alquilenos arriba mencionados son en cada caso ramificados o lineales y presentan 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 átomos de carbono como miembros de la cadena;

los grupos alquilenos arriba mencionados son en cada caso ramificados o lineales y presentan 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 átomos de carbono como miembros de la cadena;

los grupos alquilenos arriba mencionados son en cada caso ramificados o lineales y presentan 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 átomos de carbono como miembros de la cadena;

los grupos heteroalquilenos y heteroalquilenos arriba mencionados tienen en cada caso 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 miembros;

los grupos heteroalquilenos y heteroalquilenos arriba mencionados presentan en cada caso 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembros de la cadena;

los grupos alquilenos, alquilenos, alquilenos, heteroalquilenos o heteroalquilenos arriba mencionados pueden en cada caso no estar sustituidos o estar sustituidos en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en fenilo, F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -SH, -O-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, NH<sub>2</sub>, -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -NH-fenilo, -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-fenilo), -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-fenilo), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-fenilo, -C(=S)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=S)-fenilo, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-O-fenilo, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub> y -SO<sub>3</sub>H, pudiendo estar sustituidos los grupos fenilo con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquino(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub> y -S-CH<sub>2</sub>F; los grupos arilo arriba mencionados son monocíclicos o bicíclicos y presentan 6, 10 o 14 átomos de carbono;

los grupos heteroarilo arriba mencionados son monocíclicos, bicíclicos o tricíclicos y presentan 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13 o 14 miembros;

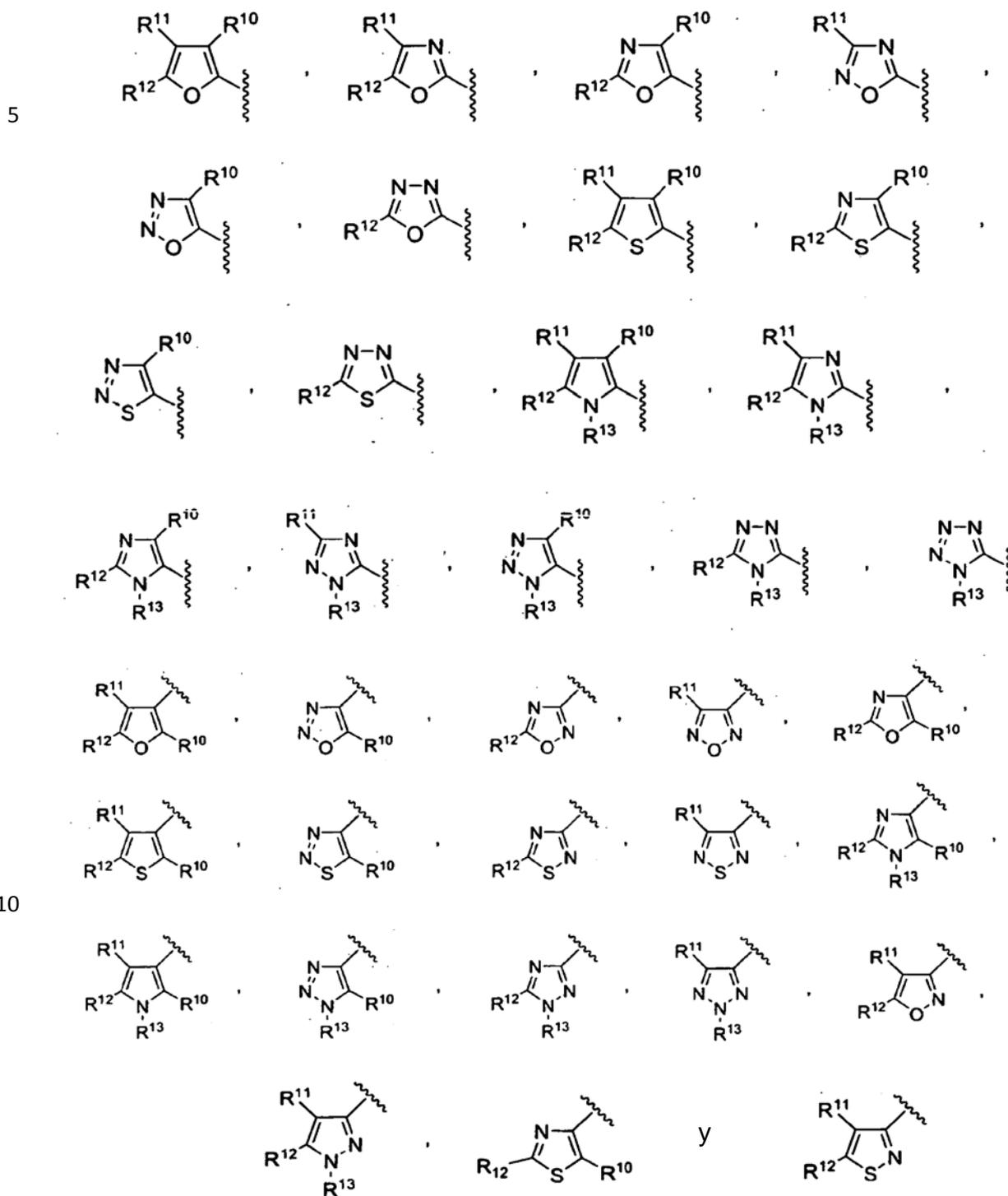
los grupos heteroarilo de 5 a 14 miembros arriba mencionados presentan en caso dado 1, 2, 3, 4 o 5 heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembros del anillo;

y los grupos arilo y heteroarilo arriba mencionados pueden estar sustituidos en cada caso opcionalmente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquino(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub>, -S-CH<sub>2</sub>F, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-O-fenilo, -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-fenilo, -O-C(=O)-fenilo, -O-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -C(=O)-NH-fenilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, pirazolilo, fenilo, furilo (furanilo), tiazolilo, tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo), bencilo y fenetilo, pudiendo los sustituyentes cíclicos o los grupos cíclicos de estos sustituyentes estar sustituidos a su vez en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquino(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub>, -S-CH<sub>2</sub>F;

en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o

diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

Son especialmente preferentes las amidas de ácido propiónico de la fórmula general I arriba mostrada en las que A representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



y los demás grupos tienen en cada caso el significado arriba mencionado, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

También son especialmente preferentes las amidas de ácido propiólico de la fórmula general I arriba mostrada, en las que

- 5  $R^1$  y  $R^8$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H;  $-C(=O)-R^{28}$ ;  $-C(=O)-O-R^{29}$ ;  $-C(=O)-NH_2$ ;  $-C(=O)-NH-R^{30}$ ;  $-C(=O)-NR^{31}R^{32}$ ;  $-S(=O)-R^{33}$ ;  $-S(=O)_2-R^{34}$ ; alquilo( $C_{1-6}$ ) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-SH$  y  $-NH_2$ ; cicloalquilo( $C_{3-8}$ ) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-SH$  y  $-NH_2$ ; o un grupo fenilo que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo( $C_{1-3}$ ), alquenileno( $C_{2-3}$ ) o alquinileno( $C_{2-3}$ ) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ ,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$  y  $-O-C_3H_7$ ;

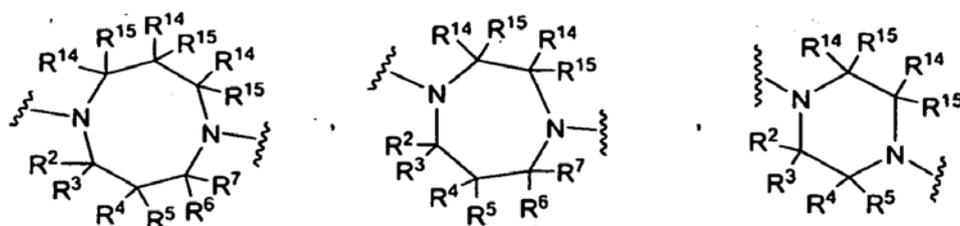
- 10 y los demás grupos tienen en cada caso el significado arriba mencionado, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

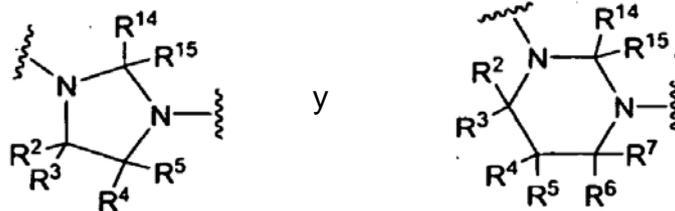
- 15 Además son especialmente preferentes las amidas de ácido propiólico de la fórmula general I arriba mostrada, en las que  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{18}$ ,  $R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$ ,  $R^{22}$ ,  $R^{23}$ ,  $R^{24}$ ,  $R^{25}$ ,  $R^{26}$  y  $R^{27}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I;  $-NO_2$ ;  $-CN$ ;  $-NH_2$ ;  $-OH$ ;  $-SH$ ;  $-C(=O)-OH$ ;  $-C(=O)-R^{28}$ ;  $-C(=O)-O-R^{29}$ ;  $-NH-R^{35}$ ;  $-NR^{36}R^{37}$ ;  $-O-R^{42}$ ;  $-S-R^{43}$ ; alquilo( $C_{1-6}$ ) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-SH$  y  $-NH_2$ ; cicloalquilo( $C_{3-7}$ ), cicloalquenilo( $C_{5-6}$ ), heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros o heterocicloalquenilo de 5 a 7 miembros, que puede estar unido en cada caso a través de un alquilenilo( $C_{1-3}$ ), alquenileno( $C_{2-3}$ ) o alquinileno( $C_{2-3}$ ) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ , oxo, tioxo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-NH_2$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NO_2$ ,  $-CF_3$ ,  $-O-CF_3$ ,  $-S-CF_3$ ,  $-SH$ ,  $-S-CH_3$  y  $-S-C_2H_5$ ; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, pirrolilo, indolilo, furanilo, benzo[b]furanilo, tiofenilo, benzo[b]tiofenilo, benzo[d]tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, isoxazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, piranilo, indazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo y quinazolinilo, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo( $C_{1-3}$ ), alquenileno( $C_{2-3}$ ) o alquinileno( $C_{2-3}$ ) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ ,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$  y  $-O-C_3H_7$ ;

- 20 o  $R^2$  y  $R^3$ , o  $R^4$  y  $R^5$ , o  $R^6$  y  $R^7$ , o  $R^{14}$  y  $R^{15}$ , o  $R^{16}$  y  $R^{17}$ , o  $R^{18}$  y  $R^{19}$ , o  $R^{20}$  y  $R^{21}$ , o  $R^{22}$  y  $R^{23}$ , o  $R^{24}$  y  $R^{25}$ , o  $R^{26}$  y  $R^{27}$ , independientemente entre sí, representan juntos en cada caso un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en un grupo oxo ( $=O$ ) y un grupo tioxo ( $=S$ );

- 25 y los demás grupos tienen en cada caso el significado arriba mencionado, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

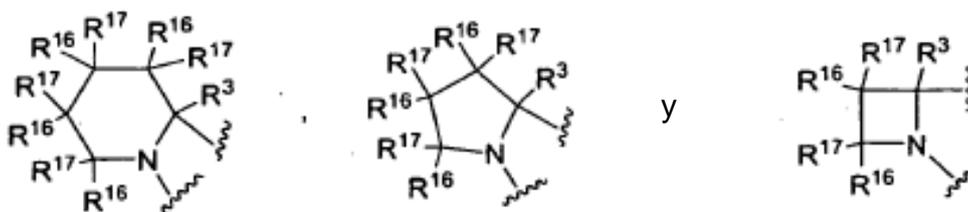
- 40 Igualmente son especialmente preferentes las amidas de ácido propiólico de la fórmula general I arriba mostrada, en las que  $R^1$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3(CR^4R^5)_b-(CR^6R^7)_c$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en





5 y los demás grupos tienen en cada caso el significado arriba mencionado, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

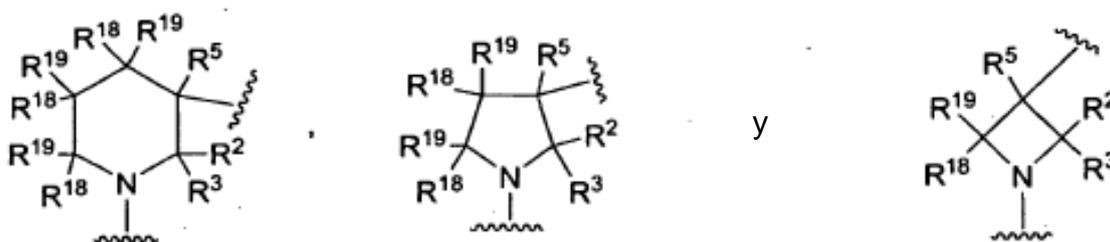
También son especialmente preferentes las amidas de ácido propiónico de la fórmula general I arriba mostrada, en las que  $R^1$  y  $R^2$ , junto con el grupo  $-N-CR^3$  que los une, forman un grupo seleccionado entre el grupo consistente en



y en este caso b representa 1 y c representa 0;

10 y los demás grupos tienen en cada caso el significado arriba mencionado, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de una mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

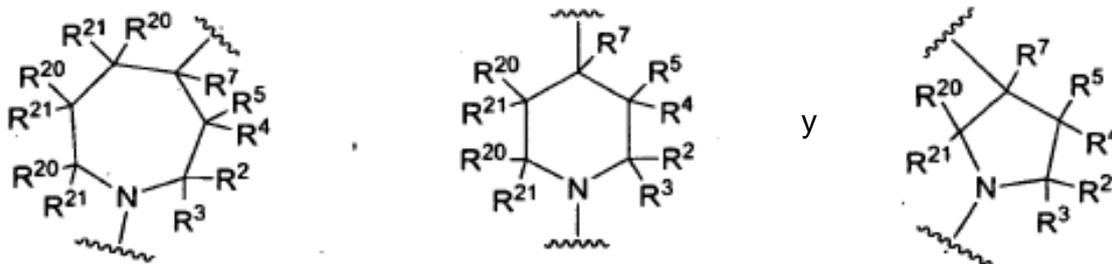
15 Además son especialmente preferentes las amidas de ácido propiónico de la fórmula general I arriba mostrada, en las que  $R^1$  y  $R^4$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^5$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



y en este caso c representa 0;

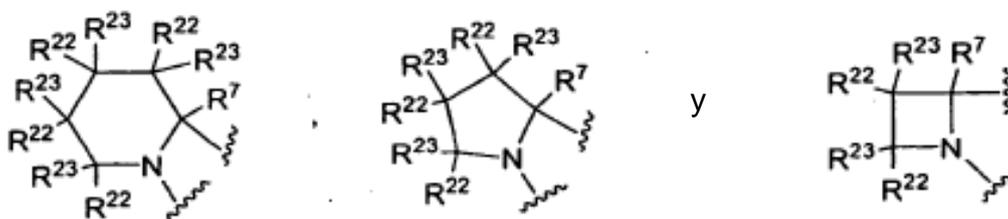
20 y los demás grupos tienen en cada caso el significado arriba mencionado, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

25 También son especialmente preferentes las amidas de ácido propiónico de la fórmula general I arriba mostrada, en las que  $R^1$  y  $R^6$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^4R^5-CR^7$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



5 y los demás grupos tienen en cada caso el significado arriba mencionado, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

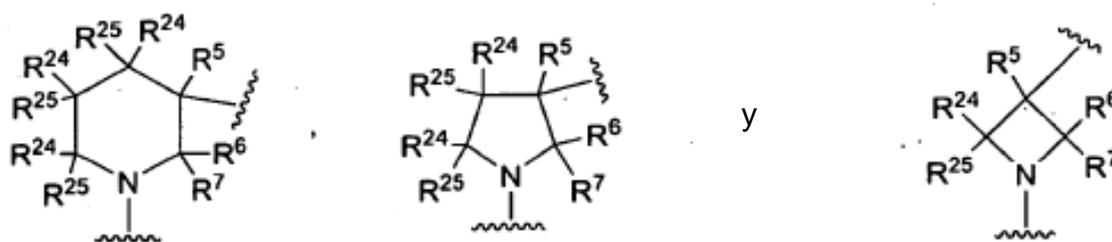
Igualmente son especialmente preferentes las amidas de ácido propiónico de la fórmula general I arriba mostrada, en las que  $R^6$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^7$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



y en este caso b representa 1 y a representa 0;

10 y los demás grupos tienen en cada caso el significado arriba mencionado, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

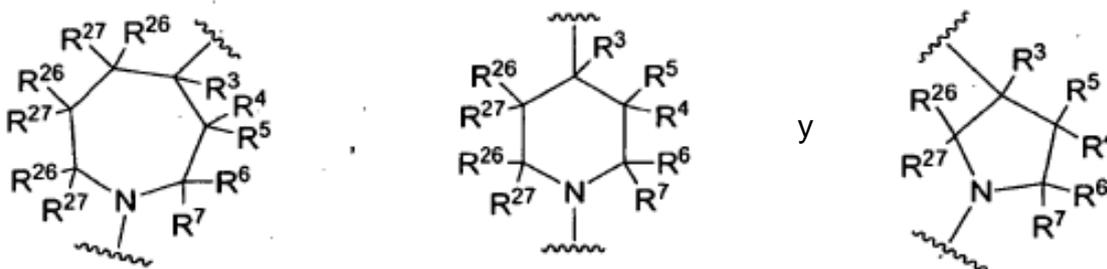
15 Además son especialmente preferentes las amidas de ácido propiónico de la fórmula general I arriba mostrada, en las que  $R^4$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^6R^7-CR^5$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



y en este caso a representa 0;

20 y los demás grupos tienen en cada caso el significado arriba mencionado, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

25 También son especialmente preferentes las amidas de ácido propiónico de la fórmula general I arriba mostrada, en las que  $R^2$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^6R^7-CR^4R^5-CR^3$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



5 y los demás grupos tienen en cada caso el significado arriba mencionado, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

Además son especialmente preferentes las amidas de ácido propiónico de la fórmula general I arriba mostrada, en las que

10  $R^9$  representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, furilo, tienilo, pirazolilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, piridinilo, pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, triazolilo, imidazolilo, indolilo, benzo[b]tiofenilo, benzo[d]tiazolilo, benzo[b]furanilo, quinolinilo, isoquinolinilo y quinazolinilo, en cada caso no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -CHF<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -NH-S(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-H; -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> y fenilo;

15 y los demás grupos tienen en cada caso el significado arriba mencionado, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

También son especialmente preferentes las amidas de ácido propiónico de la fórmula general I arriba mostrada, en las que

25  $R^{10}$ ,  $R^{11}$  y  $R^{12}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -NO<sub>2</sub>; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -NH-C(=O)-H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; -NH-R<sup>35</sup>; -NR<sup>36</sup>R<sup>37</sup>; -O-C(=O)-R<sup>38</sup>; -NH-C(=O)-R<sup>39</sup>; -NR<sup>40</sup>-C(=O)-R<sup>41</sup>; -O-R<sup>42</sup>; -S-R<sup>43</sup>-NH-C(=O)-NH-R<sup>44</sup>; -NH-C(=S)-NH-R<sup>45</sup>; -NH-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>46</sup>; -NR<sup>47</sup>-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>48</sup>; alquilo(C<sub>1-6</sub>) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH y -NH<sub>2</sub>; alqueno(C<sub>2-6</sub>); alquino(C<sub>2-6</sub>); cicloalquilo(C<sub>3-7</sub>), cicloalqueno(C<sub>5-6</sub>), heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros o heterocicloalqueno de 5 a 7 miembros, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alqueno(C<sub>1-3</sub>), alqueno(C<sub>2-3</sub>) o alquino(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, oxo, tioxo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub> y -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, tienilo, furilo, piridinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo e isoxazolilo, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alqueno(C<sub>1-3</sub>), alqueno(C<sub>2-3</sub>) o alquino(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F y -O-CF<sub>3</sub>;

30 y los demás grupos tienen en cada caso el significado arriba mencionado, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

45 También son especialmente preferentes las amidas de ácido propiónico de la fórmula general I arriba mostrada, en las que

$R^{13}$  representa H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-H; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; alquilo(C<sub>1-6</sub>) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH y -NH<sub>2</sub>; cicloalquilo(C<sub>3-7</sub>),

5 cicloalqueno(C<sub>5-6</sub>), heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros o heterocicloalqueno de 5 a 7 miembros, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alqueno(C<sub>1-3</sub>), alqueno(C<sub>2-3</sub>) o alquino(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, oxo, tioxo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub> y -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, tienilo, furilo, piridinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo e isoxazolilo, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alqueno(C<sub>1-3</sub>), alqueno(C<sub>2-3</sub>) o alquino(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F y -O-CF<sub>3</sub>;

10 y los demás grupos tienen en cada caso el significado arriba mencionado, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

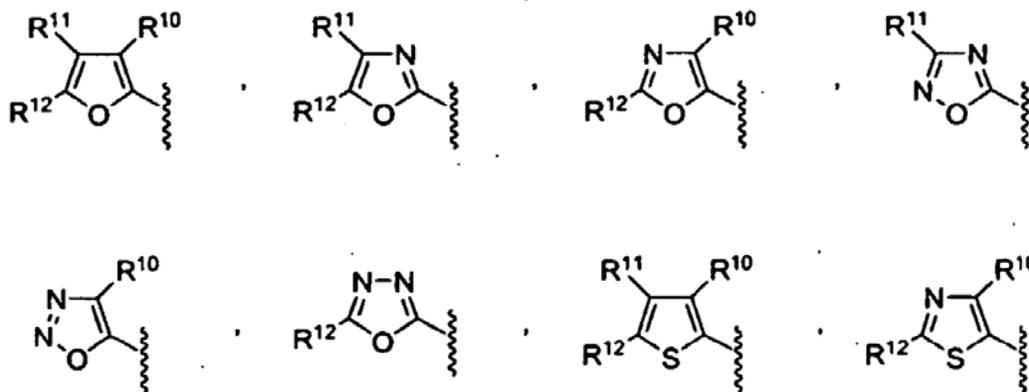
15 Igualmente son especialmente preferentes las amidas de ácido propiónico de la fórmula general I arriba mostrada, en las que R<sup>28</sup>, R<sup>29</sup>, R<sup>30</sup>, R<sup>31</sup>, R<sup>32</sup>, R<sup>33</sup>, R<sup>34</sup>, R<sup>35</sup>, R<sup>36</sup>, R<sup>37</sup>, R<sup>38</sup>, R<sup>39</sup>, R<sup>40</sup>, R<sup>41</sup>, R<sup>42</sup>, R<sup>43</sup>, R<sup>44</sup>, R<sup>45</sup>, R<sup>46</sup>, R<sup>47</sup> y R<sup>48</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso alquilo(C<sub>1-6</sub>) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH y -NH<sub>2</sub>; cicloalquilo(C<sub>3-7</sub>), cicloalqueno(C<sub>5-6</sub>), heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros o heterocicloalqueno de 5 a 7 miembros, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alqueno(C<sub>1-3</sub>), alqueno(C<sub>2-3</sub>) o alquino(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, oxo, tioxo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub> y -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, pirrolilo, indolilo, furano, benzo[b]furanilo, tiofeno, benzo[b]tiofeno, benzo[d]tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, isoxazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, piranilo, indazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo y quinazolinilo, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alqueno(C<sub>1-3</sub>), alqueno(C<sub>2-3</sub>) o alquino(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub> y -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;

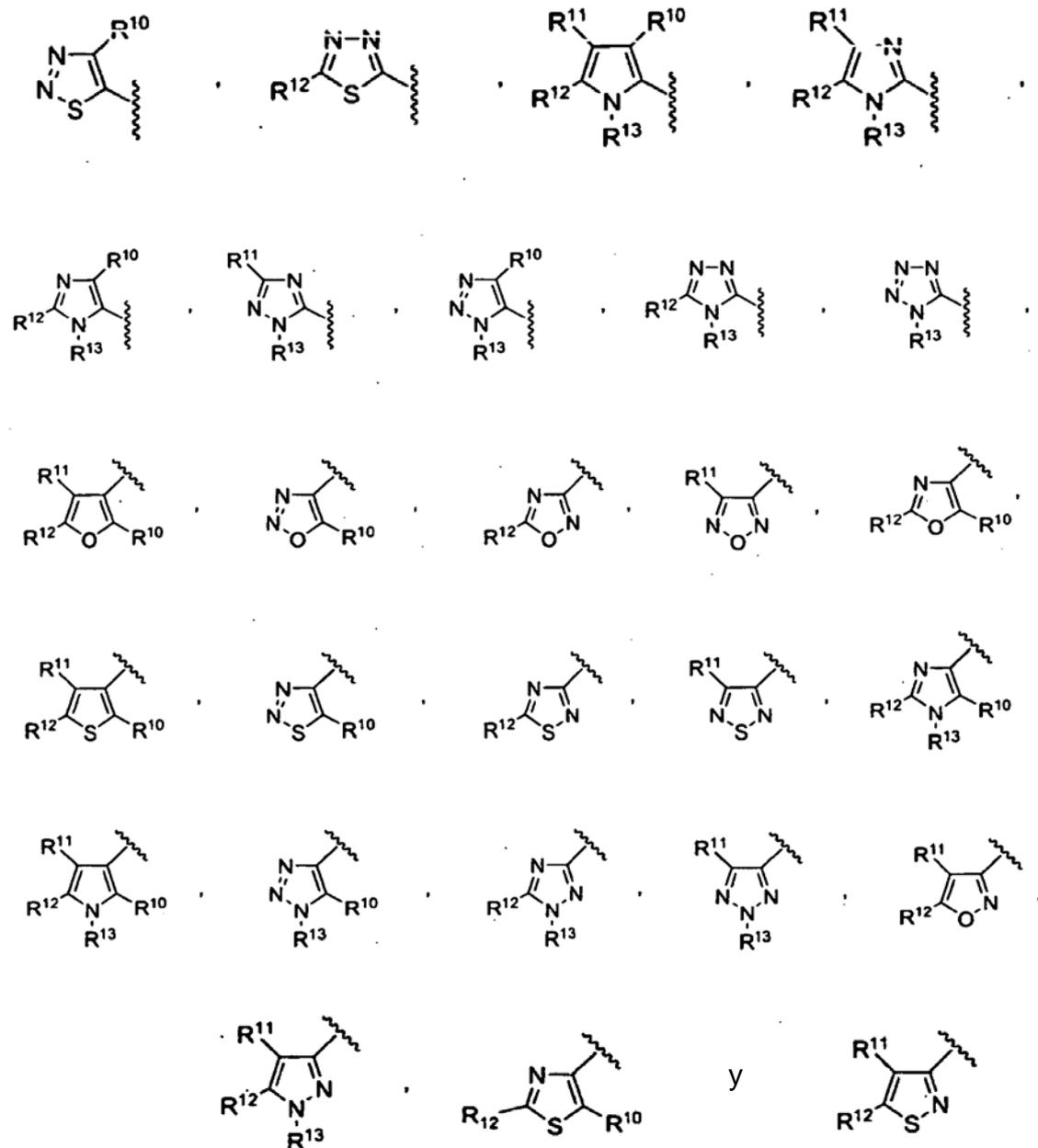
20 y los demás grupos tienen en cada caso el significado arriba mencionado, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

25 Son especialmente preferentes las amidas de ácido propiónico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada en las que

30 a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 1, 2 o 3;

A representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en





5

10  $R^1$  y  $R^8$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; -C(=O)- $R^{28}$ ; -C(=O)-O- $R^{29}$ ; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH- $R^{30}$ ; -C(=O)-NR<sup>31</sup> $R^{32}$ ; -S(=O)- $R^{33}$ ; -S(=O)<sub>2</sub>- $R^{34}$ ; alquilo(C<sub>1-6</sub>) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH y -NH<sub>2</sub>; cicloalquilo(C<sub>3-6</sub>) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH y -NH<sub>2</sub>; o un grupo fenilo que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo(C<sub>1-3</sub>), alquenilenilo(C<sub>2-3</sub>) o alquinilenilo(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> y -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>;

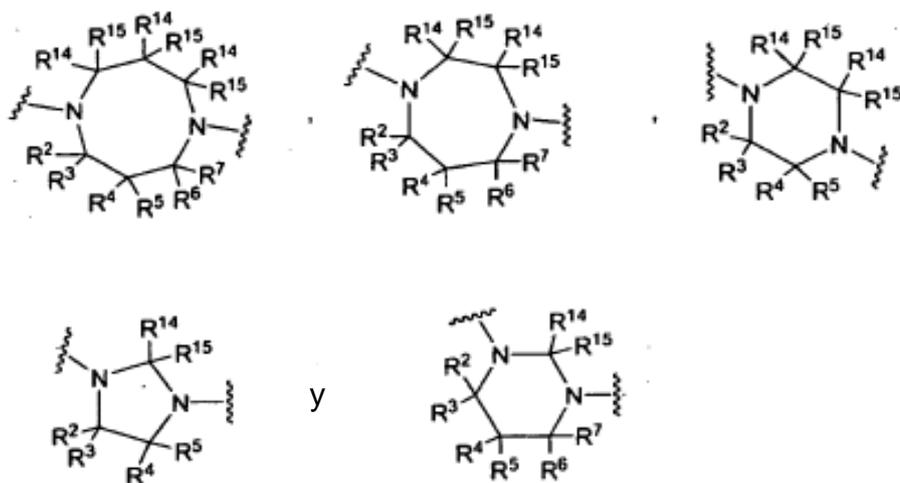
15  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{18}$ ,  $R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$ ,  $R^{22}$ ,  $R^{23}$ ,  $R^{24}$ ,  $R^{25}$ ,  $R^{26}$  y  $R^{27}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -NO<sub>2</sub>; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-OH; -C(=O)- $R^{28}$ ; -C(=O)-O- $R^{29}$ ; -NH- $R^{35}$ ; -NR<sup>36</sup> $R^{37}$ ; -O- $R^{42}$ ; -S- $R^{43}$ ; alquilo(C<sub>1-6</sub>) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH y -NH<sub>2</sub>; cicloalquilo(C<sub>3-7</sub>), cicloalquenilo(C<sub>5-6</sub>), heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros o heterocicloalquenilo de 5 a 7 miembros, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo(C<sub>1-3</sub>), alquenilenilo(C<sub>2-3</sub>) o alquinilenilo(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, oxo, tioxo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>,

20

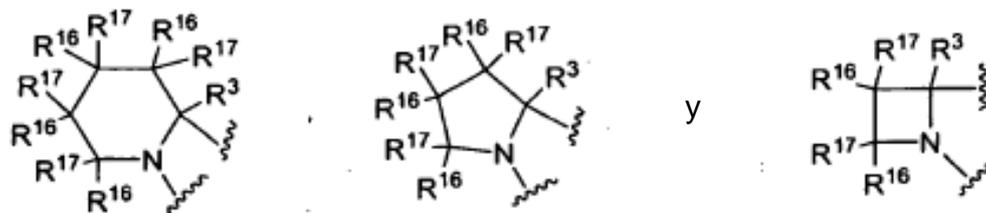
5 -SH, -S-CH<sub>3</sub> y -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, pirrolilo, indolilo, furanilo, benzo[b]furanilo, tiofenilo, benzo[b]tiofenilo, benzo[d]tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, isoxazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, piranilo, indazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo y quinazolinilo, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquileo(C<sub>1-3</sub>), alquilenilo(C<sub>2-3</sub>) o alquinileno(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> y -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>;

10 o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup>, o R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup>, o R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup>, o R<sup>14</sup> y R<sup>15</sup>, o R<sup>16</sup> y R<sup>17</sup>, o R<sup>18</sup> y R<sup>19</sup>, o R<sup>20</sup> y R<sup>21</sup>, o R<sup>22</sup> y R<sup>23</sup>, o R<sup>24</sup> y R<sup>25</sup>, o R<sup>26</sup> y R<sup>27</sup>, independientemente entre sí, representan juntos en cada caso un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en un grupo oxo (=O) y un grupo tioxo (=S);

o R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>(CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>)<sub>b</sub>-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>c</sub> que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en

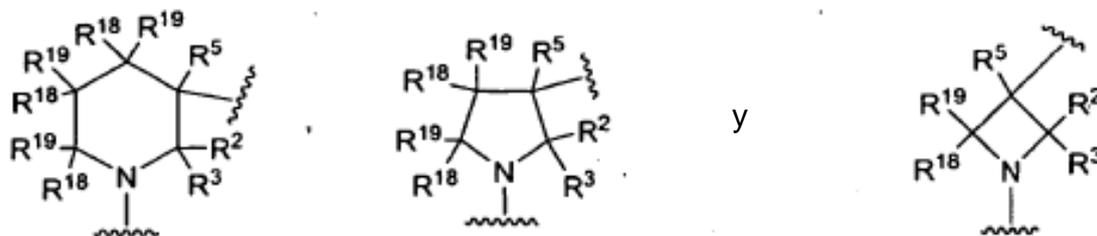


o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>3</sup> que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



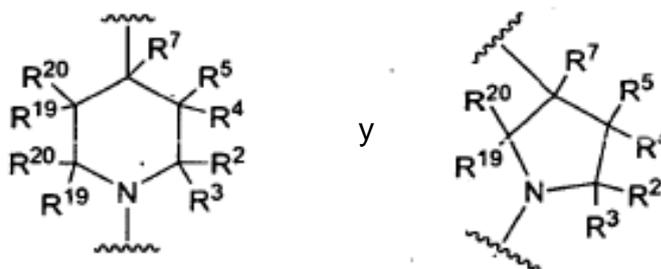
y en este caso b representa 1 y c representa 0;

o R<sup>1</sup> y R<sup>4</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>-CR<sup>5</sup> que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en

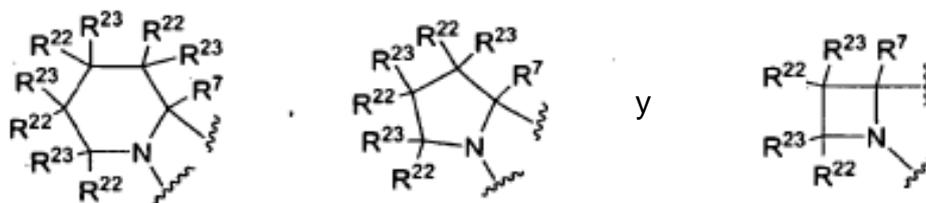


y en este caso c representa 0;

R<sup>1</sup> y R<sup>6</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>-CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>-CR<sup>7</sup> que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en

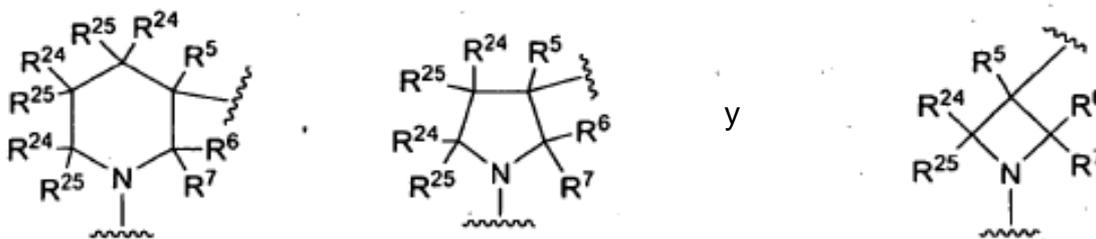


o R<sup>6</sup> y R<sup>8</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>7</sup> que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



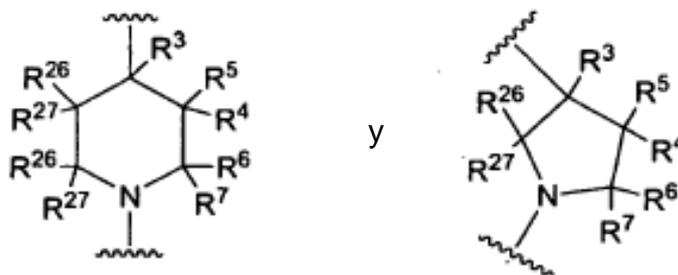
y en este caso b representa 1 y a representa 0;

5 o R<sup>4</sup> y R<sup>8</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>-CR<sup>5</sup> que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



y en este caso a representa 0;

o R<sup>2</sup> y R<sup>8</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>-CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>-CR<sup>3</sup> que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



10

R<sup>9</sup> representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, furilo, tienilo, pirazolilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, piridinilo, pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, triazolilo, imidazolilo, indolilo, benzo[b]tiofenilo, benzo[d]tiazolilo, benzo[b]furanilo, quinolinilo, isoquinolinilo y quinazolinilo, en cada caso no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -CHF<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-H, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> y fenilo;

15

20

R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> y R<sup>12</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -NO<sub>2</sub>; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -NH-C(=O)-H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-

5  $R^{33}$ ;  $-S(=O)_2-R^{34}$ ;  $-NH-R^{35}$ ;  $-NR^{36}R^{37}$ ;  $-O-C(=O)-R^{38}$ ;  $-NH-C(=O)-R^{39}$ ;  $-NR^{40}-C(=O)-R^{41}$ ;  $-O-R^{42}$ ;  $-S-R^{43}-NH-C(=O)-NH-R^{44}$ ;  $-NH-C(=S)-NH-R^{45}$ ;  $-NH-S(=O)_2-R^{46}$ ;  $-NR^{47}-S(=O)_2-R^{48}$ ; alquilo( $C_{1-6}$ ) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-SH$  y  $-NH_2$ ; alquenilo( $C_{2-6}$ ); alquinilo( $C_{2-6}$ ); cicloalquilo( $C_{3-7}$ ), cicloalquenilo( $C_{5-6}$ ), heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros o heterocicloalquenilo de 5 a 7 miembros, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo( $C_{1-3}$ ), alquenileno( $C_{2-3}$ ) o alquinileno( $C_{2-3}$ ) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ , oxo, tioxo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-NH_2$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NO_2$ ,  $-CF_3$ ,  $-O-CF_3$ ,  $-S-CF_3$ ,  $-SH$ ,  $-S-CH_3$  y  $-S-C_2H_5$ ; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, tienilo, furilo, piridinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo e isoxazolilo, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo( $C_{1-3}$ ), alquenileno( $C_{2-3}$ ) o alquinileno( $C_{2-3}$ ) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-S-CH_3$ ,  $-S-C_2H_5$ ,  $-S(=O)-CH_3$ ,  $-S(=O)_2-CH_3$ ,  $-S(=O)-C_2H_5$ ,  $-S(=O)_2-C_2H_5$ ,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-CF_3$ ,  $-CHF_2$ ,  $-CH_2F$  y  $-O-CF_3$ ;

10  $R^{13}$  representa H;  $-C(=O)-R^{28}$ ;  $-C(=O)-H$ ;  $-C(=O)-O-R^{29}$ ;  $-C(=O)-NH_2$ ;  $-C(=O)-NH-R^{30}$ ;  $-C(=O)-NR^{31}R^{32}$ ;  $-S(=O)-R^{33}$ ;  $-S(=O)_2-R^{34}$ ; alquilo( $C_{1-6}$ ) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-SH$  y  $-NH_2$ ; cicloalquilo( $C_{3-7}$ ), cicloalquenilo( $C_{5-6}$ ), heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros o heterocicloalquenilo de 5 a 7 miembros, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo( $C_{1-3}$ ), alquenileno( $C_{2-3}$ ) o alquinileno( $C_{2-3}$ ) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ , oxo, tioxo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-NH_2$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NO_2$ ,  $-CF_3$ ,  $-O-CF_3$ ,  $-S-CF_3$ ,  $-SH$ ,  $-S-CH_3$  y  $-S-C_2H_5$ ; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, tienilo, furilo, piridinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo e isoxazolilo, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo( $C_{1-3}$ ), alquenileno( $C_{2-3}$ ) o alquinileno( $C_{2-3}$ ) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-S-CH_3$ ,  $-S-C_2H_5$ ,  $-S(=O)-CH_3$ ,  $-S(=O)_2-CH_3$ ,  $-S(=O)-C_2H_5$ ,  $-S(=O)_2-C_2H_5$ ,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-CF_3$ ,  $-CHF_2$ ,  $-CH_2F$  y  $-O-CF_3$ ;

20  $R^{28}$ ,  $R^{29}$ ,  $R^{30}$ ,  $R^{31}$ ,  $R^{32}$ ,  $R^{33}$ ,  $R^{34}$ ,  $R^{35}$ ,  $R^{36}$ ,  $R^{37}$ ,  $R^{38}$ ,  $R^{39}$ ,  $R^{40}$ ,  $R^{41}$ ,  $R^{42}$ ,  $R^{43}$ ,  $R^{44}$ ,  $R^{45}$ ,  $R^{46}$ ,  $R^{47}$  y  $R^{48}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso alquilo( $C_{1-6}$ ) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-SH$  y  $-NH_2$ ; cicloalquilo( $C_{3-7}$ ), cicloalquenilo( $C_{5-6}$ ), heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros o heterocicloalquenilo de 5 a 7 miembros, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo( $C_{1-3}$ ), alquenileno( $C_{2-3}$ ) o alquinileno( $C_{2-3}$ ) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ , oxo, tioxo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-NH_2$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NO_2$ ,  $-CF_3$ ,  $-O-CF_3$ ,  $-S-CF_3$ ,  $-SH$ ,  $-S-CH_3$  y  $-S-C_2H_5$ ; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, tienilo, furilo, piridinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo e isoxazolilo, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo( $C_{1-3}$ ), alquenileno( $C_{2-3}$ ) o alquinileno( $C_{2-3}$ ) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ ,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-NH_2$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NO_2$ ,  $-CF_3$ ,  $-O-CF_3$ ,  $-S-CF_3$ ,  $-SH$ ,  $-NH-S(=O)_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-N(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-NH-CH_3$ ,  $-NH-C(=O)-CH_3$ ,  $-NH-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-CH_3$  y  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ;

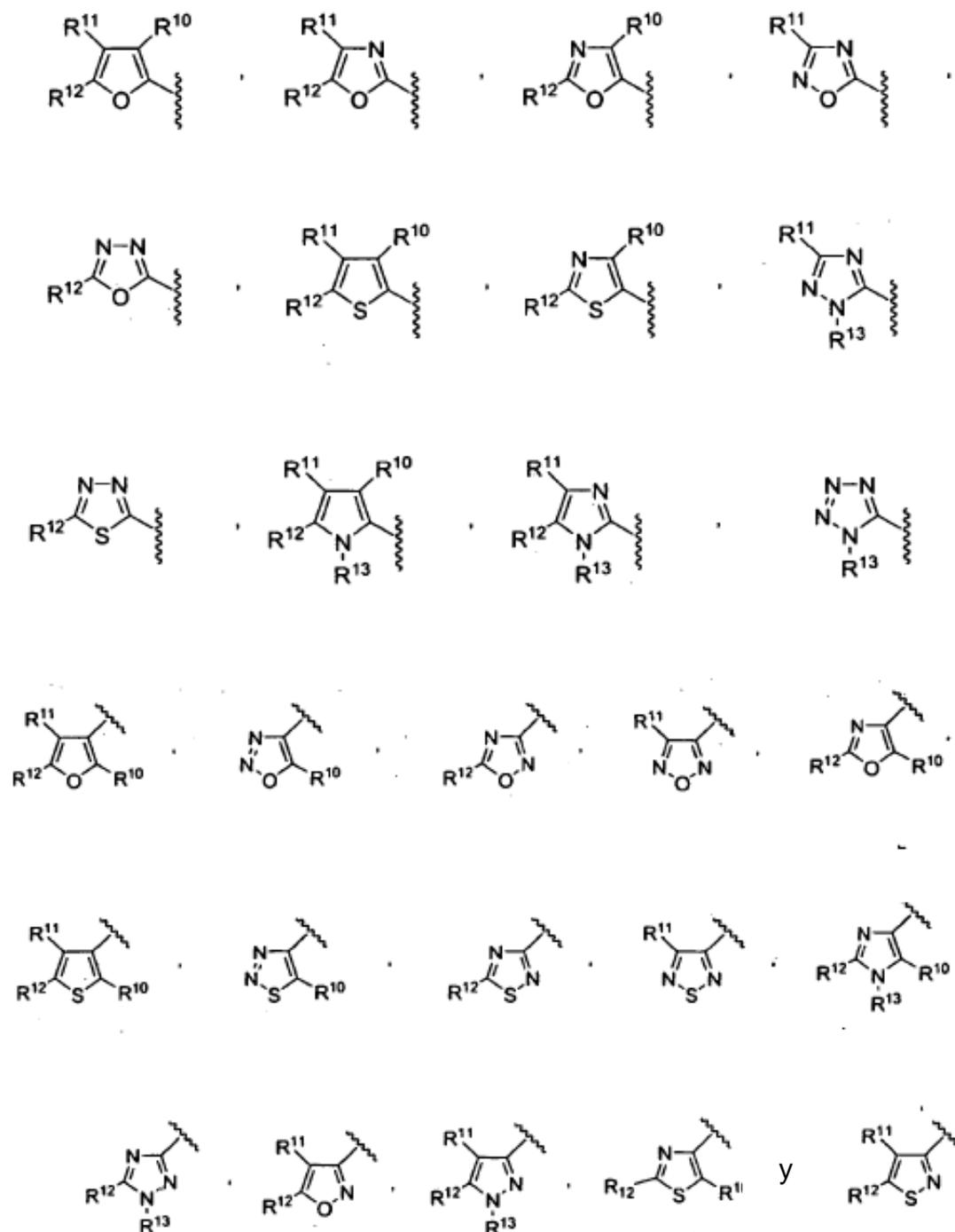
30 y  $R^{28}$ ,  $R^{29}$ ,  $R^{30}$ ,  $R^{31}$ ,  $R^{32}$ ,  $R^{33}$ ,  $R^{34}$ ,  $R^{35}$ ,  $R^{36}$ ,  $R^{37}$ ,  $R^{38}$ ,  $R^{39}$ ,  $R^{40}$ ,  $R^{41}$ ,  $R^{42}$ ,  $R^{43}$ ,  $R^{44}$ ,  $R^{45}$ ,  $R^{46}$ ,  $R^{47}$  y  $R^{48}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso alquilo( $C_{1-6}$ ) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-SH$  y  $-NH_2$ ; cicloalquilo( $C_{3-7}$ ), cicloalquenilo( $C_{5-6}$ ), heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros o heterocicloalquenilo de 5 a 7 miembros, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo( $C_{1-3}$ ), alquenileno( $C_{2-3}$ ) o alquinileno( $C_{2-3}$ ) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ , oxo, tioxo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-NH_2$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NO_2$ ,  $-CF_3$ ,  $-O-CF_3$ ,  $-S-CF_3$ ,  $-SH$ ,  $-S-CH_3$  y  $-S-C_2H_5$ ; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, tienilo, furilo, piridinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo e isoxazolilo, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo( $C_{1-3}$ ), alquenileno( $C_{2-3}$ ) o alquinileno( $C_{2-3}$ ) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ ,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-NH_2$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NO_2$ ,  $-CF_3$ ,  $-O-CF_3$ ,  $-S-CF_3$ ,  $-SH$ ,  $-NH-S(=O)_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-N(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-NH-CH_3$ ,  $-NH-C(=O)-CH_3$ ,  $-NH-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-CH_3$  y  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ;

35 en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

40 Igualmente son especialmente preferentes las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada en las que

45 a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 1, 2 o 3;

A representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



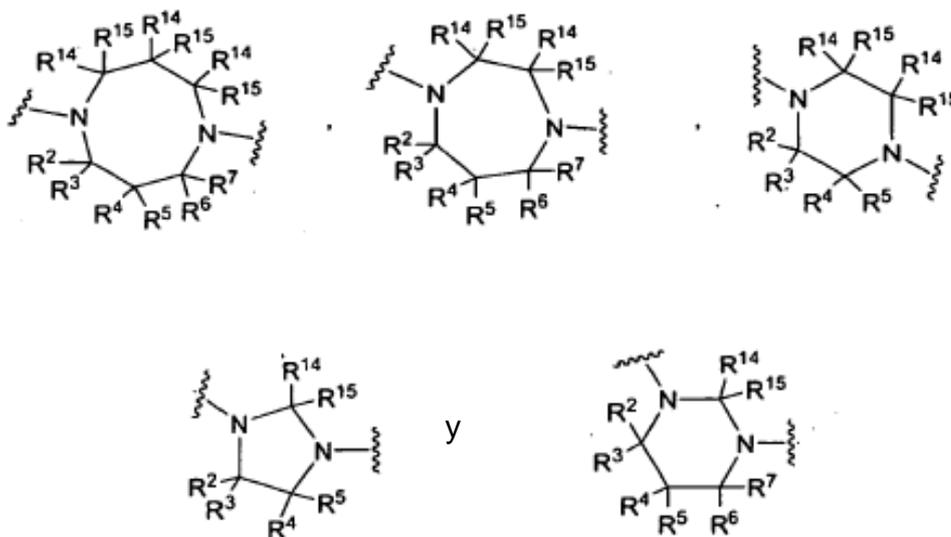
5  $R^1$  y  $R^8$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H;  $-C(=O)-R^{28}$ ;  $-C(=O)-O-R^{29}$ ;  $-S(=O)-R^{33}$ ;  $-S(=O)_2-R^{34}$ ; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc.-butilo, n-pentilo y n-hexilo; un grupo cicloalquilo seleccionado entre el grupo consistente en ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo; o un grupo bencilo o fenitilo no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ ,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$  y  $-O-C_3H_7$ ;

10  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{18}$ ,  $R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$ ,  $R^{22}$ ,  $R^{23}$ ,  $R^{24}$ ,  $R^{25}$ ,  $R^{26}$  y  $R^{27}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I;  $-NH_2$ ;  $-OH$ ;  $-SH$ ;  $-CN$ ;  $-NO_2$ ;  $-CF_3$ ;  $-NH-R^{35}$ ;  $-NR^{36}R^{37}$ ;  $-O-R^{42}$ ;  $-S-R^{43}$ ; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-

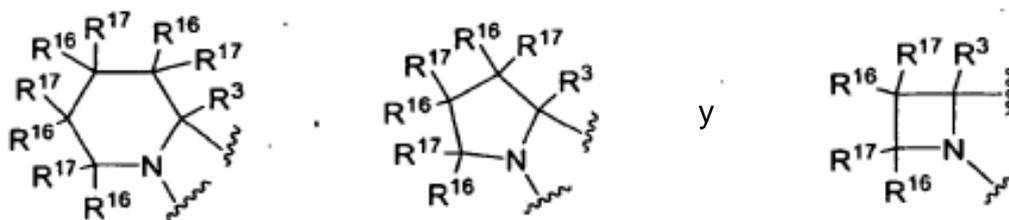
butilo, n-pentilo y n-hexilo; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo;

5 o  $R^2$  y  $R^3$ , o  $R^4$  y  $R^5$ , o  $R^6$  y  $R^7$ , o  $R^{14}$  y  $R^{15}$ , o  $R^{16}$  y  $R^{17}$ , o  $R^{18}$  y  $R^{19}$ , o  $R^{20}$  y  $R^{21}$ , o  $R^{22}$  y  $R^{23}$ , o  $R^{24}$  y  $R^{25}$ , o  $R^{26}$  y  $R^{27}$ , independientemente entre sí, representan juntos en cada caso un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en un grupo oxo (=O) y un grupo tioxo (=S);

o  $R^1$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3(CR^4R^5)_b-(CR^6R^7)_c$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



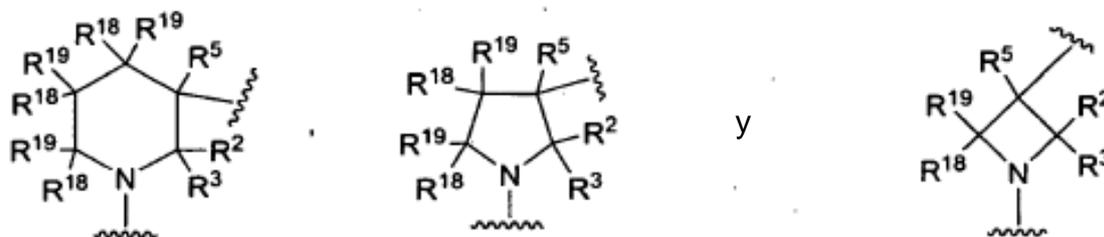
o  $R^1$  y  $R^2$ , junto con el grupo  $-N-CR^3$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



10

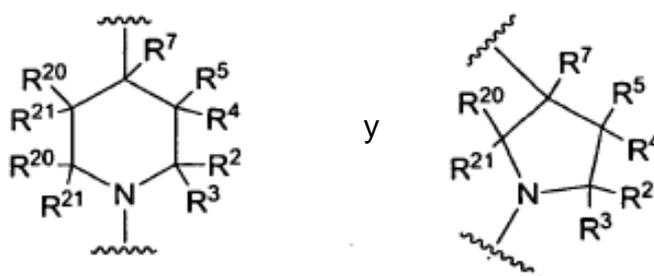
y en este caso b representa 1 y c representa 0;

o  $R^1$  y  $R^4$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^5$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en

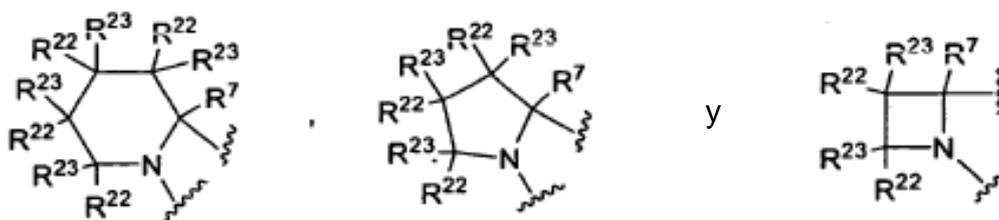


y en este caso c representa 0;

15  $R^1$  y  $R^6$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^4R^5-CR^7$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en

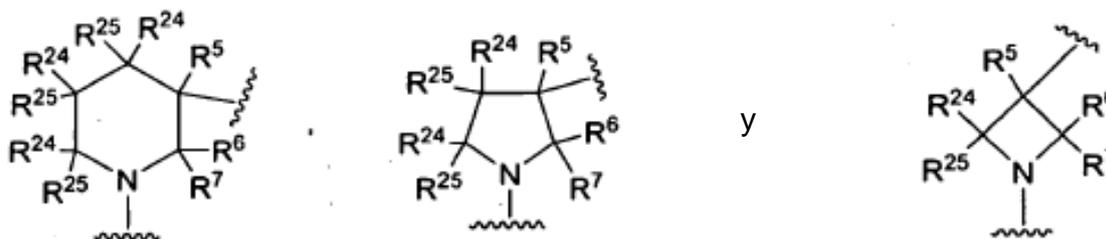


o R<sup>6</sup> y R<sup>8</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>7</sup> que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



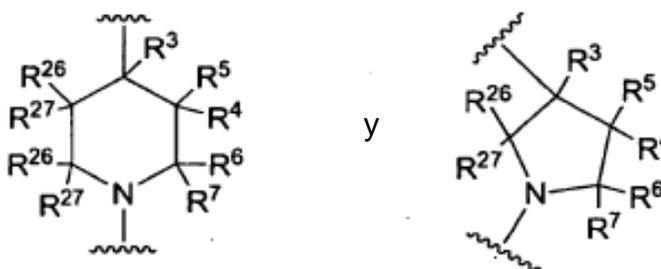
y en este caso b representa 1 y a representa 0;

5 o R<sup>4</sup> y R<sup>8</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>-CR<sup>5</sup> que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



y en este caso a representa 0;

o R<sup>2</sup> y R<sup>8</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>-CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>-CR<sup>3</sup> que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en

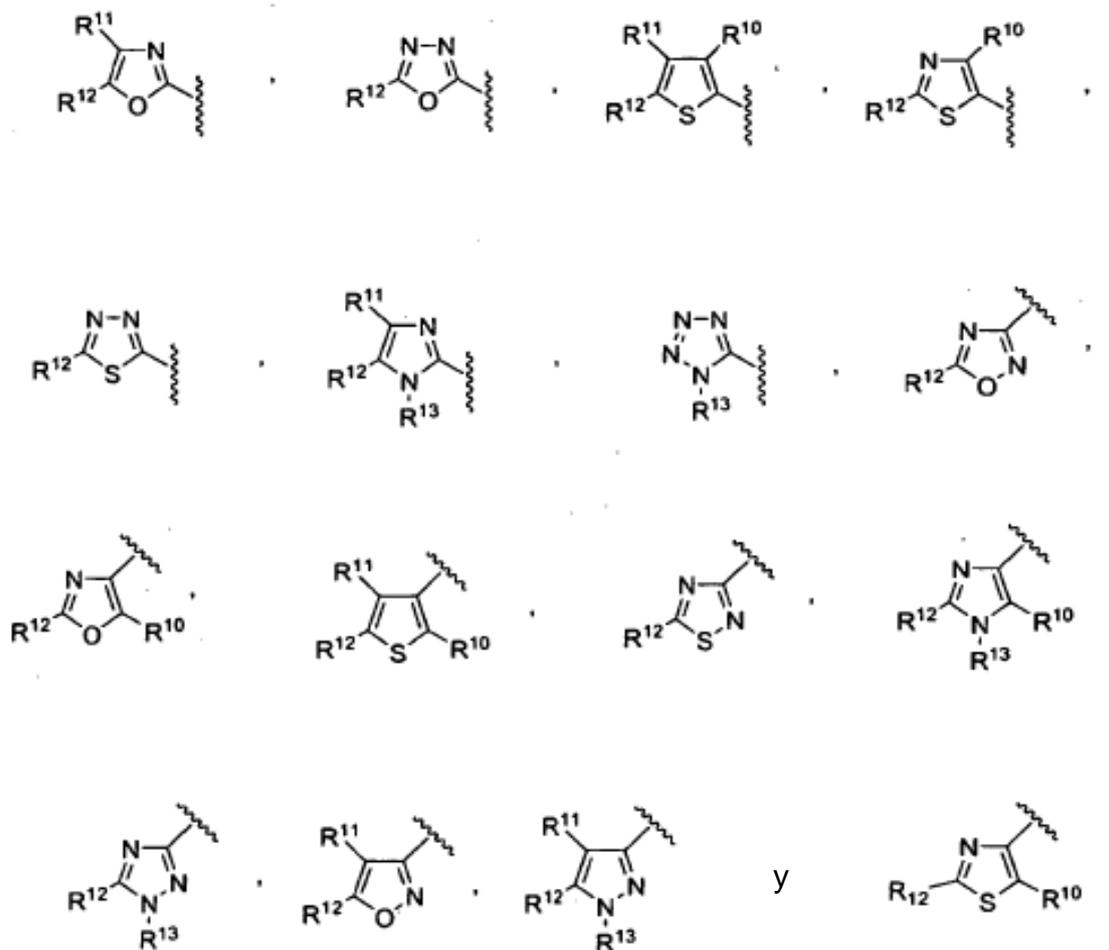


10

R<sup>9</sup> representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, furilo, tienilo, pirazolilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, piridinilo, pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, triazolilo e imidazolilo, en cada caso no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, ciclopropilo, ciclobutilo, -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -CHF<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-H; -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> y fenilo;

20 R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> y R<sup>12</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -CF<sub>3</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CN; -C(=O)-OH; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; -O-R<sup>42</sup>; -S-R<sup>43</sup>; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;

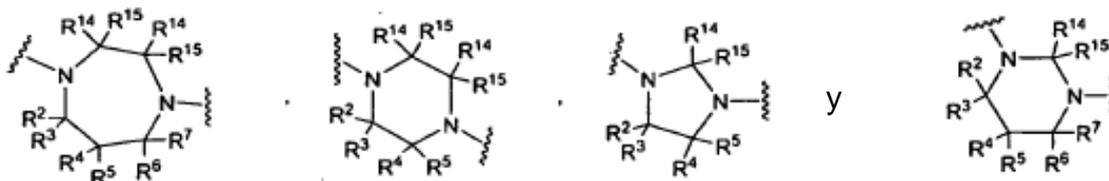
- un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en etenilo, etinilo, alilo y propinilo; un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en ciclopropilo, ciclobutilo y ciclopentilo; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, bencilo, fenetilo, oxadiazolilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-furilo y 3-furilo, en cada caso no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>;
- 5
- R<sup>13</sup> representa H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-H; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo; un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, bencilo, fenetilo, oxadiazolilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-furilo y 3-furilo, que en cada caso puede estar unido a través de un grupo alquileo(C<sub>1-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>;
- 10
- y R<sup>28</sup>, R<sup>29</sup>, R<sup>30</sup>, R<sup>31</sup>, R<sup>32</sup>, R<sup>33</sup>, R<sup>34</sup>, R<sup>35</sup>, R<sup>36</sup>, R<sup>37</sup>, R<sup>42</sup> y R<sup>43</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo; -CF<sub>3</sub>; -C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>; -CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>; o un grupo fenilo, bencilo o fenetilo, que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>;
- 15
- 20
- en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.
- 25
- Son totalmente preferentes las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada en las que a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 1, 2 o 3;
- A representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



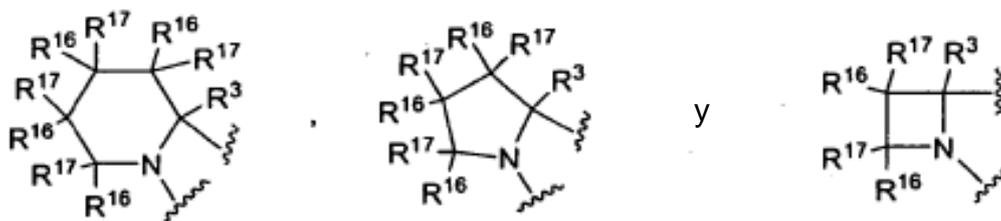
$R^1$  y  $R^8$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H;  $-C(=O)-R^{28}$ ;  $-C(=O)-O-R^{29}$ ; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo; o un grupo ciclopropilo;

5  $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, R^{18}, R^{19}, R^{22}, R^{23}, R^{24}$  y  $R^{25}$ ; independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I;  $-NH_2$ ;  $-OH$ ;  $-SH$ ;  $-CN$ ;  $-NO_2$ ;  $-CF_3$ ;  $-NH-R^{35}$ ;  $-NR^{36}R^{37}$ ;  $-O-R^{42}$ ;  $-S-R^{43}$ ; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo; o un grupo ciclopropilo;

10 o  $R^1$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3(CR^4R^5)_b-(CR^6R^7)_c$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en

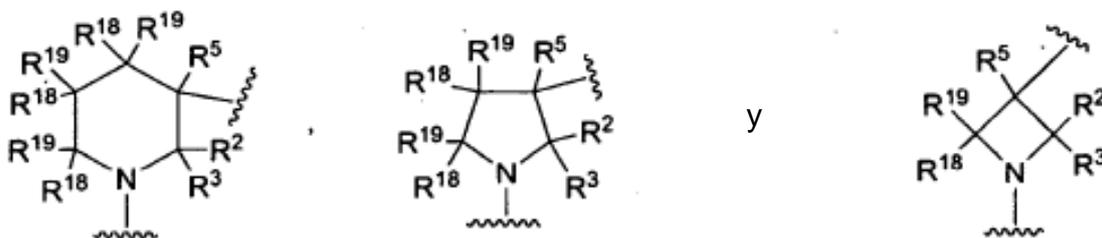


o  $R^1$  y  $R^2$ , junto con el grupo  $-N-CR^3$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



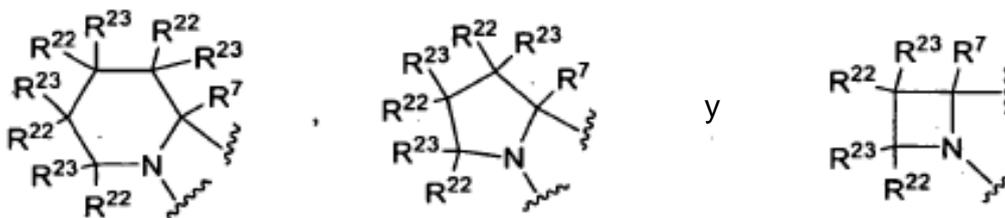
y en este caso b representa 1 y c representa 0;

o  $R^1$  y  $R^4$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^5$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



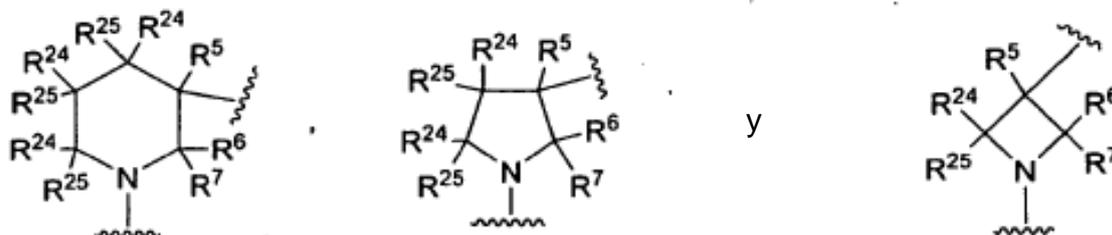
5 y en este caso c representa 0;

o  $R^6$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^7$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



y en este caso b representa 1 y a representa 0;

o  $R^4$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^6R^7-CR^5$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



10

y en este caso a representa 0;

$R^9$  representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, tienilo, pirazolilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, piridinilo, tiazolilo y tiadiazolilo, en cada caso no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, ciclopropilo, ciclobutilo,  $-C\equiv C-Si(CH_3)_3$ ,  $-C\equiv C-Si(C_2H_5)_3$ ,  $-CH_2-O-CH_3$ ,  $-CH_2-O-C_2H_5$ ,  $-OH$ ,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-S-CH_3$ ,  $-S-C_2H_5$ ,  $-S(=O)-CH_3$ ,  $-S(=O)_2-CH_3$ ,  $-S(=O)-C_2H_5$ ,  $-S(=O)_2-C_2H_5$ ,  $-NH_2$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NO_2$ ,  $-CF_3$ ,  $-CH_2F$ ,  $-CHF_2$ ,  $-O-CF_3$ ,  $-S-CF_3$ ,  $-SH$ ,  $-NH-S(=O)_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)-H$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-N(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-NH-CH_3$ ,  $-NH-C(=O)-CH_3$ ,  $-NH-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$  y fenilo;

15

20

$R^{10}$ ,  $R^{11}$  y  $R^{12}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I;  $-CF_3$ ;  $-NO_2$ ;  $-CN$ ;  $-C(=O)-OH$ ;  $-C(=O)-O-R^{29}$ ;  $-C(=O)-NH_2$ ;  $-O-R^{42}$ ;  $-S-R^{43}$ ; etenilo; etinilo; ciclopropilo o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;

5  $R^{13}$  representa H;  $-C(=O)-R^{28}$ ;  $-C(=O)-H$ ;  $-C(=O)-O-R^{29}$ ;  $-S(=O)-R^{33}$ ;  $-S(=O)_2-R^{34}$ ; ciclopropilo; ciclobutilo; o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;

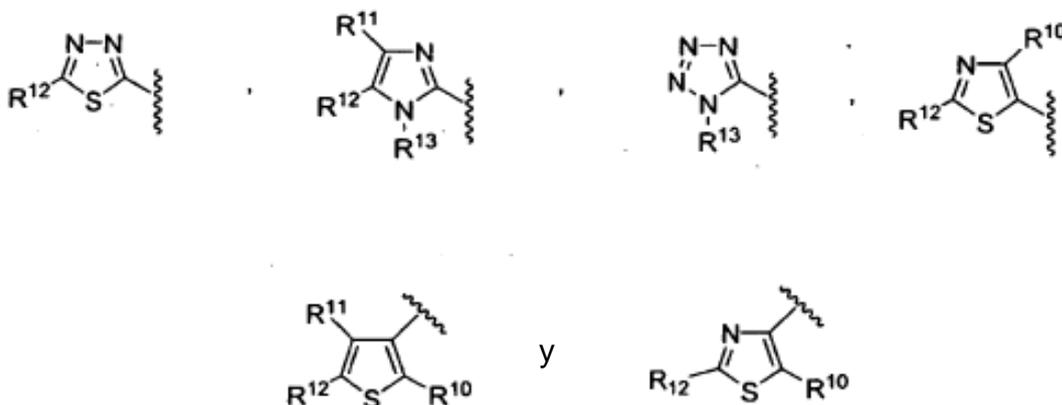
10 y  $R^{28}$ ,  $R^{29}$ ,  $R^{33}$ ,  $R^{34}$ ,  $R^{35}$ ,  $R^{36}$ ,  $R^{37}$ ,  $R^{42}$  y  $R^{43}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo;  $-CF_3$ ;  $-C_2F_5$ ;  $-CH_2-CF_3$ ; o un grupo fenilo, bencilo o fenetilo no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ ,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ;

15 en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

Igualmente son totalmente preferentes las amidas de ácido propiónico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada en las que

a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 1 o 2;

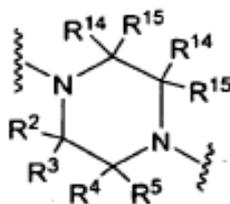
A representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



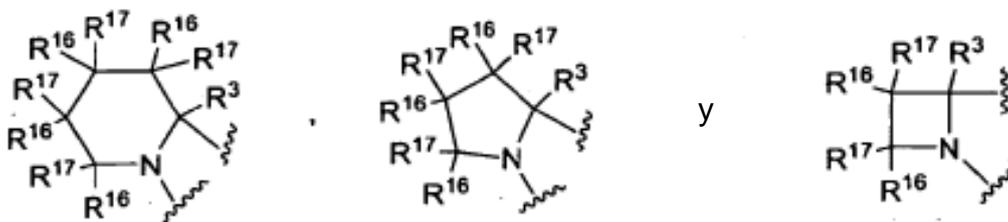
$R^1$  y  $R^8$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H;  $-C(=O)-R^{28}$ ; un grupo alquilo seleccionado entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo; o un grupo ciclopropilo;

25  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{22}$ ,  $R^{23}$ ,  $R^{24}$  y  $R^{25}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I;  $-CN$ ;  $-NO_2$ ;  $-CF_3$ ;  $-O-R^{42}$ ; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo; o un grupo ciclopropilo;

o  $R^1$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^4R^5$  que los une, forman el siguiente grupo

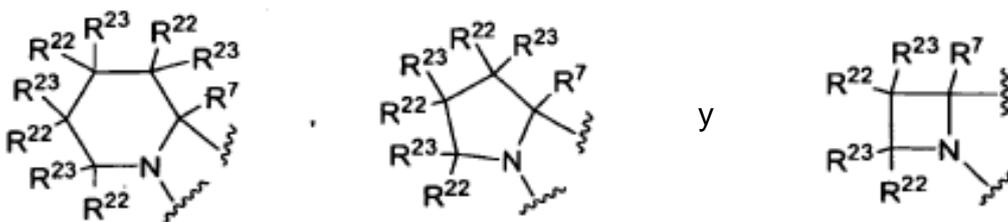


o  $R^1$  y  $R^2$ , junto con el grupo  $-N-CR^3$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



y en este caso b representa 1 y c representa 0;

o  $R^6$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^7$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



5 y en este caso b representa 1 y a representa 0;

$R^9$  representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo y tienilo, en cada caso no sustituido o sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, etenilo, etinilo, ciclopropilo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-NO_2$ ,  $-CF_3$  y  $-O-CF_3$ ;

10  $R^{10}$ ,  $R^{11}$  y  $R^{12}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br;  $-CF_3$ ;  $-NO_2$ ;  $-CN$ ;  $-O-R^{42}$ ; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, isobutilo y terc-butilo; etenilo; etinilo o ciclopropilo;

$R^{13}$  representa H;  $-C(=O)-H$ ;  $-C(=O)-R^{28}$ ; ciclopropilo; o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;

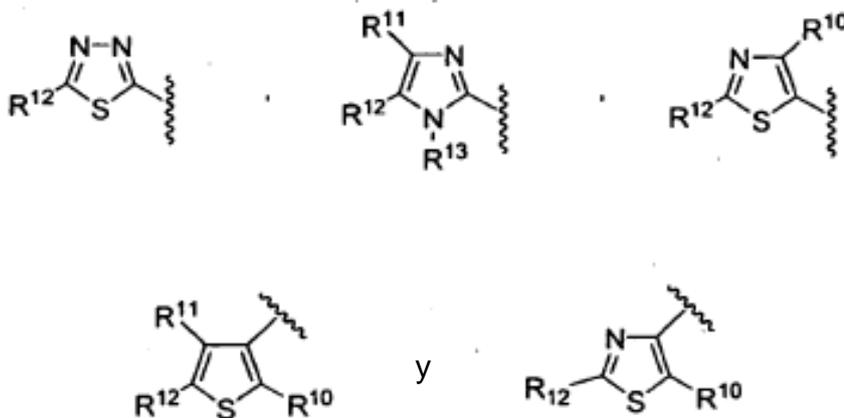
15 y  $R^{28}$  y  $R^{42}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo; o  $-CF_3$ ;

20 en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

Además son totalmente preferentes las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada en las que

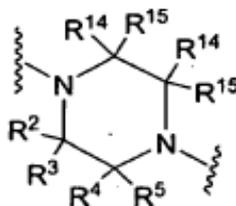
a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 2;

A representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en

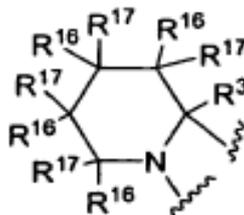


$R^1$  y  $R^8$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H;  $-C(=O)-CH_3$ ; metilo, isopropilo o ciclopropilo;  
 $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, R^{22}$  y  $R^{23}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo;

5 o  $R^1$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^4R^5$  que los une, forman el siguiente grupo

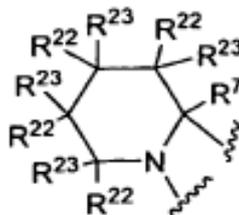


o  $R^1$  y  $R^2$ , junto con el grupo  $-N-CR^3$  que los une, forman el siguiente grupo



10 y en este caso b representa 1 y c representa 0;

o  $R^6$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^7$  que los une, forman el siguiente grupo



y en este caso b representa 1 y a representa 0;

15  $R^9$  representa un grupo fenilo, en cada caso no sustituido o sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, etenilo, etinilo, ciclopropilo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-NO_2$ ,  $-CF_3$  y  $-O-CF_3$ ;

$R^{10}$ ,  $R^{11}$  y  $R^{12}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br;  $-CF_3$ ;  $-NO_2$ ;  $-CN$ ;  $-O-CF_3$ ; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, isobutilo y terc-butilo; etenilo; etinilo o ciclopropilo;

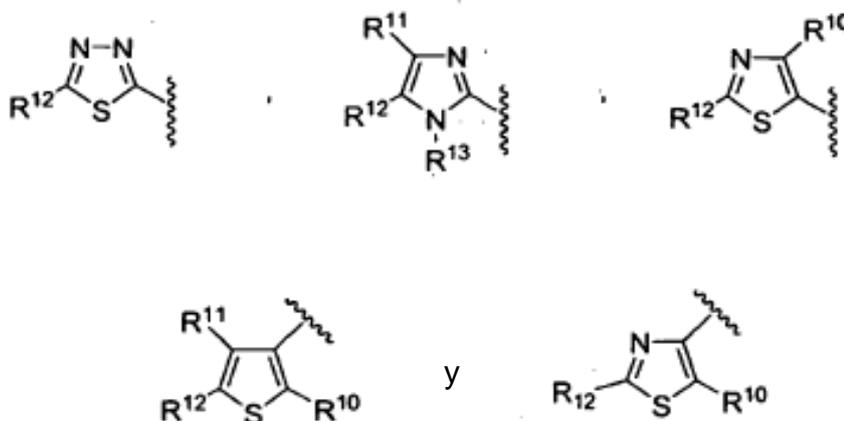
5 y  $R^{13}$  representa H o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;

en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

10 También son totalmente preferentes las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada en las que

a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 2;

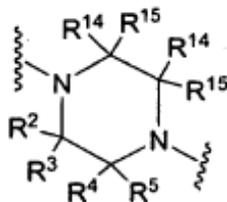
A representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



15  $R^1$  y  $R^8$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H, metilo o isopropilo;

$R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{14}$  y  $R^{15}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo y etilo;

o  $R^1$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^4R^5$  que los une, forman el siguiente grupo



20  $R^9$  representa un grupo fenilo, en cada caso no sustituido o sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I y  $-CN$ ;

$R^{10}$ ,  $R^{11}$  y  $R^{12}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, isobutilo y terc-butilo;

25 y  $R^{13}$  representa H o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;

en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

La mayor preferencia corresponde a las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada, seleccionadas de entre el grupo consistente en los compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 21 seleccionados entre el grupo consistente en

- [1] 1-(3-fenilpropiolil)-4-(tiofen-3-il)piperazina,  
 5 [2] 1-(3-fenilpropiolil)-4-(tiazol-4-il)piperazina,  
 [3] 1-(3-fenilpropiolil)-4-(1-metilimidazol-2-il)piperazina,  
 [4] (R)-2-metil-1-(3-(3-clorofenil)propiolil)-4-(tiazol-4-il)piperazina,  
 [5] 2-metil-1-(3-(3-clorofenil)propiolil)-4-(1,3,4-tiadiazol-2-il)piperazina,  
 [6] 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(1,3,4-tiadiazol-2-il)amino)etil)propiolamida,  
 10 [7] 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(tiazol-5-il)amino)etil)propiolamida y  
 [8] 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(1-metil-1H-imidazol-2-il)amino)etil)propiolamida;

en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

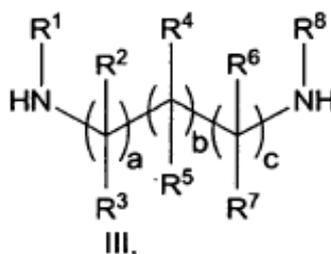
También son especialmente preferentes las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada que, después de 60 minutos de incubación en 450 µg de proteína de homogeneizado de cerebro de cerdo a una temperatura entre 20°C y 25°C, en una concentración inferior a 2000 nM, preferentemente inferior a 1000 nM, de forma especialmente preferente inferior a 700 nM, de forma totalmente preferente inferior a 100 nM, de forma todavía más preferente inferior a 30 nM, provocan un desplazamiento de un 50 por ciento de la [<sup>3</sup>H]-2-metil-6-(3-metoxifenil)etilpiridina presente en una concentración 5 nM.

La determinación del desplazamiento de la [<sup>3</sup>H]-2-metil-6-(3-metoxifenil)-etilpiridina tiene lugar tal como se describe en la sección "Métodos Farmacológicos, 1. Método para determinar la inhibición de la unión de [<sup>3</sup>H]-MPEP en el ensayo de unión a receptor mGluR5".

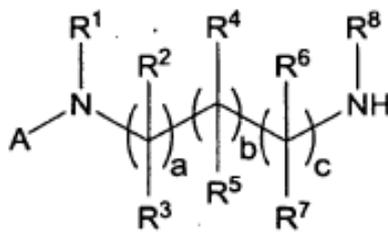
25 Otro objeto de la presente invención consiste en un procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula general I arriba mostrada, de acuerdo con el cual al menos un compuesto de fórmula general II,



en la que A tiene el significado arriba mencionado y X representa un grupo saliente, preferentemente un halógeno o un éster de ácido sulfónico, se transforma con al menos un compuesto de fórmula general III,



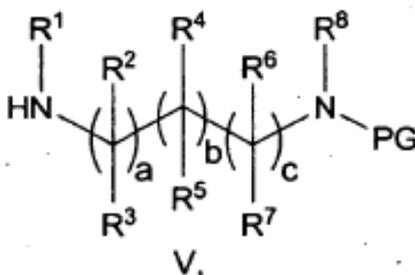
30 en la que a, b, c, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> tienen el significado arriba mencionado, en caso dado en un medio de reacción, en caso dado en presencia de al menos una base, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, bicarbonato de sodio, dimetilaminopiridina, carbonato de potasio e hidróxido de sodio, y/o al menos un compuesto organometálico y/o al menos un reactivo de hidruro metálico, preferentemente en presencia de al menos un compuesto organometálico o un reactivo de hidruro metálico  
 35 seleccionado de entre el grupo consistente en n-butil-litio, fenil-litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio y amida sódica, o en presencia de al menos una sal de cobre, preferentemente en presencia de al menos una sal de cobre seleccionada de entre el grupo consistente en cloruro de cobre (I) y yoduro de cobre (I), y en caso dado en presencia de al menos un metal, preferentemente en presencia de cobre, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 300°C, de forma especialmente preferente entre -70°C y 150°C, para obtener al menos un compuesto correspondiente de fórmula  
 40 general IV, en caso dado en forma de una sal correspondiente,



IV,

en la que a, b, c, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> tienen el significado arriba mencionado, y este compuesto en caso dado se purifica y/o se aísla;

o al menos un compuesto de fórmula general II se transforma con al menos un compuesto de fórmula general V,

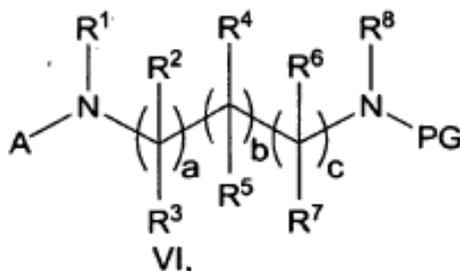


V,

5

en la que a, b, c, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> tienen el significado arriba mencionado y PG representa un grupo protector, preferentemente un grupo protector seleccionado de entre el grupo consistente en *tert*-butiloxicarbonilo, bencilo, benciloxicarbonilo y 9-fluorenilmetiloxicarbonilo, en caso dado en un medio de reacción, en caso dado en presencia de al menos una base, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, bicarbonato de sodio, dimetilaminopiridina, carbonato de potasio e hidróxido de sodio, y/o al menos un compuesto organometálico y/o al menos un reactivo de hidruro metálico, preferentemente en presencia de al menos un compuesto organometálico o un reactivo de hidruro metálico seleccionado de entre el grupo consistente en *n*-butil-litio, fenil-litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio y amida sódica, o en presencia de al menos una sal de cobre, preferentemente en presencia de al menos una sal de cobre seleccionada de entre el grupo consistente en cloruro de cobre (I) y yoduro de cobre (I), y en caso dado en presencia de al menos un metal, preferentemente en presencia de cobre, o en presencia de al menos un catalizador, preferentemente en presencia de al menos un catalizador de paladio seleccionado de entre el grupo consistente en bis(dibencilidenacetona)paladio [Pd(dba)<sub>2</sub>]; tris(dibencilidenacetona)dipaladio [Pd<sub>2</sub>dba<sub>3</sub>]; diclorobis(tri-*o*-tolilfosfina)paladio [Pd(P(*o*-Tol)<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>]; cloruro de paladio [PdCl<sub>2</sub>]; acetato de paladio [Pd(OAc)<sub>2</sub>]; trifluoroacetato de paladio [Pd(O<sub>2</sub>CCF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]; tetraquis-trifenilfosfinapaladio [Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>]; dicloruro de bistrifenilfosfinapaladio [Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>]; acetato de bistrifenilfosfinapaladio [Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>(OAc)<sub>2</sub>] y dicloro[1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio [Pd(dppf)Cl<sub>2</sub>], en caso dado en presencia de al menos un ligando, preferentemente en presencia de al menos un ligando seleccionado de entre el grupo consistente en (±)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftaleno (BINAP), difenilfosfinoferroceno (dppf), tri-*tert*-butilfosfina [P(*t*Bu)<sub>3</sub>], trifenilfosfina [P(Ph)<sub>3</sub>], tri-*orto*-tolilfosfina [P(*o*Tol)<sub>3</sub>], tri-2-furilfosfina [P(2-furilo)<sub>3</sub>], díciclohexil-(2',6'-dimetoxibifenil-2-il)fosfina, díciclohexil-(2',6'-diisopropoxibifenil-2-il)fosfina y bifenil-2-ildiciclohexilfosfina, en caso dado en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica seleccionada de entre el grupo consistente en *tert*-butilato de potasio, *tert*-butilato de sodio, fosfato tri-potásico, carbonato de cesio, litio-bis(trimetilsilil)amida, sodio-bis(trimetilsilil)amida y potasio-bis(trimetilsilil)amida, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 300°C, para obtener al menos un compuesto correspondiente de fórmula general VI,

25

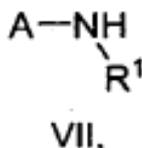


VI,

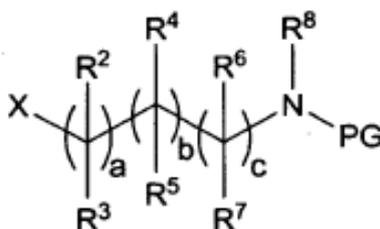
30

en la que a, b, c, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y PG tienen el significado arriba mencionado, y este compuesto en caso dado se purifica y/o se aísla;

o al menos un compuesto de fórmula general VII,



- 5 en la que R<sup>1</sup> y A tienen el significado arriba mencionado, se transforma con al menos un compuesto de fórmula general VIII,

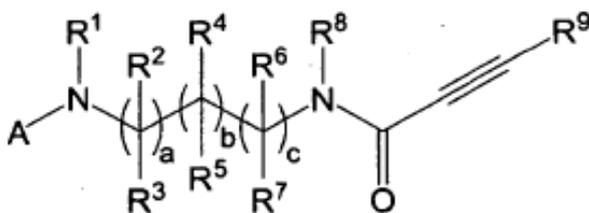


VIII,

- 10 en la que a, b, c, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y PG tienen el significado arriba mencionado, y X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, de forma especialmente preferente un átomo de cloro o de bromo, en caso dado en un medio de reacción, en caso dado en presencia de al menos una base, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada de entre el grupo consistente en *tert*-butilato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, dimetilamina y trietilamina, de forma especialmente preferente en presencia de dietilamina, o en caso dado en presencia de al menos un compuesto organometálico, preferentemente en presencia de al menos un compuesto organometálico seleccionado de entre el grupo consistente en metil-litio y butil-litio, o en caso dado en presencia de al menos un compuesto de hidruro metálico, de forma especialmente preferente en presencia de hidruro de sodio, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 300°C, de forma especialmente preferente entre -70 °C y 150°C, para obtener al menos un compuesto correspondiente de fórmula general VI, y este compuesto en caso dado se purifica y/o se aísla;

- 20 y al menos un compuesto de fórmula general VI, cuando PG representa un grupo *tert*-butoxicarbonilo o 9-fluorenilmetiloxycarbonilo, se transforma en un medio de reacción, en presencia de al menos un ácido, preferentemente en presencia de al menos un ácido seleccionado de entre el grupo consistente en ácido clorhídrico y ácido trifluoroacético, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 100°C, o, cuando PG representa un grupo bencilo o benciloxicarbonilo, se transforma en un medio de reacción, en presencia de hidrógeno y en presencia de al menos un catalizador, preferentemente en presencia de paladio/carbono, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 100°C, para obtener al menos un compuesto correspondiente de fórmula general IV, en caso dado en forma de una sal correspondiente, y este compuesto en caso dado se purifica y/o se aísla;

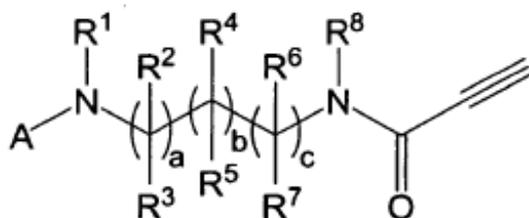
- 30 y al menos un compuesto de fórmula general IV se somete a reacción con al menos un compuesto de fórmula general R<sup>9</sup>-C≡C-C(=O)-OH, en la que R<sup>9</sup> tiene el significado arriba mencionado, en un medio de reacción, en caso dado en presencia de al menos un medio de acoplamiento adecuado, en caso dado en presencia de al menos una base, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, piridina, dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina y N-metilmorfolina, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 100°C; o se somete a reacción con al menos un compuesto de fórmula general R<sup>9</sup>-C≡C-C(=O)-X, en la que R<sup>9</sup> tiene el significado arriba mencionado y X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno, de forma especialmente preferente cloro o bromo, en un medio de reacción, en caso dado en presencia de al menos una base, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, dimetilaminopiridina, piridina y diisopropiletilamina, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 100°C, para obtener al menos un compuesto correspondiente de fórmula general I, en caso dado en forma de una sal correspondiente,



I,

en la que a, b, c, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> tienen el significado arriba mencionado, y este compuesto en caso dado se purifica y/o se aísla;

5 o al menos un compuesto de fórmula general IV se somete a reacción con ácido propiólico [HC≡C-C(=O)-OH] en un medio de reacción, en caso dado en presencia de al menos un medio de acoplamiento adecuado, en caso dado en presencia de al menos una base, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, piridina, dimetilaminopiridina, diisopropilamina y N-metilmorfolina, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 100°C; o se somete a reacción con al menos un compuesto de fórmula general HC≡C-C(=O)-X, en la que X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno, de forma especialmente preferente cloro o bromo, en un medio de reacción, en caso dado en presencia de al menos una base, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, dimetilaminopiridina, piridina y diisopropilamina, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 100°C, para obtener al menos un compuesto correspondiente de fórmula general IX, en caso dado en forma de una sal correspondiente,

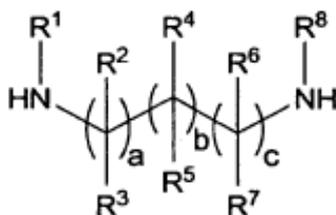


IX,

15 en la que a, b, c, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> tienen el significado arriba mencionado, y este compuesto en caso dado se purifica y/o se aísla;

20 y al menos un compuesto de fórmula general IX se somete a reacción con al menos un compuesto de fórmula general R<sup>9</sup>-X, en la que R<sup>9</sup> tiene el significado arriba mencionado y X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, de forma especialmente preferente yodo, bromo o triflato, en un medio de reacción, en caso dado en presencia de al menos un catalizador, preferentemente en presencia de al menos un catalizador de paladio seleccionado de entre el grupo consistente en cloruro de paladio [PdCl<sub>2</sub>], acetato de paladio [Pd(OAc)<sub>2</sub>], tetraquis-trifenilfosfinapaladio [Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>], dicloruro de bistrifenilfosfinapaladio [Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>] y acetato de bistrifenilfosfinapaladio [Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>(OAc)<sub>2</sub>], en caso dado en presencia de al menos un ligando, preferentemente en presencia de al menos un ligando seleccionado de entre el grupo consistente en trifenilfosfina, trifenilarsina y tri-2-furilfosfina, en caso dado en presencia de al menos una sal inorgánica, preferentemente en presencia de al menos una sal inorgánica seleccionada de entre el grupo consistente en cloruro de litio y cloruro de zinc, en caso dado en presencia de al menos una sal de cobre, preferentemente en presencia de yoduro de cobre, en caso dado en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, [1,4]-diazabicyclo-[2.2.2]-octano, diisopropilamina, diisopropilamina, carbonato de potasio y bicarbonato de sodio, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 300°C, para obtener al menos un compuesto correspondiente de fórmula general I, en caso dado en forma de una sal correspondiente, y este compuesto en caso dado se purifica y/o se aísla.

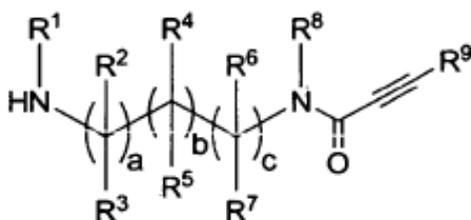
Otro objeto de la presente invención consiste en un procedimiento para la preparación de los compuestos de fórmula general I, en el que al menos un compuesto de fórmula general III,



III,

en la que a, b, c, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> tienen el significado arriba mencionado,

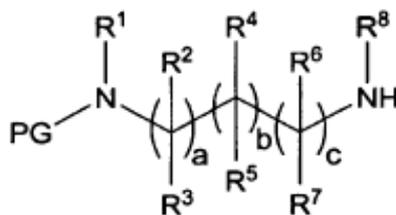
- 5 se somete a reacción con al menos un compuesto de fórmula general R<sup>9</sup>-C≡C-C(=O)-OH, en la que R<sup>9</sup> tiene el significado arriba mencionado, en un medio de reacción, en caso dado en presencia de al menos un medio de acoplamiento adecuado, en caso dado en presencia de al menos una base, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, piridina, dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina y N-metilmorfolina, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 100°C; o se somete a reacción con al menos un compuesto de fórmula general R<sup>9</sup>-C≡C-C(=O)-X, en la que R<sup>9</sup> tiene el significado arriba mencionado y X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno, de forma especialmente preferente cloro o bromo, en un medio de reacción, en caso dado en presencia de al menos una base, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, dimetilaminopiridina, piridina y diisopropiletilamina, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 100°C, para obtener al menos un compuesto correspondiente de fórmula general XI, en caso dado en forma de una sal correspondiente,



XI,

- 15 en la que a, b, c, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> tienen el significado arriba mencionado, y este compuesto en caso dado se purifica y/o se aísla;

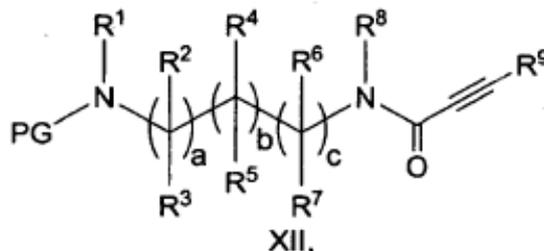
o al menos un compuesto de fórmula general V,



V,

- 20 en la que a, b, c, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> tienen el significado arriba mencionado y PG representa un grupo protector, preferentemente un grupo protector seleccionado de entre el grupo consistente en terc-butiloxicarbonilo, bencilo, benciloxicarbonilo y 9-fluorenilmetiloxicarbonilo, se somete a reacción con al menos un compuesto de fórmula general R<sup>9</sup>-C≡C-C(=O)-OH, en la que R<sup>9</sup> tiene el significado arriba mencionado, en un medio de reacción, en caso dado en presencia de al menos un medio de acoplamiento adecuado, en caso dado en presencia de al menos una base, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, piridina, dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina y N-metilmorfolina, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 100°C; o se somete a reacción con al menos un compuesto de fórmula general R<sup>9</sup>-C≡C-C(=O)-X, en la que R<sup>9</sup> tiene el significado arriba mencionado y X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno, de forma especialmente

preferente cloro o bromo, en un medio de reacción, en caso dado en presencia de al menos una base, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, dimetilaminopiridina, piridina y diisopropiletilamina, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 100°C, para obtener al menos un compuesto correspondiente de fórmula general XII, en caso dado en forma de una sal correspondiente,



5

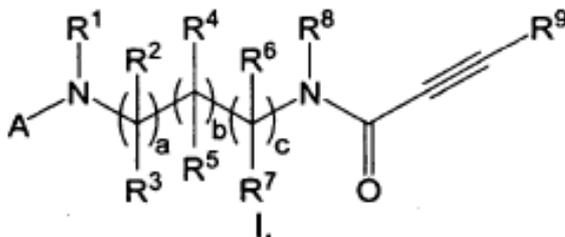
en la que a, b, c, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> y PG tienen el significado arriba mencionado, y este compuesto en caso dado se purifica y/o se aísla;

5 y al menos un compuesto de fórmula general XII, cuando PG representa un grupo terc-butoxicarbonilo o 9-fluorenilmetiloxycarbonilo, se transforma en un medio de reacción, en presencia de al menos un ácido, preferentemente  
10 en presencia de al menos un ácido seleccionado de entre el grupo consistente en ácido clorhídrico y ácido trifluoroacético, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 100°C, o, cuando PG representa un grupo bencilo o benciloxicarbonilo, se transforma en un medio de reacción, en presencia de hidrógeno y en presencia de al menos un catalizador, preferentemente en presencia de paladio/carbono, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 100°C,  
15 para obtener al menos un compuesto correspondiente de fórmula general XI, en caso dado en forma de una sal correspondiente, y este compuesto en caso dado se purifica y/o se aísla;

y al menos un compuesto de fórmula general XI se somete a reacción con al menos un compuesto de fórmula general II,

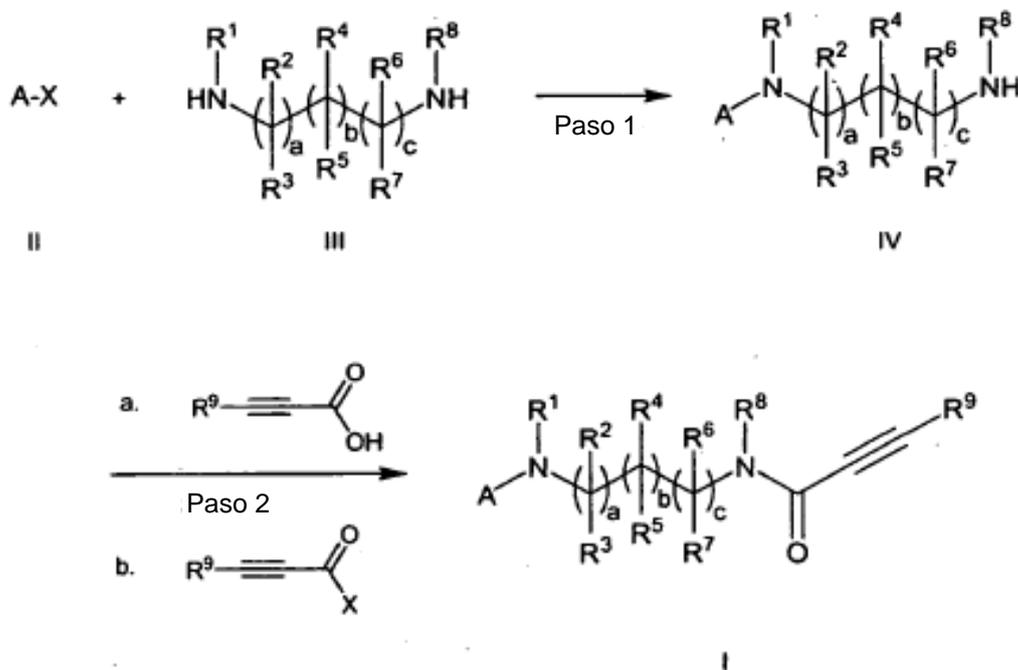


en la que el grupo A tiene el significado arriba mencionado y X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo  
20 halógeno o un éster de ácido sulfónico, en un medio de reacción, en caso dado en presencia de al menos una base, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, bicarbonato de sodio, dimetilaminopiridina, carbonato de potasio e hidróxido de sodio, y/o al menos un compuesto organometálico y/o al menos un reactivo de hidruro metálico, preferentemente en presencia de al menos un compuesto organometálico o un reactivo de hidruro metálico seleccionado de entre el grupo consistente en n-butil-litio, fenil-litio,  
25 hidruro de sodio, hidruro de potasio y amida sódica, o en presencia de al menos una sal de cobre, preferentemente en presencia de al menos una sal de cobre seleccionada de entre el grupo consistente en cloruro de cobre (I) y yoduro de cobre (I), y en caso dado en presencia de al menos un metal, preferentemente en presencia de cobre, o en presencia de al menos un catalizador, preferentemente en presencia de al menos un catalizador de paladio seleccionado de entre el grupo consistente en bis(dibencilidenacetona)paladio [Pd(dba)<sub>2</sub>]; tris(dibencilidenacetona)dipaladio [Pd<sub>2</sub>dba<sub>3</sub>];  
30 diclorobis(tri-*o*-tolilfosfina)paladio [Pd(P(*o*-Tol)<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>]; cloruro de paladio [PdCl<sub>2</sub>]; acetato de paladio [Pd(OAc)<sub>2</sub>]; trifluoroacetato de paladio [Pd(O<sub>2</sub>CCF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]; tetraquis-trifenilfosfinapaladio [Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>]; dicloruro de bistrifenilfosfinapaladio [Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>]; acetato de bistrifenilfosfinapaladio [Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>(OAc)<sub>2</sub>] y dicloro[1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio [Pd(dppf)Cl<sub>2</sub>], en caso dado en presencia de al menos un ligando, preferentemente en presencia de al menos un ligando  
35 seleccionado de entre el grupo consistente en (±)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftaleno (BINAP), difenilfosfiferroceno (dppf), tri-*tert*-butilfosfina [P(*t*Bu)<sub>3</sub>], trifenilfosfina [P(Ph)<sub>3</sub>], tri-*orto*-tolilfosfina [P(*o*Tol)<sub>3</sub>], tri-2-furilfosfina [P(2-furilo)<sub>3</sub>], dicitclohexil-(2',6'-dimetoxibifenil-2-il)fosfina, dicitclohexil-(2',6'-diisopropoxibifenil-2-il)fosfina y bifenil-2-ildicitclohexilfosfina, en caso dado en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica seleccionada de entre el grupo consistente en *tert*-butilato de potasio, *tert*-butilato de sodio, fosfato tri-potásico, carbonato de cesio, litio-bis(trimetilsilil)amida, sodio-bis(trimetilsilil)amida y potasio-bis(trimetilsilil)amida, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 300°C, para  
40 obtener al menos un compuesto correspondiente de fórmula general I, en caso dado en forma de una sal correspondiente,



en la que a, b, c, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> tienen el significado arriba mencionado, y este compuesto en caso dado se purifica y/o se aísla.

El siguiente esquema 1 también muestra un procedimiento según la invención para la preparación de amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada.



5

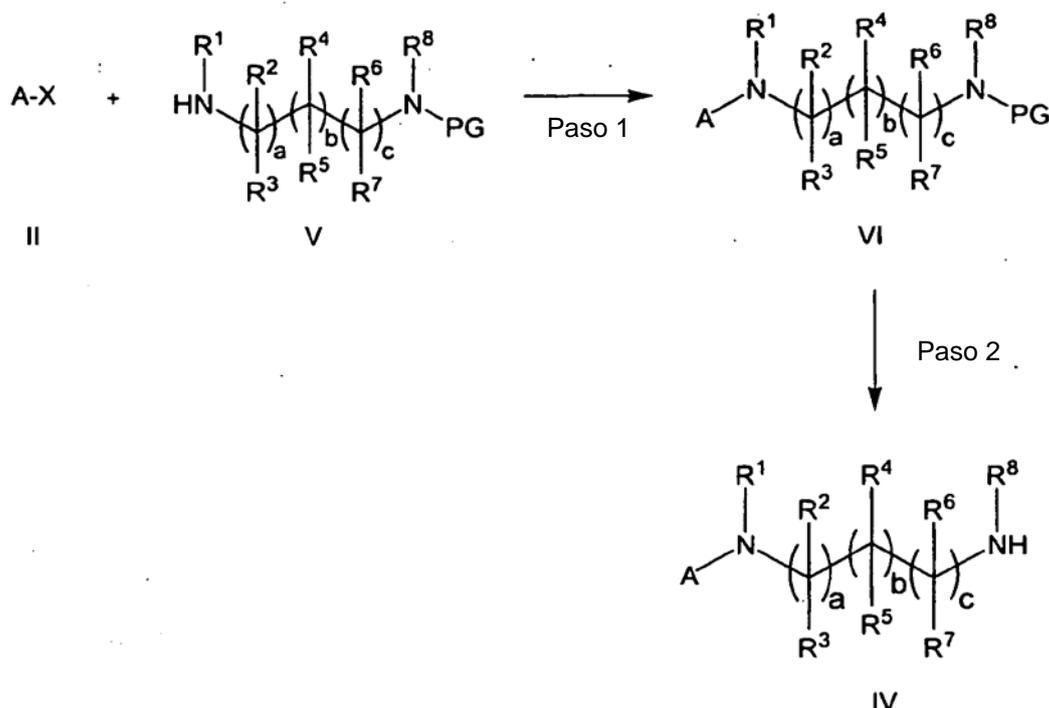
### Esquema 1

En el paso 1, los compuestos de la fórmula general II arriba mostrada, en la que X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico seleccionado de entre el grupo consistente en mesilato, triflato y tosilato, de forma especialmente preferente un átomo de cloro o bromo, se someten a reacción con los compuestos de la fórmula general III arriba mostrada, en caso dado en un medio de reacción, preferentemente seleccionado de entre el grupo consistente en metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, éter dietílico, tetrahydrofurano, diclorometano, cloroformo, dimetilformamida, acetonitrilo, piridina, dioxano, acetato de etilo, sulfóxido de dimetilo, tolueno y mezclas correspondientes, de forma especialmente preferente en un medio de reacción seleccionado de entre el grupo consistente en metanol, etanol y n-butanol, en caso dado en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, preferentemente seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, bicarbonato de sodio, dimetilaminopiridina, carbonato de potasio e hidróxido de sodio, y/o en caso dado en presencia de al menos una sal metálica, preferentemente una sal de cobre, de forma especialmente preferente yoduro de cobre (I) o cloruro de cobre (I), y en caso dado en presencia de al menos un metal, preferentemente cobre, y/o en caso dado en presencia de al menos un compuesto organometálico o un reactivo de hidruro metálico, preferentemente seleccionado de entre el grupo consistente en n-butil-litio, fenil-litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio y amida sódica, preferiblemente a temperaturas entre  $-70^{\circ}C$  y  $300^{\circ}C$ , de forma especialmente preferente a temperaturas entre  $-70^{\circ}C$  y  $150^{\circ}C$ , para obtener los compuestos de fórmula general IV.

En el paso 2, los compuestos de la fórmula general IV arriba mostrada se someten a reacción con los ácidos carboxílicos de fórmula general  $R^9-C\equiv C-C(=O)-OH$  arriba indicada, en un medio de reacción, preferentemente seleccionado de entre el grupo consistente en éter dietílico, tetrahydrofurano, acetonitrilo, metanol, etanol, (1,2)-dicloroetano, dimetilformamida, diclorometano y mezclas correspondientes, en caso dado en presencia de al menos un medio de acoplamiento, preferentemente seleccionado de entre el grupo consistente en hexafluorofosfato de 1-benzotriazoliloxi-tris(dimetilamino)-fosfonio (BOP), diciclohexilcarbodiimida (DCC), N'-(3-dimetilaminopropil)-N-etilcarbodiimida (EDCI), diisopropilcarbodiimida, PL-EDC (cloruro de N-bencil-3-((etilimino)metileno)amino)-N,N-dimetilpropan-1-amino unido a polímero), 1,1'-carbonildiimidazol (CDI), N-óxido de hexafluorofosfato de N-[[dimetilamino]-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]piridino-1-ilmetileno]-N-metilmetanoaminio (HATU), hexafluorofosfato de O-(benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (HBTU), tetrafluoroborato de O-(benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (TBTU), 1-hidroxi-7-azabenzotriazol (HOAt) y resina de carbodiimida unida a polímero (PS-carbodiimid resing, PSii), de forma especialmente preferente en presencia de un medio de acoplamiento seleccionado de entre el grupo consistente en TBTU, EDCI y PL-EDC, en caso dado en presencia de al menos una base orgánica, preferentemente seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, piridina, dimetilaminopiridina, N-metilmorfolina, [1,4]-diazabicyclo-[2.2.2]-octano (DABCO), 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU), 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno (DBN) y

diisopropiletilamina, preferentemente en presencia de diisopropiletilamina o trietilamina, preferiblemente a temperaturas entre  $-70^{\circ}\text{C}$  y  $250^{\circ}\text{C}$ , para obtener los compuestos de fórmula general I.

- Alternativamente, los compuestos de la fórmula general IV arriba mostrada se someten a reacción con los derivados de ácido carboxílico de fórmula  $\text{R}^9\text{-C}\equiv\text{C-C(=O)-X}$ , en la que X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno, de forma especialmente preferente cloro o bromo, en un medio de reacción, preferentemente seleccionado de entre el grupo consistente en éter dietílico, tetrahydrofurano, acetonitrilo, metanol, etanol, dimetilformamida, diclorometano, 1,2-diclorometano y mezclas correspondientes, en caso dado en presencia de una base orgánica o inorgánica, preferentemente seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, dimetilaminopiridina, piridina y diisopropilamina, a temperaturas entre  $-70^{\circ}\text{C}$  y  $250^{\circ}\text{C}$ , para obtener los compuestos de fórmula general I.
- 10 El siguiente Esquema 2 también muestra otro procedimiento según la invención para la preparación de los compuestos de fórmula general IV.



### Esquema 2

- En el paso 1, los compuestos de la fórmula general II arriba mostrada, en la que X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico seleccionado de entre el grupo consistente en mesilato, triflato y tosilato, de forma especialmente preferente un átomo de cloro o bromo, se someten a reacción con los compuestos de la fórmula general V arriba mostrada, en la que PG representa un grupo protector, preferentemente un grupo protector seleccionado de entre el grupo consistente en terc-butiloxicarbonilo, benciloxicarbonilo, bencilo y 9-fluorenilmetiloxicarbonilo, en caso dado en un medio de reacción, preferentemente seleccionado de entre el grupo consistente en metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, éter dietílico, tetrahydrofurano, diclorometano, cloroformo, dimetilformamida, acetonitrilo, piridina, dioxano, acetato de etilo, sulfóxido de dimetilo, tolueno y mezclas correspondientes, de forma especialmente preferente en un medio de reacción seleccionado de entre el grupo consistente en metanol, etanol y n-butanol, en caso dado en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, preferentemente seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, bicarbonato de sodio, dimetilaminopiridina, carbonato de potasio e hidróxido de sodio, y/o en caso dado en presencia de al menos una sal metálica, preferentemente una sal de cobre, de forma especialmente preferente yoduro de cobre (I) o cloruro de cobre (I), y en caso dado en presencia de al menos un metal, preferentemente cobre, y/o en caso dado en presencia de al menos un compuesto organometálico o un reactivo de hidruro metálico, preferentemente seleccionado de entre el grupo consistente en n-butil-litio, fenil-litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio y amida sódica, preferiblemente a temperaturas entre  $-70^{\circ}\text{C}$  y  $300^{\circ}\text{C}$ , de forma especialmente preferente a temperaturas entre  $-70^{\circ}\text{C}$  y  $150^{\circ}\text{C}$ , para obtener los compuestos de fórmula general VI.

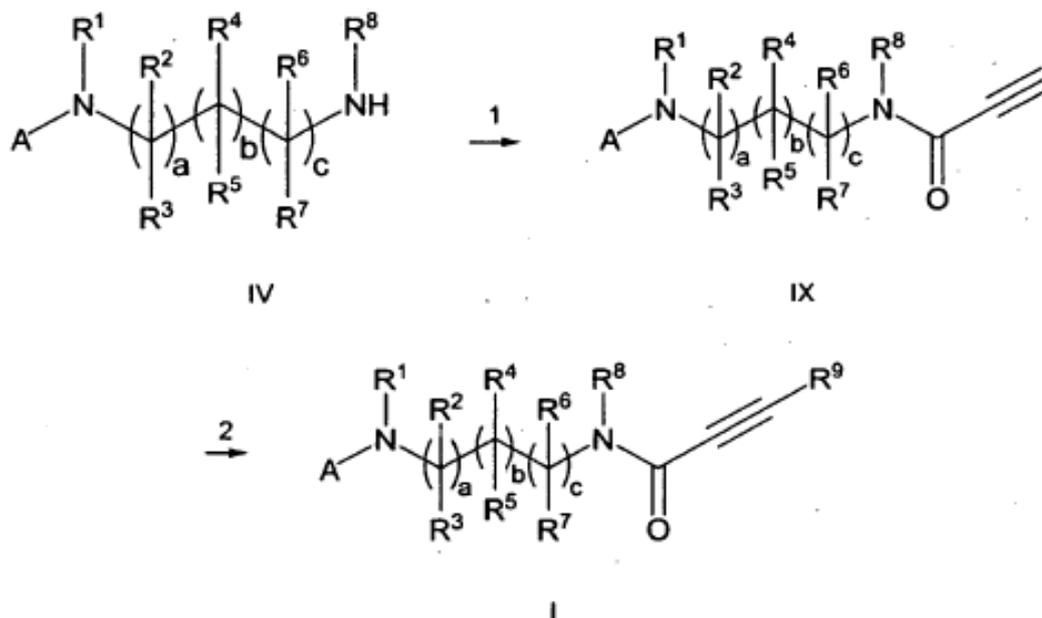
- Alternativamente, en el paso 1, los compuestos de fórmula general II, en la que X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico seleccionado de entre el grupo consistente en mesilato, triflato y tosilato, de forma especialmente preferente un átomo de cloro, bromo o yodo o un triflato, se someten a reacción con los compuestos de la fórmula general V arriba mostrada, en caso dado en un medio de reacción,

preferentemente en un medio de reacción seleccionado de entre el grupo consistente en benceno, tolueno, xileno, trimetilbenceno, tetrahidrofurano, dimetoxietano, dioxano y mezclas correspondientes, de forma especialmente preferente en un medio de reacción seleccionado de entre el grupo consistente en tolueno, xileno y trimetilbenceno, en caso dado en presencia de al menos un catalizador, preferentemente en presencia de al menos un catalizador seleccionado de entre el grupo consistente en bis(dibencilidenacetona)paladio [Pd(dba)<sub>2</sub>], tris(dibencilidenacetona)dipaladio [Pd<sub>2</sub>dba<sub>3</sub>], diclorobis(tri-*o*-tolilfosfina)paladio [Pd(P(*o*-Tol)<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>], cloruro de paladio [PdCl<sub>2</sub>], acetato de paladio [Pd(OAc)<sub>2</sub>], trifluoroacetato de paladio [Pd(O<sub>2</sub>CCF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>], tetraquis-trifenilfosfinapaladio [Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>], dicloruro de bistrifenilfosfinapaladio [Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>], acetato de bistrifenilfosfinapaladio [Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>(OAc)<sub>2</sub>] y dicloro[1,1'-bis(difenilfosfin)ferroceno]paladio [Pd(dppf)Cl<sub>2</sub>], de forma especialmente preferente en presencia de un catalizador seleccionado de entre el grupo consistente en [Pd(dba)<sub>2</sub>], [Pd<sub>2</sub>dba<sub>3</sub>], [Pd(P(*o*-Tol)<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>], [Pd(O<sub>2</sub>CCF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>], [Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>] y [Pd(OAc)<sub>2</sub>], en caso dado en presencia de al menos un ligando, preferentemente en presencia de al menos un ligando seleccionado de entre el grupo consistente en (±)-2,2'-bis(difenilfosfin)-1,1'-binaftaleno (BINAP), difenilfosfinferroceno (dppf), tri-*terc*-butilfosfina [P(*t*Bu)<sub>3</sub>], trifenilfosfina [P(Ph)<sub>3</sub>], tri-*orto*-tolilfosfina [P(*o*Tol)<sub>3</sub>], tri-2-furilfosfina [P(2-furilo)<sub>3</sub>], ligandos de biarilfosfina estéricamente exigentes (ligandos de Buchwald) como dicitclohexil-(2',6'-dimetoxibifenil-2-il)fosfina, dicitclohexil-(2',6'-diisopropoxibifenil-2-il)fosfina y bifenil-2-ildicitclohexilfosfina, de forma especialmente preferente en presencia de al menos un ligando seleccionado de entre el grupo consistente en [P(*t*Bu)<sub>3</sub>], dicitclohexil-(2',6'-dimetoxibifenil-2-il)fosfina y dicitclohexil-(2',6'-diisopropoxibifenil-2-il)fosfina, en caso dado en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica seleccionada de entre el grupo consistente en *terc*-butilato de potasio (KO*t*Bu), *terc*-butilato de sodio (Na*t*Bu), fosfato tri-potásico (K<sub>3</sub>PO<sub>4</sub>), carbonato de cesio (Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>), litio-bis(trimetilsilil)amida [LiN(SiMe<sub>3</sub>)<sub>2</sub>], sodio-bis(trimetilsilil)amida [NaN(SiMe<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] y potasio-bis(trimetilsilil)amida [KN(SiMe<sub>3</sub>)<sub>2</sub>], preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 300°C, para obtener al menos un compuesto de fórmula general IV. De forma especialmente preferente, los compuestos de fórmula general II se someten a reacción con los compuestos de fórmula general V en 1,2,4-trimetilbenceno en presencia de Pd(dba)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, [P(*t*Bu)<sub>3</sub>] y NaO*t*Bu, para obtener los compuestos de fórmula general VI.

En el paso 2, los compuestos de fórmula general VI, cuando PG representa un grupo *terc*-butoxicarbonilo o 9-fluorenilmetiloxicarbonilo, se transforman en un medio de reacción, preferentemente en un medio de reacción seleccionado de entre el grupo consistente en metanol, acetato de etilo, etanol, isopropanol, *n*-butanol, éter dietílico, dioxano, tetrahidrofurano, cloroformo, diclorometano, dimetilformamida, acetonitrilo, piridina, sulfóxido de dimetilo, tolueno y mezclas correspondientes, en presencia de al menos un ácido, preferentemente en presencia de al menos un ácido seleccionado de entre el grupo consistente en ácido clorhídrico y ácido trifluoroacético, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 100°C; o, cuando PG representa un grupo bencilo o benciloxicarbonilo, se transforman en un medio de reacción, preferentemente en un medio de reacción seleccionado de entre el grupo consistente en metanol, acetato de etilo, etanol, isopropanol, *n*-butanol, éter dietílico, dioxano, tetrahidrofurano, cloroformo, diclorometano, dimetilformamida, acetonitrilo, piridina, sulfóxido de dimetilo, tolueno y mezclas correspondientes, en presencia de hidrógeno y en presencia de al menos un catalizador, preferentemente en presencia de paladio/carbono, preferiblemente a una temperatura entre -70°C y 100°C, para obtener un compuesto correspondiente de fórmula general IV.

Los métodos adecuados para eliminar los grupos protectores arriba mencionados también se pueden consultar en las monografías Protective Groups in Organic Synthesis, T. W. Greene y col., 3ª edición, 1999, Wiley, Nueva York, y Protecting Groups, P. J. Kocienski, 3ª edición, 2004, Editorial Georg Thieme, Stuttgart 2004. Las partes correspondientes de las referencias sirven como parte de esta exposición.

El siguiente Esquema 3 también muestra un procedimiento según la invención para la preparación de las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada.

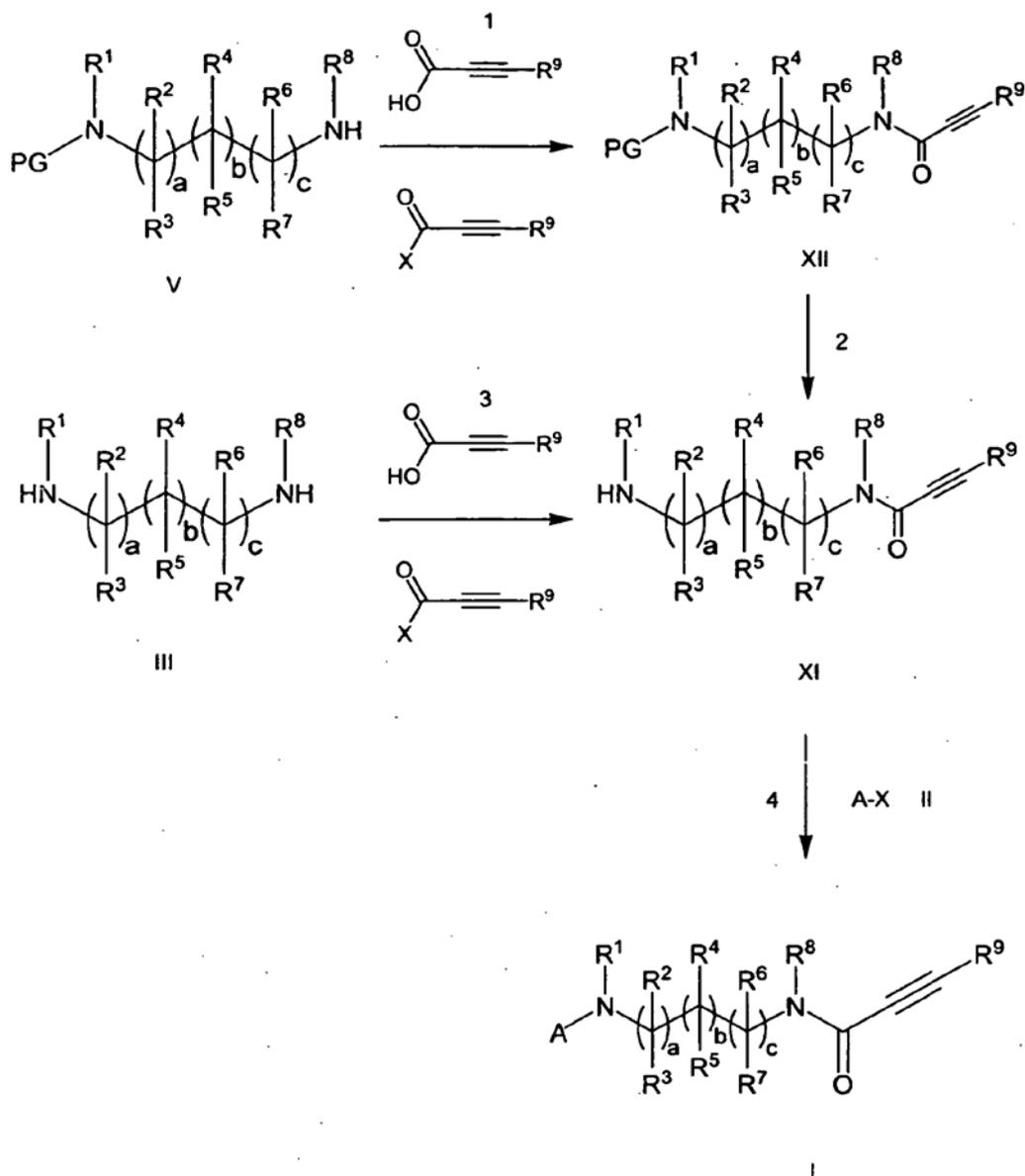


### Esquema 3

En el paso 1, los compuestos de la fórmula general IV arriba mostrada se someten a reacción con ácido propiónico  $\text{H}-\text{C}\equiv\text{C}(=\text{O})-\text{OH}$  o con derivados de ácido carboxílico de fórmula general  $\text{H}-\text{C}\equiv\text{C}(\text{C}-\text{O})-\text{X}$ , en la que X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno, de forma especialmente preferente cloro o bromo, tal como se describe en el Esquema 1, paso 2, para obtener los compuestos de fórmula general IX.

En el paso 2, los compuestos de la fórmula general IX arriba mostrada se someten a reacción con los compuestos de fórmula general  $\text{R}^9-\text{X}$ , en la que  $\text{R}^9$  tiene el significado arriba mencionado a excepción de hidrógeno y X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, de forma especialmente preferente yodo, bromo o triflato, en un medio de reacción, preferentemente en un medio de reacción seleccionado de entre el grupo consistente en metanol, acetato de etilo, etanol, isopropanol, n-butanol, éter dietílico, dioxano, tetrahidrofurano, cloroformo, diclorometano, dimetilformamida, acetonitrilo, piridina, sulfóxido de dimetilo, agua, tolueno y mezclas correspondientes, preferiblemente en dimetilformamida, agua, acetato de etilo, tetrahidrofurano y mezclas correspondientes, en caso dado en presencia de al menos un catalizador, preferentemente en presencia de al menos un catalizador seleccionado de entre el grupo consistente en cloruro de paladio  $[\text{PdCl}_2]$ , acetato de paladio  $[\text{Pd}(\text{OAc})_2]$ , tetraquis-trifenilfosfinapaladio  $[\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4]$ , dicloruro de bistrifenilfosfinapaladio  $[\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2\text{Cl}_2]$ , y acetato de bistrifenilfosfinapaladio  $[\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2(\text{OAc})_2]$ , de forma especialmente preferente en presencia de un catalizador seleccionado de entre el grupo consistente en  $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ ,  $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2\text{Cl}_2$  y  $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2(\text{OAc})_2$ , en caso dado en presencia de al menos un ligando, preferentemente en presencia de al menos un ligando seleccionado de entre el grupo consistente en trifenilfosfina, trifenilarsina y tri-2-furil-fosfina, preferiblemente en presencia de trifenilfosfina, en caso dado en presencia de al menos una sal inorgánica, preferentemente en presencia de al menos una sal inorgánica seleccionada de entre el grupo consistente en cloruro de litio y cloruro de zinc, en caso dado en presencia de al menos una sal de cobre, preferentemente en presencia de yoduro de cobre, en caso dado en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, [1,4]-diazabicyclo-[2.2.2]-octano, diisopropilamina, diisopropiletilamina, carbonato de potasio y bicarbonato de sodio, preferiblemente a una temperatura entre  $-70^\circ\text{C}$  y  $300^\circ\text{C}$ , para obtener al menos un compuesto de fórmula general I. De forma especialmente preferente se someten a reacción los compuestos de fórmula general  $\text{R}^9-\text{I}$  o  $\text{R}^9-\text{Br}$  con los compuestos de fórmula general IX en dimetilformamida en presencia de  $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2\text{Cl}_2$ , yoduro de cobre (I) y diisopropilamina o trietilamina.

El siguiente Esquema 4 también muestra otro procedimiento según la invención para la preparación de amidas de ácido propiónico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada.



#### Esquema 4

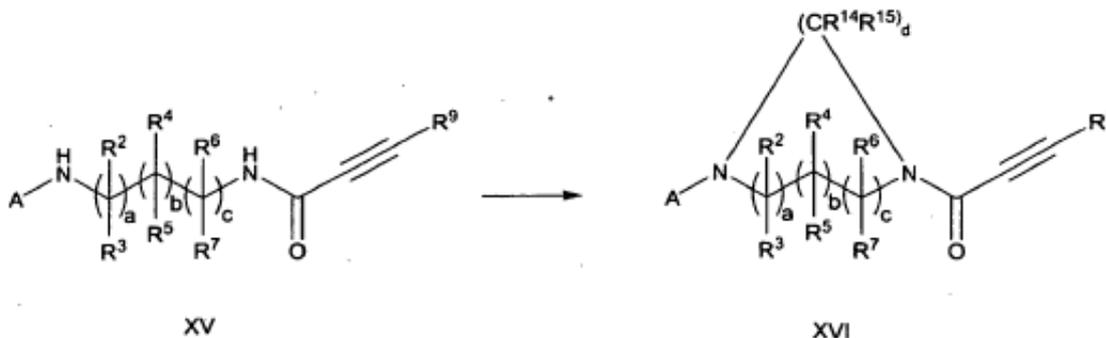
En el paso 1, los compuestos de fórmula general V, en la que PG representa un grupo protector, preferentemente un grupo protector seleccionado de entre el grupo consistente en terc-butiloxycarbonilo, bencilo, benciloxycarbonilo y 9-fluorenilmetiloxycarbonilo, se someten a reacción con compuestos de fórmula general R<sup>9</sup>-C≡C-C(=O)-OH o R<sup>9</sup>-C≡C-C(=O)-X, en la que X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno, de forma especialmente preferente cloro o bromo, tal como se indica en el Esquema 1, paso 2, para obtener los compuestos de fórmula general XII.

En el paso 2, los compuestos de fórmula general XII, en la que PG representa un grupo protector, preferentemente un grupo protector seleccionado de entre el grupo consistente en terc-butiloxycarbonilo, bencilo, benciloxycarbonilo y 9-fluorenilmetiloxycarbonilo, se someten a reacción tal como se describe en el Esquema 2, paso 2, para obtener los compuestos de fórmula general XI.

En el paso 3, los compuestos de la fórmula general III arriba mostrada se someten a reacción con ácido propiólico H-C≡C-C(=O)-OH o con derivados de ácido carboxílico de fórmula general H-C≡C-C(=O)-X, en la que X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno, de forma especialmente preferente cloro o bromo, tal como se indica en el Esquema 1, paso 2, para obtener los compuestos de fórmula general XI.

En el paso 4, los compuestos de fórmula general XI se someten a reacción con los compuestos de fórmula general II, tal como se describe en el Esquema 2, paso 1, para obtener los compuestos de fórmula general I.

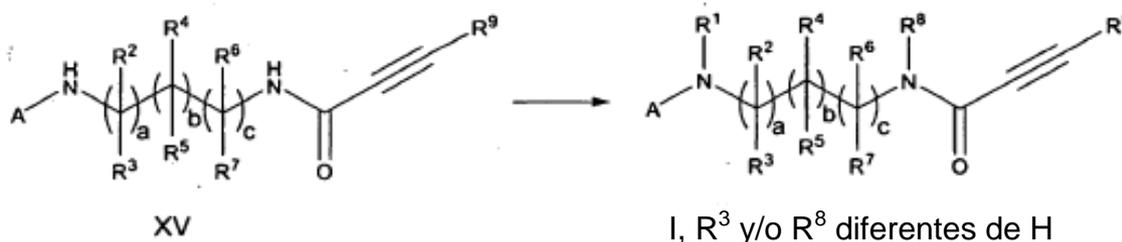
Los compuestos de fórmula general I en los que  $R^1$  y  $R^8$  representan en cada caso un grupo hidrógeno, designados en adelante como compuestos de fórmula general XV, se pueden transformar en los compuestos de fórmula general I en los que  $R^3$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-(CR^2R^3)_a-(CR^4R^5)_b-(CR^6R^7)_c-N$  que los une, forman un grupo cíclico, designados en adelante como compuestos de fórmula general XVI.



5

- Los compuestos de fórmula general XV se pueden someter a reacción con los compuestos de fórmula general Y- $(CR^{14}R^{15})_d-W$ , en la que Y y W representan en cada caso, independientemente entre sí, un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico seleccionado de entre el grupo consistente en mesilato, triflato y tosilato, de forma especialmente preferente un átomo de cloro o bromo, en caso dado en un medio de reacción, preferentemente seleccionado de entre el grupo consistente en metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, éter dietílico, tetrahydrofurano, diclorometano, cloroformo, dimetilformamida, acetonitrilo, piridina, dioxano, acetato de etilo, sulfóxido de dimetilo, tolueno y mezclas correspondientes, de forma especialmente preferente en un medio de reacción seleccionado de entre el grupo consistente en acetonitrilo, dicloroetano, cloroformo, dimetilformamida, tetrahydrofurano y éter dietílico, en caso dado en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, preferentemente seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, bicarbonato de sodio, dimetilaminopiridina, carbonato de potasio e hidróxido de sodio, y/o en caso dado en presencia de al menos un compuesto organometálico o un reactivo de hidruro metálico, preferentemente seleccionado de entre el grupo consistente en n-butil-litio, fenil-litio, hidruro de sodio, terc-butanolato de potasio, hidruro de potasio y amida sódica, preferiblemente a temperaturas entre  $-70^{\circ}C$  y  $300^{\circ}C$ , de forma especialmente preferente a temperaturas entre  $-70^{\circ}C$  y  $150^{\circ}C$ , para obtener los compuestos de fórmula general XVI.
- También preferentemente, la reacción de los compuestos de fórmula general XV tiene lugar con paraformaldehído para obtener los compuestos de fórmula general XVI en la que  $R^{14}$  y  $R^{15}$  representan en cada caso H y d es igual a 1, en un medio de reacción, de forma especialmente preferente en un medio de reacción seleccionado de entre el grupo consistente en acetonitrilo, tolueno, diclorometano, tetrahydrofurano o éter dietílico, de forma especialmente preferente en tolueno, y mezclas correspondientes, en presencia de 4-toluensulfonato de piridinio, preferiblemente a una temperatura de  $0^{\circ}C$  a  $150^{\circ}C$ .
- 20
- 25

Los compuestos de fórmula general XV también se pueden transformar en los compuestos de fórmula general I, en la que al menos uno de los grupos  $R^1$  y  $R^8$  no representa hidrógeno.



- Los compuestos de fórmula general XV se pueden someter a reacción con los compuestos de fórmula general  $R^1-X$  o  $R^8-X$ , en la que X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico seleccionado de entre el grupo consistente en mesilato, triflato y tosilato, de forma especialmente preferente un átomo de cloro o bromo, en caso dado en un medio de reacción, preferentemente seleccionado de entre el grupo consistente en metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, éter dietílico, tetrahydrofurano, diclorometano, cloroformo, dimetilformamida, acetonitrilo, piridina, dioxano, acetato de etilo, sulfóxido de dimetilo, tolueno y mezclas correspondientes, de forma especialmente preferente en un medio de reacción seleccionado de entre el grupo consistente en acetonitrilo, dicloroetano, cloroformo, dimetilformamida, tetrahydrofurano y éter dietílico, en caso dado en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, preferentemente seleccionada de entre el grupo consistente en trietilamina, bicarbonato de sodio, dimetilaminopiridina, carbonato de potasio e hidróxido de sodio, y/o en caso dado en presencia de al menos un compuesto organometálico o un reactivo de hidruro metálico, preferentemente seleccionado de entre el grupo consistente en n-butil-litio, fenil-litio, hidruro de sodio, terc-butanolato de potasio, hidruro de potasio y amida sódica,
- 30
- 35
- 40

preferiblemente a temperaturas entre -70°C y 300°C, de forma especialmente preferente a temperaturas entre -70°C y 150°C, para obtener compuestos de la fórmula general I en los que al menos uno de los grupos R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup> no representa hidrógeno.

5 Los compuestos de las fórmulas II, III, V, VII y VIII arriba mostradas, y también de las fórmulas generales Y-(CR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>)<sub>n</sub>-W, R<sup>9</sup>-C≡C-C(=O)-OH, R<sup>9</sup>-X, R<sup>1</sup>-X, R<sup>8</sup>-X, R<sup>9</sup>-C≡C-C(=O)-X y H-C≡C-C(=O)-X, se pueden obtener en cada caso comercialmente en el mercado y/o se pueden preparar mediante procedimientos usuales conocidos por los especialistas.

10 Las reacciones arriba descritas se pueden llevar a cabo en cada caso bajo condiciones usuales y familiares para los especialistas, por ejemplo en lo que respecta a la presión o al orden de adición de los componentes. En caso dado, los especialistas pueden determinar el modo óptimo de proceder de acuerdo con las condiciones correspondientes mediante sencillos ensayos preliminares.

15 Si así se desea y/o requiere, cada uno de los productos intermedios y finales obtenidos de acuerdo con las reacciones arriba descritas se puede purificar y/o aislar de acuerdo con métodos usuales conocidos por los especialistas. Procedimientos de purificación adecuados son, por ejemplo, procedimientos de extracción y procedimientos cromatográficos, como cromatografía en columna o cromatografía preparatoria.

Todos los pasos de procedimiento arriba descritos y también la purificación y/o el aislamiento de los productos intermedios o finales se pueden llevar a cabo parcial o totalmente bajo atmósfera de gas inerte, preferentemente bajo atmósfera de nitrógeno.

20 Si, después de su preparación, las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada según la invención se obtienen en forma de una mezcla de estereoisómeros, preferentemente en forma de racematos u otras mezclas de sus diferentes enantiómeros y/o diastereoisómeros, éstos se pueden separar y en caso dado aislar mediante procedimientos usuales conocidos por los especialistas. Como ejemplos se mencionan: procedimientos de separación cromatográficos, en particular procedimientos de cromatografía líquida bajo presión normal o presión elevada, preferentemente procedimientos MPLC y HPLC, y procedimientos de cristalización fraccionada. En este contexto se pueden separar entre sí principalmente enantiómeros individuales, por ejemplo de sales diastereoisoméricas formadas mediante HPLC en fase quiral o mediante cristalización con ácidos quirales, por ejemplo ácido (+)-tartárico, ácido (-)-tartárico o ácido (+)-10-canforsulfónico.

30 Las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada según la invención, y en caso dado también los estereoisómeros correspondientes se pueden obtener en forma de sales correspondientes, preferentemente en forma de clorhidratos correspondientes, en particular en forma de sales fisiológicamente compatibles correspondientes, mediante procedimientos usuales conocidos por los especialistas, pudiendo presentar el medicamento según la invención una o más sales de uno o más de estos compuestos.

35 Las sales correspondientes de las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada según la invención, y también los estereoisómeros correspondientes, se pueden obtener por ejemplo mediante reacción con uno o más ácidos inorgánicos y/u orgánicos. Los ácidos adecuados se pueden seleccionar preferentemente de entre el grupo consistente en ácido perclórico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido metanosulfónico, ácido fórmico, ácido acético, ácido oxálico, ácido succínico, ácido tartárico, ácido mandélico, ácido fumárico, ácido láctico, ácido cítrico, ácido glutámico, ácido sacárico, ácido ciclohexanosulfamídico, aspartamo, ácido monometilsebácico, 5-oxoprolina, ácido hexano-1-sulfónico, ácido nicotínico, ácido 2-aminobenzoico, ácido 3-aminobenzoico o ácido 4-aminobenzoico, ácido 2,4,6-trimetilbenzoico, ácido α-lipoico, acetilglicina, ácido hipúrico, ácido fosfórico, ácido maleico, ácido malónico y ácido aspártico.

45 Las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada según la invención, y en caso dado también los estereoisómeros correspondientes y en cada caso sus sales fisiológicamente compatibles, también se pueden obtener en forma de sus solvatos, en particular en forma de sus hidratos, mediante procedimientos usuales conocidos por los especialistas.

Sorprendentemente se ha comprobado que las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada según la invención son adecuadas para la regulación de los receptores mGluR5 y, en consecuencia, se pueden utilizar en particular como principios activos farmacéuticos en medicamentos para la profilaxis y/o el tratamiento de trastornos o enfermedades relacionados con estos receptores o procesos.

50 Las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada según la invención y en caso dado los estereoisómeros correspondientes, y también en cada caso las sales y solvatos correspondientes, son toxicológicamente inocuos y, por consiguiente, son adecuados como principios activos farmacéuticos en medicamentos.

55 Por consiguiente, otro objeto de la presente invención consiste en un medicamento que contiene al menos una amida de ácido propiólico sustituida de la fórmula general I arriba mostrada según la invención, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción

de mezcla, o en cada caso en forma de una sal correspondiente, o en cada caso en forma de un solvato correspondiente, y en caso dado también una o más sustancias auxiliares farmacéuticamente compatibles.

El medicamento según la invención es adecuado para la regulación del receptor mGluR5, en particular para la inhibición del receptor mGluR5.

- 5 Preferentemente, el medicamento según la invención es adecuado para la profilaxis y/o el tratamiento de trastornos y/o enfermedades en los que intervienen, al menos en parte, los receptores mGluR5.

10 Por consiguiente, de forma especialmente preferente el medicamento según la invención es adecuado para el tratamiento y/o la profilaxis del dolor, preferentemente del dolor seleccionado de entre dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral; migrañas; depresiones; enfermedades neurodegenerativas, preferentemente seleccionadas de entre el grupo consistente en esclerosis múltiple, enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y enfermedad de Huntington; enfermedades cognitivas, preferentemente estados cognitivos carenciales, de forma especialmente preferente síndrome de atención deficiente (ADS); estados de ansiedad; ataques de pánico; epilepsia; tos; incontinencia urinaria; diarrea; prurito; esquizofrenia; isquemias cerebrales; espasmos musculares; calambres; enfermedades pulmonares, preferentemente seleccionadas de entre asma y pseudocrup; regurgitación (vómitos); ataques de apoplejía; discinesia; retinopatía; estados atímicos; laringitis; trastornos alimentarios, preferentemente seleccionados de entre bulimia, caquexia, anorexia y obesidad; alcoholismo; dependencia de medicamentos; drogodependencia, preferentemente dependencia de la nicotina y/o la cocaína; abuso de alcohol; abuso de medicamentos; abuso de drogas, preferentemente abuso de nicotina y/o cocaína; síndromes de abstinencia en caso de dependencia de alcohol, medicamentos y/o drogas (en particular nicotina y/o cocaína); desarrollo de tolerancia a medicamentos, preferentemente a opioides naturales o sintéticos; síndrome de reflujo gastroesofágico; enfermedad de reflujo gastroesofágico; síndrome del intestino irritable; para la diuresis; para la antinatriuresis; para influir en el sistema cardiovascular; para aumentar la vigilancia; para aumentar la libido; para modular la actividad motora o como anestésico local.

25 De forma totalmente preferente, el medicamento según la invención es adecuado para la profilaxis del dolor, preferentemente del dolor seleccionado de entre dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral; estados de ansiedad; ataques de pánico; alcoholismo; dependencia de medicamentos; trastornos alimentarios, preferentemente seleccionados de entre bulimia, caquexia, anorexia y obesidad; drogodependencia, preferentemente dependencia de la nicotina y/o la cocaína; abuso de alcohol; abuso de medicamentos; abuso de drogas, preferentemente abuso de nicotina y/o cocaína; síndromes de abstinencia en caso de dependencia de alcohol, medicamentos y/o drogas (en particular nicotina y/o cocaína); desarrollo de tolerancia a medicamentos y/o drogas, en particular a opioides naturales o sintéticos; síndrome de reflujo gastroesofágico; enfermedad de reflujo gastroesofágico y síndrome del intestino irritable.

30 De forma todavía más preferente, el medicamento según la invención es adecuado para la profilaxis y/o el tratamiento del dolor, preferentemente del dolor seleccionado de entre dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral, estados de ansiedad y ataques de pánico.

35 De modo totalmente preferente, el medicamento según la invención es adecuado para la profilaxis y/o el tratamiento del dolor, preferentemente de dolores agudos, dolores crónicos, dolores neuropáticos y dolores viscerales.

40 Otro objeto de la presente invención consiste en la utilización de al menos una amida de ácido propiólico sustituida de la fórmula general I arriba mostrada según la invención, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de una sal correspondiente, o en cada caso en forma de un solvato correspondiente, y en caso dado también una o más sustancias auxiliares farmacéuticamente compatibles, para la producción de un medicamento para la regulación del receptor mGluR5, preferentemente para la inhibición del receptor mGluR5.

45 Es preferente la utilización de al menos una amida de ácido propiólico sustituida de la fórmula general I arriba mostrada según la invención, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de una sal correspondiente, o en cada caso en forma de un solvato correspondiente, y en caso dado también una o más sustancias auxiliares farmacéuticamente compatibles, para la producción de un medicamento para la profilaxis y/o el tratamiento de trastornos y/o enfermedades en los que intervienen, al menos en parte, los receptores mGluR5.

50 Es especialmente preferente la utilización de al menos una amida de ácido propiólico sustituida de la fórmula general I arriba mostrada según la invención, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de una sal correspondiente, o en cada caso en forma de un solvato correspondiente, y en caso dado también una o más sustancias auxiliares farmacéuticamente compatibles, para la producción de un medicamento para la profilaxis y/o el tratamiento del dolor, preferentemente del dolor seleccionado de entre dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral; migraña; depresiones; enfermedades neurodegenerativas, preferentemente seleccionadas de entre el grupo consistente en esclerosis múltiple, enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y enfermedad de

Huntington; enfermedades cognitivas, preferentemente estados cognitivos carenciales, de forma especialmente preferente síndromes de atención deficiente (ADS); estados de ansiedad; ataques de pánico; epilepsia; tos; incontinencia urinaria; diarrea; prurito; esquizofrenia; isquemias cerebrales; espasmos musculares; calambres; enfermedades pulmonares, preferentemente seleccionadas de entre el grupo consistente en asma y pseudocrup; 5 regurgitación (vómitos); ataques de apoplejía; discinesia; retinopatía; estados atímicos; laringitis; trastornos alimentarios, preferentemente seleccionados de entre el grupo consistente en bulimia, caquexia, anorexia y obesidad; alcoholismo; dependencia de medicamentos; drogodependencia, preferentemente dependencia de la nicotina y/o la cocaína; abuso de alcohol; abuso de medicamentos; abuso de drogas, preferentemente abuso de nicotina y/o cocaína; síndromes de abstinencia en caso de dependencia de alcohol, medicamentos y/o drogas (en particular nicotina y/o cocaína); 10 desarrollo de tolerancia a medicamentos, en particular a opioides naturales o sintéticos; síndrome de reflujo gastroesofágico; enfermedad de reflujo gastroesofágico; síndrome del intestino irritable; para la diuresis; para la antinatriuresis; para influir en el sistema cardiovascular; para aumentar la vigilancia; para aumentar la libido; para modular la actividad motora o como anestésico local.

Es totalmente preferente la utilización de al menos una amida de ácido propiólico sustituida de la fórmula general I arriba mostrada según la invención, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de una sal correspondiente, o en cada caso en forma de un solvato correspondiente, y en caso dado también una o más sustancias auxiliares farmacéuticamente compatibles, para la producción de un medicamento para la profilaxis y/o el tratamiento del dolor, preferentemente del dolor seleccionado de entre dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral; 15 estados de ansiedad; ataques de pánico; alcoholismo; dependencia de medicamentos; trastornos alimentarios, preferentemente seleccionados de entre el grupo consistente en bulimia, caquexia, anorexia y obesidad; drogodependencia, preferentemente dependencia de la nicotina y/o la cocaína; abuso de alcohol; abuso de medicamentos; abuso de drogas, preferentemente abuso de nicotina y/o cocaína; síndromes de abstinencia en caso de 20 dependencia de alcohol, medicamentos y/o drogas (en particular nicotina y/o cocaína); desarrollo de tolerancia a medicamentos, en particular a opioides naturales o sintéticos; síndrome de reflujo gastroesofágico; enfermedad de reflujo gastroesofágico y síndrome del intestino irritable.

Todavía más preferente es la utilización de al menos una amida de ácido propiólico sustituida de la fórmula general I arriba mostrada según la invención, en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de una sal correspondiente, o en cada caso en forma de un solvato, y en caso dado también una o más sustancias auxiliares farmacéuticamente compatibles, para la producción de un medicamento para la profilaxis y/o el tratamiento del dolor, preferentemente del dolor seleccionado de entre dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral, estados 30 de ansiedad y ataques de pánico.

El medicamento según la invención es adecuado para ser administrado a adultos y niños, incluyendo niños pequeños y lactantes.

El medicamento según la invención se puede presentar y administrar en forma de medicamento líquido, semisólido o sólido, por ejemplo en forma de soluciones para inyección, gotas, jugos, jarabes, pulverizaciones, suspensiones, 40 pastillas, parches, cápsulas, apósitos, supositorios, pomadas, cremas, lociones, geles, emulsiones, aerosoles, o en forma multiparticulada, por ejemplo en forma de pellas o granulados, en caso dado comprimidos en pastillas, rellenos en cápsulas o suspendidos en un líquido.

Además de al menos una amida de ácido propiólico sustituida de la fórmula general I arriba mostrada según la invención, en caso dado en forma de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racemato o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de una sal correspondiente, o en cada caso en forma de un solvato, el medicamento según la invención contiene normalmente otras sustancias auxiliares farmacéuticas fisiológicamente compatibles, que se pueden seleccionar preferentemente de entre el grupo consistente en materiales vehículo, sustancias de carga, disolventes, diluyentes, agentes tensioactivos, colorantes, conservantes, disgregantes, 45 deslizantes, lubricantes, sustancias aromáticas y aglutinantes.

La selección de las sustancias auxiliares fisiológicamente compatibles y de la cantidad a utilizar de las mismas depende de la forma de administración del medicamento, es decir, por vía oral, subcutánea, parenteral, intravenosa, intraperitoneal, intradérmica, intramuscular, intranasal, bucal, rectal o local, por ejemplo sobre infecciones en la piel, las mucosas y los ojos. Para la administración oral son adecuados preferentemente los preparados en forma de pastillas, grageas, cápsulas, granulados, pellas, gotas, jugos y jarabes; para la administración parenteral, tópica y por inhalación 55 las soluciones, suspensiones, preparados secos de fácil reconstitución y aerosoles.

Las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada utilizadas en el medicamento según la invención en un depósito en forma disuelta o en un parche, en caso dado añadiendo agentes promotores de la penetración en la piel, son preparados adecuados para la administración percutánea.

Los preparados a administrar vía oral o percutánea también pueden liberar las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I arriba mostrada correspondientes de forma retardada.

5 La preparación de los medicamentos según la invención tiene lugar con ayuda de los medios, dispositivos, métodos y procedimientos usuales y bien conocidos en el estado actual de la técnica, tal como se describen, por ejemplo, en "Remington's Pharmaceutical Sciences", Editores A.R. Gennaro, 17 Edición, Mack Publishing Company, Easton, Pa., 1985, en particular volumen 8, capítulos 76 a 93. La descripción correspondiente se incorpora aquí como referencia y sirve como parte de la exposición.

10 La cantidad de amida de ácido propiólico sustituida de la fórmula general I arriba mostrada correspondiente que se ha de administrar a los pacientes es variable y depende por ejemplo del peso o la edad del paciente y también del tipo de administración, la indicación y la gravedad de la enfermedad. Normalmente se administran entre 0,05 y 100 mg/kg, preferentemente entre 0,05 y 10 mg/kg de peso corporal del paciente, de al menos uno de dichos compuestos.

## Métodos farmacológicos

### I. Método para determinar la inhibición de la unión de [<sup>3</sup>H]-MPEP en el ensayo de unión al receptor mGluR5

15 Se prepara un homogeneizado de cerebro de cerdo mediante homogeneización (Polytron PT3000, Kinematica AG, 10.000 revoluciones por minuto durante 90 segundos) de hemisferios cerebrales sin médula, cerebelo ni puente de Valerio en tampón pH 8,0 (30 mM Hepes, Sigma, número de pedido H3375 + 1 Tablette Complete a 100 ml, Roche Diagnostics, número de pedido 1836145) en una proporción 1:20 (peso cerebral/volumen) y centrifugación diferencial a 900 x g y 40.000 x g. En unas cargas de incubación de 250 µl en placas de microtitulación de 96 pocillos se incuban en cada caso 450 µl de proteína de homogeneizado de cerebro con 5 nM [<sup>3</sup>H]-MPEP (Tocris, número de pedido R1212) (MPEP = 2-metil-6-(3-metoxifenil)etilpiridina) y los compuestos a analizar (10 µM en el ensayo) en el tampón (como se indica más arriba) a temperatura ambiente durante 60 minutos.

20 Después, las cargas se filtran con ayuda de un Brandel Cell Harvester (Brandel, tipo Robotic 9600) sobre placas Unifilter con esteras de filtro de fibra de vidrio (Perkin Elmer, número de pedido 6005177) y a continuación se lava con tampón (como se indica más arriba) 3 veces con 250 µl por muestra en cada caso. A continuación, las placas de filtro se secan durante 60 minutos a 55°C. Luego se añaden a cada pocillo 30 µl de escintilador Ultima Gold<sup>TM</sup> (Packard BioScience, número de pedido 6013195) y 3 horas después se miden las muestras en el β-Counter (Mikrobeta, Perkin Elmer). La unión no específica se mide mediante adición de 10 µM MPEP (Tocris, número de pedido 1212).

### II. Método para determinar el influjo de Ca<sup>2+</sup> en el ensayo del receptor mGluR5

30 Se puede determinar el efecto agonista y/o antagonista de las sustancias sobre el receptor mGluR5 de la especie rata con el siguiente ensayo. En este ensayo se cuantifica la liberación de Ca<sup>2+</sup> intracelular después de la activación del receptor mGluR5 con ayuda de un colorante sensible al Ca<sup>2+</sup> (tipo Fluo-4, Molecular Probes Europe BV, Leiden, Holanda) en una FlexStation (Molecular Devices, Sunnyvale, EE. UU.).

#### Preparación de neuronas corticales

35 Las neuronas corticales se preparan a partir de ratas postnatales (P2-6) bajo condiciones estériles. Para ello se toma la corteza y se traslada directamente a una solución de colagenasa (PAA Laboratories GmbH, Cölbe, Alemania) y se incuba durante 45 minutos en el agitador con calefacción (37°C, 300 revoluciones por minuto). A continuación se retira la solución de colagenasa y el tejido se mezcla con medio de cultivo.

#### Medio de cultivo (100 ml):

Medio neurobasal (Gibco Invitrogen GmbH, Karlsruhe, Alemania) 2 mM L-glutamina (Sigma, Taufkirchen, Alemania)

40 1% en volumen de solución antibiótica/antimicótica (PAA Laboratories GmbH, Cölbe, Alemania)

15 ng/ml NGF (Gibco Invitrogen GmbH, Karlsruhe, Alemania) 1 ml de suplemento B27 (Gibco Invitrogen GmbH, Karlsruhe, Alemania) 1 ml de suplemento ITS (Sigma, Taufkirchen, Alemania)

45 Las células se aíslan mediante resuspensión y, después de añadir 15 ml de medio neurobasal, se centrifugan a través de un elemento de filtro de 70 µm (BD Biosciences, Heidelberg, Alemania). La pella celular resultante se recoge en el medio de cultivo. A continuación, las células se disponen sobre placas negras de 96 pocillos con fondo claro revestidas con poli-D-lisina (BD Biosciences, Heidelberg, Alemania), que antes han sido revestidas adicionalmente con laminina (2 µg/cm<sup>2</sup>, Gibco Invitrogen GmbH, Karlsruhe, Alemania). La densidad celular es de 15.000 células/pocillo. Las células se incuban a 37°C y con un 5% de CO<sub>2</sub> y el segundo o el tercer día después de la preparación se lleva a cabo un cambio de medio. Dependiendo del crecimiento celular, el análisis funcional se puede llevar a cabo 3-7 días después de la preparación.

**Descripción del ensayo funcional del influjo de Ca<sup>2+</sup>**

5 En unas placas de 96 pocillos (BD Biosciences, Heidelberg, Alemania, ref. 356640, clear bottom, 96 well, Poly-D-Lysine) se depositan con pipeta 20.000 células CHO-hmGluR5/pocillo (Euroscreen, Gosselies, Bélgica) y éstas se incuban durante una noche en tampón HBSS (Gibco nº 14025-050) con los siguientes aditivos: 10% FCS (GIBCO, 10270-106) y doxiciclina (BD Biosciences Clontech 631311 600 ng/ml).

Para el análisis funcional, las células se cargaron con 2 µM Fluo-4 y un 0,01% en volumen de Pluronic F127 (Molecular Probes Europe BV, Leiden, Holanda) en tampón HBSS (solución salina tamponada de Hank, Gibco Invitrogen GmbH, Karlsruhe, Alemania) con Probenicid (Sigma P8761, 0,69 mg/ml) durante 30 minutos a 37°C.

10 Después, las células se lavan 3 veces con tampón de lavado (HBSS-Puffer, Gibco nº 14025-050, con Probenicid (Sigma P8761, 0,69 mg/ml) y a continuación se recogen con el mismo tampón hasta 100 µl. Quince minutos después, las placas se transfieren a un lector de placa Fluorometric Imaging (FLIPR, Molecular Devices, Sunnyvale, CA) para determinar mediciones de Ca<sup>2+</sup> en presencia de DHPG ((S)-3,5-dihidroxifenilglicina, Tocris Biotrend Chemikalien GmbH, Colonia, Alemania, concentración final de DHPG: 10 µM) y en presencia o ausencia de las sustancias de ensayo.

15 La fluorescencia dependiente del Ca<sup>2+</sup> se mide antes y después de la adición de las sustancias de ensayo. La cuantificación tiene lugar mediante la medición de la mayor intensidad de fluorescencia con el tiempo.

20 Después de registrar una línea base de fluorescencia durante 10 segundos, se añaden 50 µl de la solución de sustancia de ensayo (diferentes concentraciones de sustancia de ensayo en tampón HBSS con 1% DMSO y 0,02% Tween 20, Sigma) y la señal de fluorescencia se mide durante 6 minutos. A continuación se añaden 50 µl de solución DHPG ((S)-3,5-dihidroxifenilglicina, Tocris Biotrend Chemikalien GmbH, Colonia, Alemania, concentración final de DHPG: 10 µM) y la afluencia de Ca<sup>2+</sup> se mide simultáneamente durante 60 segundos. La concentración final de DMSO es del 0,25% y el contenido final de Tween 20 es del 0,005%. Los datos se analizan con Microsoft Excel y GraphPad Prism. Las curvas dosis-efecto se calculan mediante regresión no lineal y se determinan los valores IC<sub>50</sub>. Cada punto de los datos se determina 3 veces y los valores IC<sub>50</sub> corresponden al promedio de al menos 2 mediciones independientes.

Los valores Ki se calculan mediante la siguiente fórmula:

$$25 \quad K_i = IC_{50} / (1 + (AG_{conc} / EC_{50})).$$

AG<sub>conc</sub> = 10 µM; EC<sub>50</sub> corresponde a la concentración de DHPG necesaria para la afluencia semimáxima de Ca<sup>2+</sup>.

**III. Test de formalina en ratas**

30 El test de formalina (Dubuisson, D. y Dennis, S. G., 1977, Pain, 4, 161 - 174) constituye un modelo de dolor agudo y de dolor crónico. Mediante una única inyección de formalina en la parte dorsal de una pata trasera de los animales de ensayo con libertad de movimiento se induce en éstos una reacción nociceptiva bifásica que se registra mediante la observación de tres patrones de comportamiento distinguibles claramente entre sí. La reacción tiene dos fases: fase 1 = reacción inmediata (duración hasta 10 minutos; agitación de la pata, lametones), fase 2 = reacción tardía (después de una fase de tranquilidad; igualmente agitación de la pata, lametones; duración hasta 60 minutos). La 1ª fase refleja una estimulación directa de los nociceptores periféricos con una alta entrada nociceptiva espinal o liberación de glutamato (fase de dolor agudo); la 2ª fase refleja una hipersensibilización espinal y periférica (fase de dolor crónico). En los análisis aquí presentados se ha evaluado el componente de dolor crónico (fase 2).

40 La formalina se administra en un volumen de 50 µl y una concentración de un 5% vía subcutánea en la parte dorsal de la pata trasera derecha de cada animal. Las sustancias a ensayar se administran vía oral (p.o.), intravenosa (i.v.) o intraperitoneal (i.p.) 30 minutos antes de la inyección de formalina. Los cambios de comportamiento específicos, como levantamiento y sacudida de la pata, desplazamiento del peso del animal y reacciones de lametones y mordiscos, se observan y registran durante un intervalo de tiempo de 21 a 27 minutos después de la inyección de formalina. El resumen de los diferentes tipos de comportamiento se lleva a cabo mediante el llamado índice de dolor (*Pain-Rate*, PR), que representa el cálculo de una reacción de nocicepción media con respecto a los intervalos parciales de 3 minutos. El cálculo del PR se realiza en base a una valoración numérica (= en cada caso factor 1, 2, 3) de los tipos de comportamiento observados (correspondientes a las puntuaciones de comportamiento 1, 2, 3) mediante la siguiente fórmula:

$$45 \quad PR = [(T_0 \times 0) + (T_1 \times 1) + (T_2 \times 2) + (T_3 \times 3)] / 180,$$

correspondiendo T<sub>0</sub>, T<sub>1</sub>, T<sub>2</sub> y T<sub>3</sub> en cada caso al tiempo en segundos en el que el animal muestra los comportamientos 0, 1, 2 o 3. Los grupos están formados por 10 animales (n = 10).

50 Los siguientes ejemplos sirven únicamente para ilustrar la invención y no limitan la idea general de la misma.

**Ejemplos**

Los rendimientos de los compuestos producidos no han sido optimizados.

Todas las temperaturas están sin corregir.

Los productos químicos y disolventes utilizados han sido adquiridos comercialmente de los proveedores habituales (Acros, Avocado, Aldrich, Bachem, Fluka, Lancaster, Maybridge, Merck, Sigma, TCI, etc.) o han sido sintetizados mediante métodos usuales conocidos por los especialistas.

- 5 Como fase estacionaria para la cromatografía en columna se utilizó Kieselgel 60 (0,040 - 0,063 mm) de la firma E. Merck, Darmstadt.

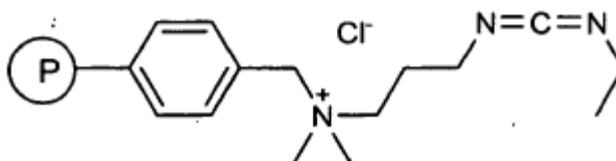
Los análisis por cromatografía de capa fina se llevaron a cabo mediante placas preparadas para HPTLC, Kieselgel 60 F 254, de la firma E. Merck, Darmstadt.

- 10 Las proporciones de mezcla de los disolventes, los agentes eluyentes o para los análisis cromatográficos están indicadas siempre en volumen/volumen.

La analítica se realiza mediante espectroscopia de masas y/o NMR.

### Abreviaturas

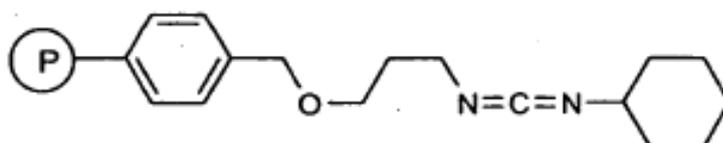
ac.	Acuoso
Salmuera	Solución acuosa saturada de NaCl
15 BuLi	n-butil-litio
DCE	1,2-dicloroetano
DCM	Diclorometano
DIC	N,N'-diisopropilcarbodiimida
DIPE	Éter diisopropílico
20 DMF	N,N-dimetilformamida
EE	Acetato de etilo
Éter	Éter dietílico
HOBt	Hidrato de 1-hidroxi-1H-benzotriazol
sol.	Solución
25 M	Molar
MeOH	Metanol
PL-EDC	Una cabodiimida unida a polímero con la siguiente estructura:



Carga: 1,4 mmol/g

- 30 Tamaño de partícula: 300-500  $\mu\text{m}$

PS-carbodiimida Una cabodiimida unida a polímero con la siguiente estructura:



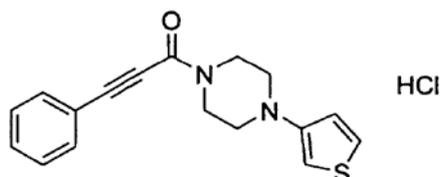
Carga: 0,9-1,4 mmol/g

Tamaño de partícula: 75-150  $\mu\text{m}$ 

TA Temperatura ambiente

CC Cromatografía en columna

TFA Ácido trifluoroacético

5 **Ejemplo 1: Clorhidrato de 1-(3-fenilpropiolil)-4-(tiofen-3-il)piperazina**a) *Síntesis de 4-(3-fenilpropiolil)piperazin-1-carboxilato de terc-butilo*

10 A una solución de 750 mg (5,1 mmol) de ácido fenilpropióico y 955 mg (5,1 mmol) de terc-butilpiperazin-1-carboxilato en DMF (4 ml) se añadieron 0,80 ml (5,1 mmol) de DIC y 0,69 g (5,1 mmol) de HOBt y la solución de reacción se agitó durante 18 horas a temperatura ambiente. A continuación se mezcló con una solución acuosa 1M de  $\text{Na}_2\text{CO}_3$  (2 ml) y se diluyó con n-hexano (5 ml). El sólido precipitado (1,7 g) se aspiró, se lavó con n-hexano y se utilizó en el siguiente paso sin ninguna purificación adicional.

b) *Síntesis de 1-(fenilpropiolil)piperazina*

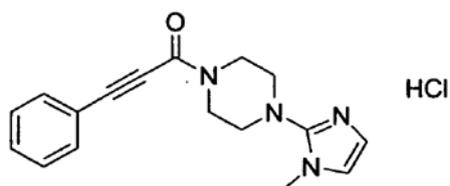
15 Una solución de 500 mg del producto crudo obtenido en el Ejemplo 1a) en DCM (2 ml) se enfrió a  $0^\circ\text{C}$  (baño helado) y se mezcló lentamente con 1,65 ml (21,5 mmol) de TFA de modo que la temperatura no superó los  $5^\circ\text{C}$ . Una vez finalizada la adición, la carga se agitó durante 1 hora a TA. A continuación, la mezcla se vertió sobre agua helada y se ajustó a un valor básico ( $\text{pH} > 10$ ) con una disolución acuosa de  $\text{NH}_3$  al 25%. Después se extrajo con DCM (3 x 150 ml). Las fases orgánicas reunidas se lavaron con salmuera, se secaron mediante  $\text{MgSO}_4$ , se filtraron y el disolvente se retiró en vacío. Con el residuo se realizó una CC ( $\text{SiO}_2$ , MeOH/DCM 1:9), con lo que se obtuvieron 170 mg (0,8 mmol, 53% en 20 pasos) de 1-(fenilpropiolil)piperazina.

c) *Síntesis de 1-(3-fenilpropiolil)-4-(tiofen-3-il)piperazina*

25 A una solución de 500 mg (2,33 mmol) de 1-(fenilpropiolil)piperazina en 1,2,4-trimetilbenceno (2 ml) se añadieron sucesivamente 246 mg (2,57 mmol) de terc-butilato de sodio y 0,22 ml (2,33 mmol) de 3-bromotiofeno. Después se añadió a la solución de reacción una suspensión de 66 mg (0,12 mmol) de bis(dibencilidenacetona)paladio (0) y 345  $\mu\text{l}$  (0,12 mmol, 10% en hexano) de tri-terc-butilfosfina en 1,2,4-trimetilbenceno (1,2 ml). A continuación se agitó durante 18 horas a  $120^\circ\text{C}$ , se diluyó con EE y se filtró a través de tierra de diatomeas. El filtrado se concentró en vacío y con el residuo se realizó una CC ( $\text{SiO}_2$ , DCM/DIPE 1:2), con lo que se obtuvieron 300 mg (1,01 mmol, 43%) de 1-(3-fenilpropiolil)-4-(tiofen-3-il)piperazina.

d) *Síntesis de clorhidrato de 1-(3-fenilpropiolil)-4-(tiofen-3-il)piperazina*

30 300 mg (1,01 mmol) de 1-(3-fenilpropiolil)-4-(tiofen-3-il)piperazina se disolvieron en acetona (10 ml) y se mezclaron sucesivamente con 9  $\mu\text{l}$  (0,51 mmol) de agua y 128  $\mu\text{l}$  (1,0 mmol) de trimetilclorosilano. El precipitado obtenido se aspiró y se lavó con acetona. Se obtuvieron 0,193 g (0,58 mmol, 57%) de clorhidrato de 1-(3-fenilpropiolil)-4-(tiofen-3-il)piperazina.

MS:  $[\text{MH}^+]$  297,135 **Ejemplo 3: Clorhidrato de 1-(3-fenilpropiolil)-4-(1-metilimidazol-2-il)piperazina**a) *Síntesis de 1-(1-metil-1H-imidazol-2-il)piperazina*

1,0 g (6,2 mmol) de 2-bromo-1-metil-1*H*-imidazol se fundió con 3,2 ml (37,0 mmol) de piperazina a 145°C y se agitó durante 18 horas a esa temperatura. Después de enfriar la mezcla a TA, el residuo se recogió en ácido clorhídrico acuoso al 10% y se lavó con EE. A continuación se ajustó a un valor básico (pH > 12) con una disolución acuosa de NaOH al 10% y se extrajo con DCM. La fase orgánica se secó mediante MgSO<sub>4</sub>, se filtró y se concentró en vacío. Se obtuvieron 780 mg (4,7 mmol, 76%) de 1-(1-metil-1*H*-imidazol-2-il)piperazina.

*b) Síntesis de 1-(3-fenilpropiolil)-4-(1-metilimidazol-2-il)piperazina*

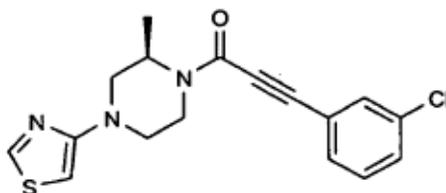
Una solución de 600 mg (4,1 mmol) de ácido fenilpropiónico y 680 mg (4,1 mmol) de 1-(1-metil-1*H*-imidazol-2-il)piperazina en DMF (3,3 ml) se mezcló con 0,64 ml (4,1 mmol) de DIC y 0,55 g (4,1 mmol) de HOBT y se agitó durante 18 horas a TA. A continuación se añadió una disolución acuosa 1M de Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (5 ml) y se extrajo con DCM. La fase orgánica se secó a través de MgSO<sub>4</sub>, se filtró y el disolvente se retiró en vacío. Con el residuo se realizó una CC (SiO<sub>2</sub>, EE/MeOH 9:1), con lo que se obtuvieron 720 mg (2,4 mmol, 60%) de 1-(3-fenilpropiolil)-4-(1-metilimidazol-2-il)piperazina.

*c) Síntesis de clorhidrato de 1-(3-fenilpropiolil)-4-(1-metilimidazol-2-il)piperazina*

720 mg (2,40 mmol) de 1-(3-fenilpropiolil)-4-(1-metilimidazol-2-il)piperazina se disolvieron en acetona (20 ml) y se mezclaron sucesivamente con 22 µl (1,22 mmol) de agua y 310 µl (2,45 mmol) de trimetilclorosilano. El precipitado formado se aspiró y se lavó con acetona. Se obtuvieron 440 mg (1,3 mmol, 32%) de clorhidrato de 1-(3-fenilpropiolil)-4-(1-metilimidazol-2-il)piperazina.

MS: [MH<sup>+</sup>] 295,1

**Ejemplo 4: (R)-2-metil-1-(3-(3-clorofenil)propiolil)-4-(tiazol-4-il)-piperazina**



*a) Síntesis de 4-bromotiazol*

Una solución de 10,0 g (41,2 mmol) de 2,4-dibromotiazol en éter (210 ml) se enfrió a -78°C y a esta temperatura se mezcló gota a gota con 28,3 ml (45,3 mmol, 15% en hexano) de *n*-butil-litio. Después de 30 minutos de agitación se añadieron a la mezcla de reacción, a -78°C, 3,3 ml (82,3 mmol) de metanol. A continuación, la carga se calentó a TA durante 16 horas. La mezcla de reacción se filtró a través de gel de sílice y se lavó con una mezcla de *n*-hexano/EE (2:1). El filtrado se concentró en vacío, con lo que se obtuvieron 6,7 g (40,9 mmol, 99%) de 4-bromotiazol.

*b) Síntesis de (R)-4-(3-metilpiperazin-1-il)tiazol*

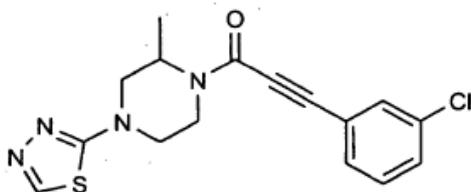
10,0 g (100 mmol) de (R)-2-metilpiperazina se fundieron a 100°C. A esta masa fundida se añadieron 2,7 g (16,8 mmol) de 4-bromotiazol en porciones a lo largo de un período de 2 horas. A continuación, la carga se agitó durante 18 horas a 100°C. Después de enfriarla a TA, el residuo se recogió en ácido clorhídrico acuoso al 10% y se lavó con EE. A continuación se ajustó a un valor básico (pH > 12) con una disolución acuosa de NaOH al 10% y se extrajo con DCM. La fase orgánica se secó mediante MgSO<sub>4</sub>, se filtró y se concentró en vacío. Con el residuo se realizó una CC (SiO<sub>2</sub>, DCM/MeOH 9:1), con lo que se obtuvieron 277 mg (1,5 mmol, 9%) de (R)-4-(3-metilpiperazin-1-il)tiazol.

*c) Síntesis de (R)-2-metil-1-(3-(3-clorofenil)propiolil)-4-(tiazol-4-il)-piperazina*

Una solución de 270 mg (1,50 mmol) de ácido 3-(3-clorofenil)propiónico y 270 mg (1,50 mmol) de (R)-4-(3-metilpiperazin-1-il)tiazol en DMF (1,2 ml) se mezcló con 0,23 ml (1,50 mmol) de DIC y 0,20 g (1,50 mmol) de HOBT y se agitó durante 18 horas a TA. A continuación se añadió una solución de Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> 1M (3 ml) y se extrajo con DCM. La fase orgánica se secó mediante MgSO<sub>4</sub>, se filtró y se concentró en vacío. Con el residuo se realizó una CC (SiO<sub>2</sub>, DCM/EE 19:1), con lo que se obtuvieron 60 mg (0,17 mmol, 12%) de (R)-2-metil-1-(3-(3-clorofenil)propiolil)-4-(tiazol-4-il)-piperazina.

MS: [MH<sup>+</sup>] 346,1

**Ejemplo 5: 2-metil-1-(3-(3-clorofenil)propiolil)-4-(1,3,4-tiadiazol-2-il)-piperazina**



a) Síntesis de 2-(3-metilpiperazin-1-il)-1,3,4-tiadiazol

5 2,0 g (12,1 mmol) de 2-bromo-[1,3,4]-tiadiazol y 7,2 g (72,7 mmol) de 2-metilpiperazina se agitaron en n-butanol (10 ml) durante 20 minutos a 120°C. A continuación se concentraron en vacío. Con el residuo se realizó una CC (SiO<sub>2</sub>, DCE/EtOH/conc. NH<sub>4</sub>OH 5:1:0,06), con lo que se obtuvieron 1,7 g (9,3 mmol, 78%) de 2-(3-metilpiperazin-1-il)-1,3,4-tiadiazol.

b) Síntesis de 2-metil-1-(3-(3-clorofenil)propiolil)-4-(1,3,4-tiadiazol-2-il)-piperazina

10 A una solución de 276 mg (1,50 mmol) de 2-(3-metilpiperazin-1-il)-1,3,4-tiadiazol y 406 mg (2,25 mmol) de ácido 3-(3-clorofenil)propiónico en DCM (30 ml) se añadieron 2,5 g (≅ 3,5 mmol) de PL-EDC (resina de carbodiimida unida a polímero) y la solución de reacción se agitó durante 16 horas a TA. A continuación, la resina se separó por filtración y el filtrado se concentró en vacío. Con el residuo se realizó una CC (SiO<sub>2</sub>, DCE/EtOH 10:1), con lo que se obtuvieron 140 mg (0,45 mmol, 30%) de 2-(3-metilpiperazin-1-il)-1,3,4-tiadiazol.

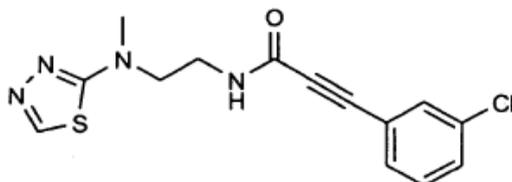
MS: [MH<sup>+</sup>] 347,1

15 La síntesis del Ejemplo 2, 1-(3-fenilpropiolil)-4-(tiazol-4-il)piperazina, se llevó a cabo de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 4b) y c).

MS: [MH<sup>+</sup>] 298,1

En este contexto, los especialistas saben perfectamente qué compuestos de partida y productos intermedios han de ser utilizados en cada caso para llegar al ejemplo correspondiente.

**Ejemplo 6: 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(1,3,4-tiadiazol-2-il)amino)etil)-propiolamida**



20

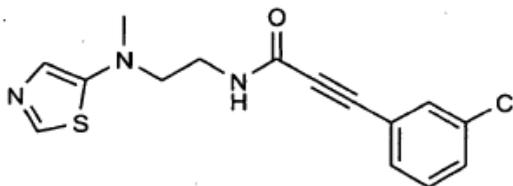
a) Síntesis de N'-metil-N'-(1,3,4-tiadiazol-2-il)etano-1,2-diamina

25 A una solución de 3,3 g (20,0 mmol) de 2-bromotiadiazol y 10,6 ml (120,0 mmol) de N-metil-etilen-diamina en isopropanol (114 ml) se añadieron 70 mg (1,1 mmol) de cobre y 328 mg (3,3 mmol) de cloruro de cobre (I). A continuación, la mezcla se calentó durante 1 hora a 70°C. Después de enfriarla a TA, se filtró a través de gel de sílice y el filtrado se concentró en vacío. Mediante una CC (DCE/EtOH/solución acuosa concentrada de NH<sub>4</sub>OH 4:4:0,25) del residuo se obtuvieron 1,05 g (6,6 mmol, 33%) de N'-metil-N'-(1,3,4-tiadiazol-2-il)etano-1,2-diamina.

b) Síntesis de 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(1,3,4-tiadiazol-2-il)amino)etil)-propiolamida

30 A una solución de 317 mg (2,0 mmol) de N'-metil-N'-(1,3,4-tiadiazol-2-il)etano-1,2-diamina y 542 mg (3,0 mmol) de ácido 3-(3-clorofenil)propiónico en DCM (20 ml) se añadieron 3,25 g (≅ 4,0 mmol) de PS-carbodiimida y la solución de reacción se agitó durante 16 horas a TA. A continuación se retiró la resina por filtración, se lavó con DCM y etanol y el filtrado se concentró en vacío. Con el residuo se realizó una CC (cloroformo), con lo que se obtuvieron 165 mg (0,51 mmol, 26%) de 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(1,3,4-tiadiazol-2-il)amino)etil)propiolamida.

MS: [MH<sup>+</sup>] 321,0

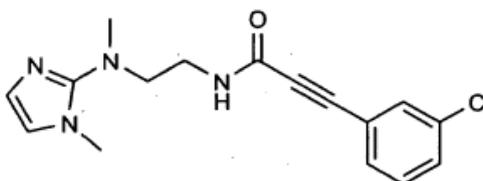
**Ejemplo 7: 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(tiazol-5-il)amino)etil)propiolamida****a) Síntesis de N'-metil-N'-(tiazol-5-il)etano-1,2-diamina**

5 A una solución de 1,15 ml (10,5 mmol) de 5-bromotiazol y 5,6 ml (63,0 mmol) de N-metil-etileno-diamina en isopropanol (6 ml) se le añadieron 37 mg (0,6 mmol) de cobre y 172 mg (1,7 mmol) de cloruro de cobre (I). A continuación, la mezcla se calentó durante 1 hora a 70°C y acto seguido se concentró en vacío. El residuo se concentró con salmuera (40 ml) y DCM (20 ml) y se separaron las fases. La fase orgánica se secó mediante MgSO<sub>4</sub>, se filtró y se concentró en vacío. Con el residuo se realizó una CC (DCE/EtOH/NH<sub>4</sub>OH conc. 5:1:0,06), con lo que se obtuvieron 104 mg (0,7 mmol, 6%) de N-metil-N'-(tiazol-5-il)etano-1,2-diamina.

**10 b) Síntesis de 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(tiazol-5-il)amino)etil)propiolamida**

15 A una solución de 146 mg (0,93 mmol) de N'-metil-N'-(tiazol-5-il)etano-1,2-diamina y 252 mg (1,39 mmol) de ácido 3-(3-cloro-fenil)propiónico en DCM (10 ml) se le añadieron 1,5 g (≅ 1,8 mmol) de PS-carbodiimida y la solución de reacción se agitó durante 16 horas a TA. A continuación se retiró la resina por filtración, se lavó con DCM y etanol y el filtrado se concentró en vacío. Con el residuo se realizó una CC (DCE/EtOH 10:1), con lo que se obtuvieron 63 mg (0,20 mmol, 21%) de 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(tiazol-5-il)amino)etil)propiolamida.

MS: [MH<sup>+</sup>] 320,1

**Ejemplo 8: 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(1-metil-1H-imidazol-2-il)amino)etil)-propiolamida****a) Síntesis de 2-yodo-1-metilimidazol**

20 7,97 ml (100,0 mmol) de 1-metil-imidazol se disolvieron en THF (100 ml) y se enfriaron a -78°C. A esta temperatura se añadieron gota a gota 40 ml (2,5M en hexano, 100 mmol) de BuLi. Una vez finalizada la adición, la mezcla se calentó durante 5 minutos a 0°C y a continuación se enfrió inmediatamente de nuevo a -78°C. A esta temperatura se añadió gota a gota una solución de 27,9 g (110,0 mmol) de yodo (I<sub>2</sub>) en THF (60 ml) y la mezcla se agitó durante 20 minutos a TA. A continuación se extinguió con una disolución acuosa de Na<sub>2</sub>S<sub>2</sub>O<sub>3</sub> al 5% (120 ml) y se extrajo con DCM (4 x 50 ml).  
25 Las fases orgánicas reunidas se secaron mediante MgSO<sub>4</sub>, se filtraron y se concentraron en vacío. Mediante cristalización del residuo a partir de éter dietílico se obtuvieron 11,5 g (55,2 mmol, 55%) de 2-yodo-1-metilimidazol.

**b) Síntesis de N<sup>1</sup>-metil-N<sup>1</sup>-(1-metil-1H-imidazol-2-il)etano-1,2-diamina**

30 Una mezcla de 4,8 g (23,0 mmol) de 2-yodo-1-metilimidazol, 12,2 ml (138,0 mmol) de N-metil-etileno-diamina, 80 mg (1,3 mmol) de cobre y 374 mg (3,8 mmol) de cloruro de cobre (I) se calentó durante 1 hora a 70°C. Después de enfriar la mezcla a TA, se recogió con salmuera y DCM y se separaron las fases. La fase orgánica se secó mediante MgSO<sub>4</sub>, se filtró y se concentró en vacío. Con el residuo se realizó una CC (DCE/EtOH/solución acuosa concentrada de NH<sub>4</sub>OH 5:1:0,06), con lo que se obtuvieron 215 mg (1,4 mmol, 6%) de N<sup>1</sup>-metil-N<sup>1</sup>-(1-metil-1H-imidazol-2-il)etano-1,2-diamina.

**c) Síntesis de 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(1-metil-1H-imidazol-2-il)amino)etil)-propiolamida**

35 A una solución de 215 mg (1,4 mmol) de N<sup>1</sup>-metil-N<sup>1</sup>-(1-metil-1H-imidazol-2-il)etano-1,2-diamina y 378 mg (2,1 mmol) de ácido 3-(3-clorofenil)propiónico en DCM (30 ml) se añadieron 2,3 g (≅ 2,8 mmol) de PS-carbodiimida y la solución de reacción se agitó durante 16 horas a TA. A continuación se retiró la resina por filtración, se lavó con DCM y etanol y el filtrado se concentró en vacío. Con el residuo se realizó una CC (DCE/EtOH 5:1), con lo que se obtuvieron 241 mg (0,8 mmol, 54%) de 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(1-metil-1H-imidazol-2-il)amino)etil)-propiolamida.

MS: [MH<sup>+</sup>] 317,1

**Datos farmacológicos**

1. La afinidad de las amidas de ácido propiólico sustituidas de la fórmula general I según la invención por el receptor mGluR5 se determinó tal como se describe más arriba (métodos I y II).

Las amidas de ácido propiólico sustituidas según la invención muestran una excelente afinidad por el receptor mGluR5.

La siguiente tabla 1 muestra los datos farmacológicos de las amidas de ácido propiólico sustituidas:

Ejemplo	K <sub>i</sub> receptor mGluR5 (humano) Influjo de Ca <sup>2+</sup> [nm]	IC <sub>50</sub> receptor mGluR5 (cerdo) unión [ <sup>3</sup> H]- MPEP [μM]
1		1,890
2		0,630
3		4,840
4	0,0033	0,016
5	0,0048	0,027
6		0,0210
7	0,0008	0,0005
8		0,3500

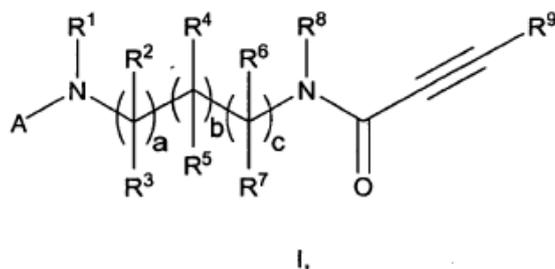
5

2. Las amidas de ácido propiólico sustituidas según la invención muestran una inhibición eficaz de la reacción de dolor en el test de formalina en ratas en caso de una administración i.v. de 21,5 mg/kg.

Ejemplo	Test de formalina (rata) reducción i.v. del comportamiento nociceptivo en comparación con el control en caso de 10 mg/kg [%]
4	75

REIVINDICACIONES

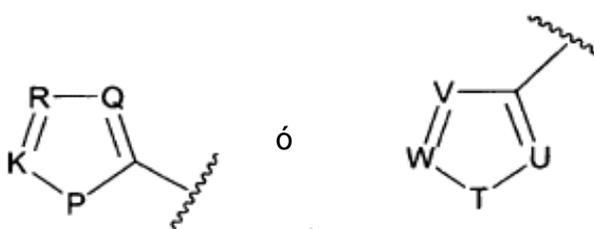
1. Amidas de ácido propiólico sustituidas de fórmula general I,



donde

5 a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 1, 2 o 3;

A representa uno de los siguientes grupos



Q y U representan en cada caso CR<sup>10</sup> o N;

R y V representan en cada caso CR<sup>11</sup> o N;

10 K y W representan en cada caso CR<sup>12</sup> o N;

P y T representan en cada caso O, S o NR<sup>13</sup>;

quedando excluidos los compuestos en los que P representa S, Q representa N, R representa CR<sup>11</sup> y K representa CR<sup>12</sup> o N;

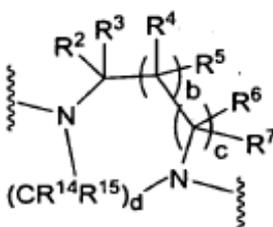
15 R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)cicloalquenilo o -(alquinilen)-cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)-heterocicloalquilo, -(alquenilen)-heterocicloalquilo, -(alquinilen)-heterocicloalquilo, -(alquilen)-heterocicloalquenilo, -(alquenilen)-heterocicloalquenilo o -(alquinilen)-heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)-heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)-heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)-heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)-heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; arilo sustituido o no sustituido; heteroarilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido o no sustituido;

20 R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>, R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup>, R<sup>25</sup>, R<sup>26</sup> y R<sup>27</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -NO<sub>2</sub>; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -NH-C(=O)-H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; -NH-R<sup>35</sup>; -NR<sup>36</sup>R<sup>37</sup>; -O-C(=O)-R<sup>38</sup>; -NH-C(=O)-R<sup>39</sup>; -NR<sup>40</sup>-C(=O)-R<sup>41</sup>; -O-R<sup>42</sup>; -S-R<sup>43</sup>; -NH-C(=O)-NH-R<sup>44</sup>; -NH-C(=S)-NH-R<sup>45</sup>; -NH-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>46</sup>; -NR<sup>47</sup>-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>48</sup>; alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)-cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)-cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)heterocicloalquilo, -

5 (alquenilen)heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)-heterocicloalquenilo o -(alquinilen)heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(heteroalquilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; arilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroarilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido;

10 o  $R^2$  y  $R^3$ , o  $R^4$  y  $R^5$ , o  $R^6$  y  $R^7$ , o  $R^{14}$  y  $R^{15}$ , o  $R^{16}$  y  $R^{17}$ , o  $R^{18}$  y  $R^{19}$ , o  $R^{20}$  y  $R^{21}$ , o  $R^{22}$  y  $R^{23}$ , o  $R^{24}$  y  $R^{25}$ , o  $R^{26}$  y  $R^{27}$ , independientemente entre sí, representan juntos en cada caso un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en un grupo oxo (=O) y un grupo tioxo (=S);

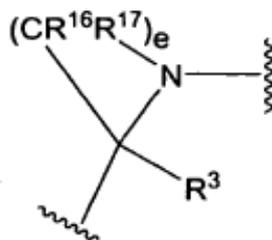
o  $R^1$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3(CR^4R^5)_b-(CR^6R^7)_c$  que los une, forman un grupo de fórmula general B,



B

donde d representa 1, 2 o 3, b representa 0 o 1 y c representa 0 o 1;

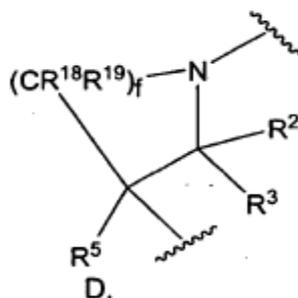
15 o  $R^1$  y  $R^2$ , junto con el grupo  $-N-CR^3$  que los une, forman un grupo de fórmula general C,



C

donde e representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, b representa 0 o 1 y c representa 0;

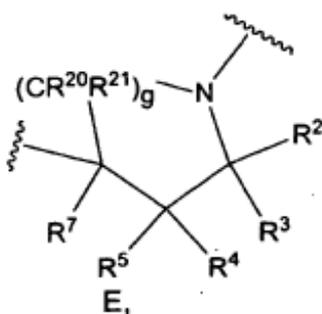
o  $R^1$  y  $R^4$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^5$  que los une, forman un grupo de fórmula general D,



D,

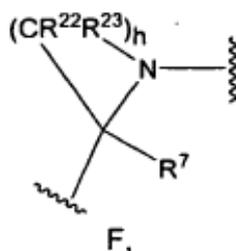
20 en la que f representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, c representa 0;

o  $R^1$  y  $R^6$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^4R^5-CR^7$  que los une, forman un grupo de fórmula general E,



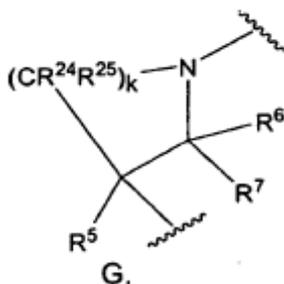
en la que g representa 1, 2 o 3;

o  $R^6$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^7$  que los une, forman un grupo de fórmula general F,



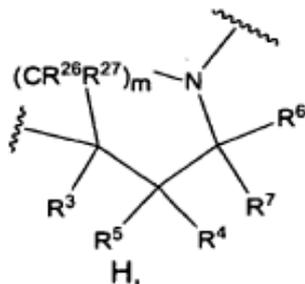
5 en la que h representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, b representa 0 o 1 y a representa 0;

o  $R^4$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^6R^7-CR^5$  que los une, forman un grupo de fórmula general G,



en la que k representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, a representa 0;

o  $R^2$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^6R^7-CR^4R^5-CR^3$  que los une, forman un grupo de fórmula general H,



10

en la que m representa 1, 2 o 3;

$R^9$  representa arilo sustituido o no sustituido o heteroarilo sustituido o no sustituido;

15  $R^{10}$ ,  $R^{11}$  y  $R^{12}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I;  $-NO_2$ ;  $-CN$ ;  $-NH_2$ ;  $-OH$ ;  $-SH$ ;  $-C(=O)-OH$ ;  $-C(=O)-H$ ;  $-NH-C(=O)-H$ ;  $-C(=O)-R^{28}$ ;  $-C(=O)-O-R^{29}$ ;  $-C(=O)-NH_2$ ;  $-C(=O)-NH-R^{30}$ ;  $-C(=O)-NR^{31}R^{32}$ ;  $-S(=O)-R^{33}$ ;  $-S(=O)_2-R^{34}$ ;  $-NH-R^{35}$ ;  $-NR^{36}R^{37}$ ;  $-O-C(=O)-R^{38}$ ;  $-NH-C(=O)-R^{39}$ ;  $-NR^{40}-C(=O)-R^{41}$ ;  $-O-R^{42}$ ;  $-S-R^{43}$ ;  $-NH-C(=O)-NH-R^{44}$ ;  $-NH-C(=S)-NH-R^{45}$ ;  $-NH-S(=O)_2-R^{46}$ ;  $-NR^{47}-S(=O)_2-R^{48}$ ; alquilo, alqueno o alquino sustituido al menos de forma

- simple o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)-cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)-cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)-cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)-cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)heterocicloalquilo, -(alquenilen)heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)-heterocicloalquenilo o -(alquinilen)heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(heteroalquilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; arilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroarilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)-arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido;
- 5 15  $R^{13}$  representa H; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)-cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)-cicloalquenilo o -(alquinilen)-cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)heterocicloalquilo, -(alquenilen)heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)-heterocicloalquenilo, -(alquinilen)-heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(heteroalquilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; arilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroarilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)-arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido;
- 20 25 30 y R<sup>28</sup>, R<sup>29</sup>, R<sup>30</sup>, R<sup>31</sup>, R<sup>32</sup>, R<sup>33</sup>, R<sup>34</sup>, R<sup>35</sup>, R<sup>36</sup>, R<sup>37</sup>, R<sup>38</sup>, R<sup>39</sup>, R<sup>40</sup>, R<sup>41</sup>, R<sup>42</sup>, R<sup>43</sup>, R<sup>44</sup>, R<sup>45</sup>, R<sup>46</sup>, R<sup>47</sup> y R<sup>48</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)-cicloalquenilo o -(alquinilen)-cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)heterocicloalquilo, -(alquenilen)heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)-heterocicloalquenilo, -(alquinilen)-heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; arilo sustituido o no sustituido; heteroarilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)-arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido o no sustituido;
- 35 40 45 refiriéndose el concepto "sustituido" en relación con los grupos "alquilo", "alquenilo", "alquinilo", "heteroalquilo", "heteroalquenilo" y "heteroalquinilo" a que el grupo correspondiente está sustituido de forma simple o múltiple con sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-fenilo), -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-fenilo), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-fenilo, -C(=S)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=S)-fenilo, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-O-fenilo, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub> y -SO<sub>3</sub>H, pudiendo los grupos alquilo(C<sub>1-5</sub>) arriba mencionados ser en cada caso lineales o ramificados y pudiendo estar sustituidos los grupos fenilo arriba mencionados con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo ;
- 50 55 60 refiriéndose el concepto "sustituido" en relación con los grupos "cicloalquilo", "heterocicloalquilo", "cicloalquenilo" y "heterocicloalquenilo" a que el grupo correspondiente está sustituido de forma simple o múltiple con sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alquenilo(C<sub>2-5</sub>), -alquinilo(C<sub>2-5</sub>), -C=C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, oxo (=O), tioxo (=S), -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -N(H)(alquilo(C<sub>1-5</sub>)), -NO<sub>2</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-N(H)(alquilo(C<sub>1-5</sub>)) y fenilo, pudiendo los grupos alquilo(C<sub>1-5</sub>) arriba mencionados ser en cada

5 caso lineales o ramificados y pudiendo cada uno de los grupos fenilo arriba mencionados no estar sustituido o estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquino(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>) y -C(=O)-CF<sub>3</sub>;

10 refiriéndose el concepto "sustituido" en relación con los grupos "arilo" y "heteroarilo" a que el grupo correspondiente está sustituido de forma simple o múltiple con sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquino(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub>, -S-CH<sub>2</sub>F, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-O-fenilo, -C(=O)-H; -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-fenilo, -O-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-C(=O)-fenilo, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -C(=O)-NH-fenilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, pirazolilo, fenilo, furilo (furanilo), tiazolilo, tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo), bencilo y fenetilo, pudiendo los grupos alquilo(C<sub>1-5</sub>) arriba mencionados ser en cada caso lineales o ramificados y pudiendo los sustituyentes cíclicos o los grupos cíclicos de estos sustituyentes estar sustituidos a su vez en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquino(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -OCHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub> y -S-CH<sub>2</sub>F;

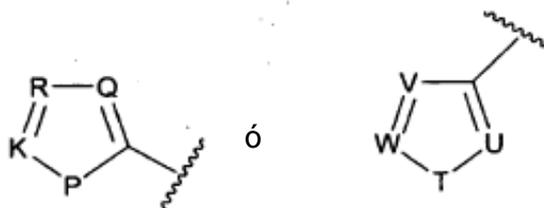
25 refiriéndose el concepto "sustituido" en relación con los grupos "alqueno", "alquenoileno", "alquinoileno", "heteroalqueno" y "heteroalquenoileno" a que el grupo correspondiente está sustituido de forma simple o múltiple con sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en fenilo, F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -SH, -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -NH<sub>2</sub>, -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -NH-fenilo, -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-fenilo), -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-fenilo), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-fenilo, -C(=S)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=S)-fenilo, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-O-fenilo, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub> y -SO<sub>3</sub>H, pudiendo los grupos alquilo(C<sub>1-5</sub>) arriba mencionados ser en cada caso lineales o ramificados y pudiendo estar sustituidos los grupos fenilo arriba mencionados con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueno(C<sub>2-5</sub>), -alquino(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub> y -S-CH<sub>2</sub>F;

35 en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

2. Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 1, 2 o 3;

A representa uno de los siguientes grupos



- Q y U                    representan en cada caso CR<sup>10</sup> o N;
- R y V                    representan en cada caso CR<sup>11</sup> o N;
- K y W                    representan en cada caso CR<sup>12</sup> o N;
- P y T                    representan en cada caso O, S o NR<sup>13</sup>;

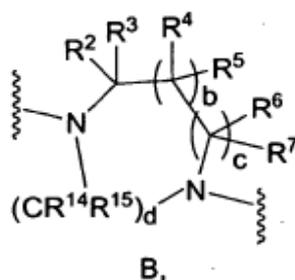
45 quedando excluidos los compuestos en los que P representa S, Q representa N, R representa CR<sup>11</sup> y K representa CR<sup>12</sup> o N;

5  $R^1$  y  $R^8$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; -C(=O)- $R^{28}$ ; -C(=O)-O- $R^{29}$ ; -C(=O)-NH- $R^{30}$ ; -C(=O)-NR<sup>31</sup> $R^{32}$ ; -S(=O)- $R^{33}$ ; -S(=O)<sub>2</sub>- $R^{34}$ ; alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)heterocicloalquilo, -(alquenilen)heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)heterocicloalquenilo o -(alquinilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; arilo sustituido o no sustituido; heteroarilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido o no sustituido;

15  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{18}$ ,  $R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$ ,  $R^{22}$ ,  $R^{23}$ ,  $R^{24}$ ,  $R^{25}$ ,  $R^{26}$  y  $R^{27}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -NO<sub>2</sub>; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -NH-C(=O)-H; -C(=O)- $R^{28}$ ; -C(=O)-O- $R^{29}$ ; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH- $R^{30}$ ; -C(=O)-NR<sup>31</sup> $R^{32}$ ; -S(=O)- $R^{33}$ ; -S(=O)<sub>2</sub>- $R^{34}$ ; -NH- $R^{35}$ ; -NR<sup>36</sup> $R^{37}$ ; -O-C(=O)- $R^{38}$ ; -NH-C(=O)- $R^{39}$ ; -NR<sup>40</sup>-C(=O)- $R^{41}$ ; -O- $R^{42}$ ; -S- $R^{43}$ ; -NH-C(=O)-NH- $R^{44}$ ; -NH-C(=S)-NH- $R^{45}$ ; -NH-S(=O)<sub>2</sub>- $R^{46}$ ; -NR<sup>47</sup>-S(=O)<sub>2</sub>- $R^{48}$ ; alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)-cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)-cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)heterocicloalquilo, -(alquenilen)heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)heterocicloalquenilo o -(alquinilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; arilo sustituido o no sustituido; heteroarilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido o no sustituido;

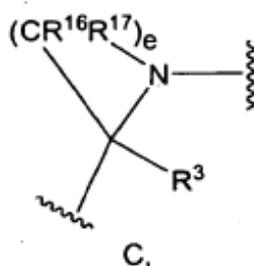
20  $R^2$  y  $R^3$ , o  $R^4$  y  $R^5$ , o  $R^6$  y  $R^7$ , o  $R^{14}$  y  $R^{15}$ , o  $R^{16}$  y  $R^{17}$ , o  $R^{18}$  y  $R^{19}$ , o  $R^{20}$  y  $R^{21}$ , o  $R^{22}$  y  $R^{23}$ , o  $R^{24}$  y  $R^{25}$ , o  $R^{26}$  y  $R^{27}$ , independientemente entre sí, representan juntos en cada caso un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en un grupo oxo (=O) y un grupo tioxo (=S);

30  $R^1$  y  $R^8$ , junto con el grupo -N-CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>-(CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>)<sub>b</sub>-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>c</sub> que los une, forman un grupo de fórmula general B,



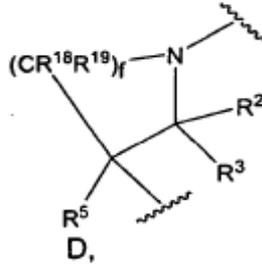
en la que d representa 1, 2 o 3, b representa 0 o 1 y c representa 0 o 1;

o  $R^1$  y  $R^2$ , junto con el grupo -N-CR<sup>3</sup> que los une, forman un grupo de fórmula general C,



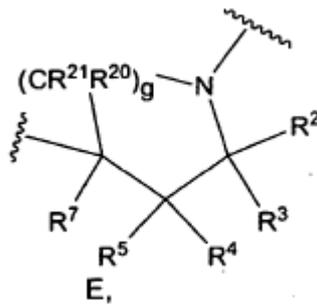
en la que e representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, b representa 0 o 1 y c representa 0;

o  $R^1$  y  $R^4$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^5$  que los une, forman un grupo de fórmula general D,



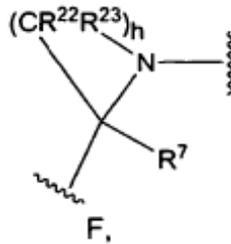
en la que f representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, c representa 0;

5 o  $R^1$  y  $R^6$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^4R^5-CR^7$  que los une, forman un grupo de fórmula general E,



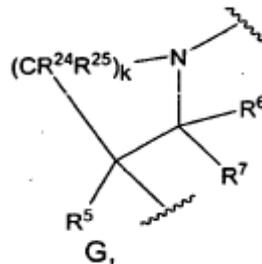
en la que g representa 1, 2 o 3;

o  $R^6$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^7$  que los une, forman un grupo de fórmula general F,



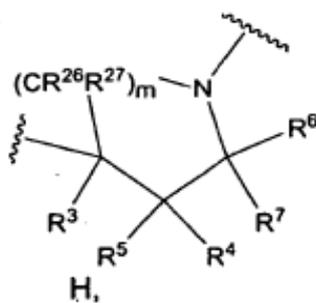
10 en la que h representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, b representa 0 o 1 y a representa 0;

o  $R^4$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^6R^7-CR^5$  que los une, forman un grupo de fórmula general G,



en la que k representa 1, 2, 3 o 4 y, en este caso, a representa 0;

o  $R^2$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^6R^7-CR^4R^5-CR^3$  que los une, forman un grupo de fórmula general H,



en la que m representa 1, 2 o 3;

R<sup>9</sup> representa arilo sustituido o no sustituido o heteroarilo sustituido o no sustituido;

R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> y R<sup>12</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -NO<sub>2</sub>; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -NH-C(=O)-H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; -NH-R<sup>35</sup>; -NR<sup>36</sup>R<sup>37</sup>; -O-C(=O)-R<sup>38</sup>; -NH-C(=O)-R<sup>39</sup>; -NR<sup>40</sup>-C(=O)-R<sup>41</sup>; -O-R<sup>42</sup>; -S-R<sup>43</sup>; -NH-C(=O)-NH-R<sup>44</sup>; -NH-C(=S)-NH-R<sup>45</sup>; -NH-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>46</sup>; -NR<sup>47</sup>-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>48</sup>; alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)heterocicloalquilo, -(alquenilen)heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)heterocicloalquenilo o -(alquinilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; arilo sustituido o no sustituido; heteroarilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido o no sustituido;

R<sup>13</sup> representa H; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido al menos de forma simple o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)-heterocicloalquilo, -(alquenilen)heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)heterocicloalquenilo o -(alquinilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)-heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)-heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; arilo sustituido o no sustituido; heteroarilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido o no sustituido;

y R<sup>28</sup>, R<sup>29</sup>, R<sup>30</sup>, R<sup>31</sup>, R<sup>32</sup>, R<sup>33</sup>, R<sup>34</sup>, R<sup>35</sup>, R<sup>36</sup>, R<sup>37</sup>, R<sup>38</sup>, R<sup>39</sup>, R<sup>40</sup>, R<sup>41</sup>, R<sup>42</sup>, R<sup>43</sup>, R<sup>44</sup>, R<sup>45</sup>, R<sup>46</sup>, R<sup>47</sup> y R<sup>48</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso alquilo, alquenilo o alquinilo sustituido o no sustituido; heteroalquilo, heteroalquenilo o heteroalquinilo sustituido o no sustituido; cicloalquilo o cicloalquenilo sustituido o no sustituido; heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)cicloalquilo, -(alquenilen)cicloalquilo, -(alquinilen)cicloalquilo, -(alquilen)cicloalquenilo, -(alquenilen)cicloalquenilo o -(alquinilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)cicloalquilo, -(heteroalquenilen)cicloalquilo, -(heteroalquilen)cicloalquenilo o -(heteroalquenilen)cicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)heterocicloalquilo, -(alquenilen)heterocicloalquilo, -(alquinilen)heterocicloalquilo, -(alquilen)heterocicloalquenilo, -(alquenilen)heterocicloalquenilo o -(alquinilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; -(heteroalquilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquenilen)heterocicloalquilo, -(heteroalquilen)heterocicloalquenilo o -(heteroalquenilen)heterocicloalquenilo sustituido o no sustituido; arilo sustituido o no sustituido; heteroarilo sustituido o no sustituido; -(alquilen)arilo, -(alquenilen)arilo, -(alquinilen)arilo, -(heteroalquilen)arilo o -(heteroalquenilen)arilo sustituido o no sustituido; o -(alquilen)heteroarilo, -(alquenilen)heteroarilo, -(alquinilen)heteroarilo, -(heteroalquilen)heteroarilo o -(heteroalquenilen)heteroarilo sustituido o no sustituido; y

los grupos alquilo arriba mencionados son en cada caso ramificados o lineales y presentan 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 átomos de carbono como miembros de la cadena;

- los grupos alquenilo arriba mencionados son en cada caso ramificados o lineales y presentan 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 átomos de carbono como miembros de la cadena;
- los grupos alquinilo arriba mencionados son en cada caso ramificados o lineales y presentan 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 átomos de carbono como miembros de la cadena;
- 5 los grupos heteroalquilo, heteroalquenilo y heteroalquinilo arriba mencionados tienen en cada caso 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 miembros;
- los grupos heteroalquilo, heteroalquenilo y heteroalquinilo arriba mencionados presentan en cada caso opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno como miembros de la cadena;
- 10 los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo, heteroalquilo, heteroalquenilo y heteroalquinilo arriba mencionados pueden estar sustituidos en cada caso opcionalmente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-fenilo), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-fenilo, -C(=S)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=S)-fenilo, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-O-fenilo, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub> y -SO<sub>3</sub>H, pudiendo los grupos fenilo estar sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;
- 15 los grupos cicloalquilo arriba mencionados presentan en cada caso 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9 átomos de carbono como miembros del anillo;
- 20 los grupos cicloalquenilo arriba mencionados presentan en cada caso 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9 átomos de carbono como miembros del anillo;
- los grupos heterocicloalquilo arriba mencionados tienen en cada caso 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9 miembros;
- los grupos heterocicloalquenilo arriba mencionados tienen en cada caso 4, 5, 6, 7, 8 o 9 miembros;
- 25 los grupos heterocicloalquilo y heterocicloalquenilo arriba mencionados presentan en cada caso opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembros del anillo;
- los grupos cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalquenilo o heterocicloalquenilo arriba mencionados pueden estar sustituidos en cada caso opcionalmente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alquenilo(C<sub>2-5</sub>), -alquinilo(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, oxo (=O), tioxo (=S), -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -N(H)(alquilo(C<sub>1-5</sub>)), -NO<sub>2</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -NH-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-N(H)(alquilo(C<sub>1-5</sub>)) y fenilo, pudiendo los grupos fenilo
- 30 en cada caso no estar sustituidos o estar sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alquenilo(C<sub>2-5</sub>), -alquinilo(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-CF<sub>3</sub>, pudiendo los grupos fenilo arriba mencionados estar sustituidos preferentemente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el
- 35 grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OH, -NH<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -SH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;
- 40 los grupos alquilenos arriba mencionados son en cada caso ramificados o lineales y presentan 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 átomos de carbono como miembros de la cadena;
- los grupos alquenileno arriba mencionados son en cada caso ramificados o lineales y presentan 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 átomos de carbono como miembros de la cadena;
- 45 los grupos alquinileno arriba mencionados son en cada caso ramificados o lineales y presentan 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 átomos de carbono como miembros de la cadena;
- los grupos heteroalquilenos y heteroalquenileno arriba mencionados tienen en cada caso 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 miembros;
- 50 los grupos heteroalquilenos y heteroalquenileno arriba mencionados presentan en cada caso 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembros de la cadena;

los grupos alqueno, alqueniño, alquiniño, heteroalqueno o heteroalqueniño arriba mencionados pueden en cada caso no estar sustituidos o estar sustituidos en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en fenilo, F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -SH, -O-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, NH<sub>2</sub>, -N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -NH-fenilo, -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-fenilo), -N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-fenilo), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-fenilo, -C(=S)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=S)fenilo, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-O-fenilo, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub> y -SO<sub>3</sub>H, pudiendo estar sustituidos los grupos fenilo con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueniño(C<sub>2-5</sub>), -alquiniño(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub> y -S-CH<sub>2</sub>F;

los grupos arilo arriba mencionados son monocíclicos o bicíclicos y presentan 6, 10 o 14 átomos de carbono;

los grupos heteroarilo arriba mencionados son monocíclicos, bicíclicos o tricíclicos y presentan 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13 o 14 miembros;

los grupos heteroarilo de 5 a 14 miembros arriba mencionados presentan en caso dado 1, 2, 3, 4 o 5 heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembros del anillo;

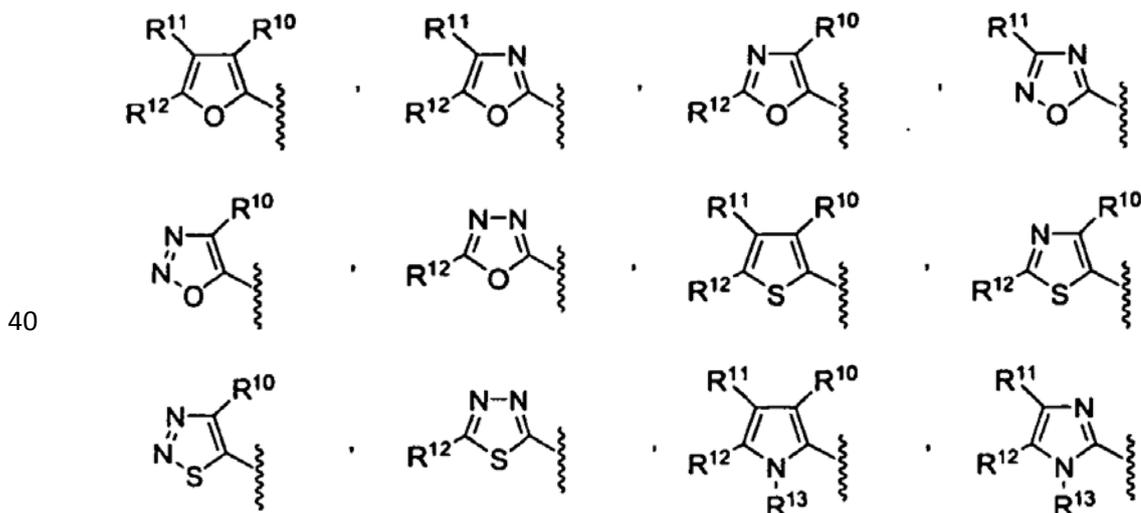
y los grupos arilo y heteroarilo arriba mencionados pueden estar sustituidos en cada caso opcionalmente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueniño(C<sub>2-5</sub>), -alquiniño(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub>, -S-CH<sub>2</sub>F, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-O-fenilo, -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -CH<sub>2</sub>-O-C(=O)-fenilo, -O-C(=O)-fenilo, -O-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -NH-C(=O)-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-N(alquilo(C<sub>1-5</sub>))<sub>2</sub>, -C(=O)-N(alquil(C<sub>1-5</sub>))(fenilo), -C(=O)-NH-fenilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, pirazolilo, fenilo, furilo (furanilo), tiazolilo, tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo), bencilo y fenetilo, pudiendo los sustituyentes cíclicos o los grupos cíclicos de estos sustituyentes estar sustituidos a su vez en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, alquilo(C<sub>1-5</sub>), -(CH<sub>2</sub>)-O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -alqueniño(C<sub>2-5</sub>), -alquiniño(C<sub>2-5</sub>), -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -S-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -S-fenilo, -S-CH<sub>2</sub>-fenilo, -O-alquilo(C<sub>1-5</sub>), -O-fenilo, -O-CH<sub>2</sub>-fenilo, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -O-CF<sub>3</sub>, -O-CHF<sub>2</sub>, -O-CH<sub>2</sub>F, -C(=O)-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -S-CHF<sub>2</sub>, -S-CH<sub>2</sub>F;

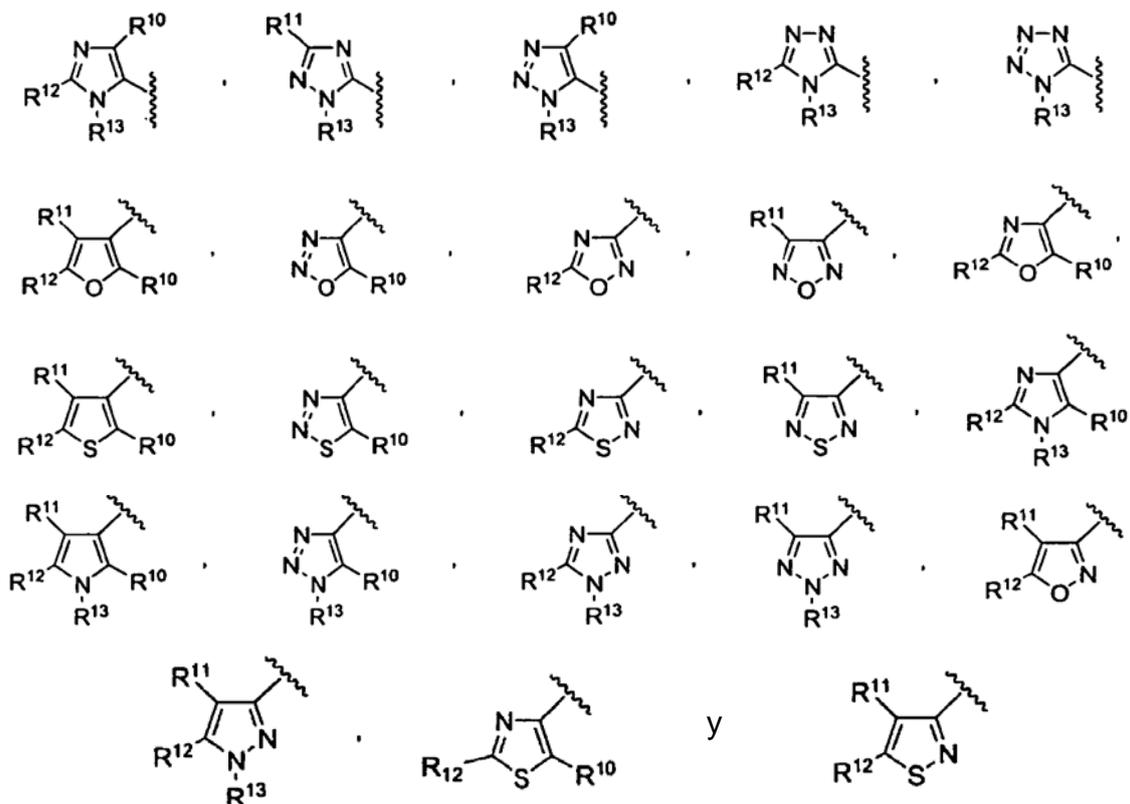
en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

3. Compuestos según la reivindicación 1 o 2, caracterizados porque

a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 1, 2 o 3;

A representa un grupo seleccionado de entre





5

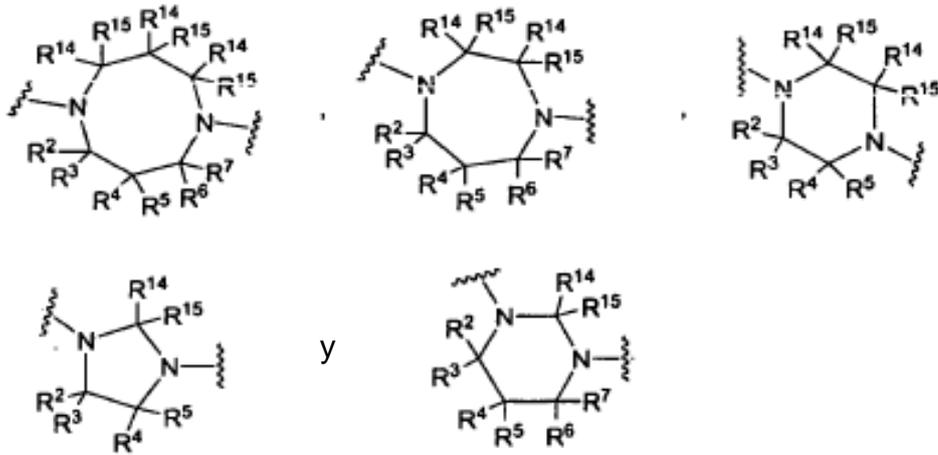
R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; alquilo(C<sub>1-6</sub>) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH y -NH<sub>2</sub>; cicloalquilo(C<sub>3-8</sub>) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH y -NH<sub>2</sub>; o un grupo fenilo que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo(C<sub>1-3</sub>), alquenilenilo(C<sub>2-3</sub>) o alquinilenilo(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> y -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>;

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>, R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup>, R<sup>25</sup>, R<sup>26</sup> y R<sup>27</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -NO<sub>2</sub>; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-OH; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -NH-R<sup>35</sup>; -NR<sup>36</sup>R<sup>37</sup>; -O-R<sup>42</sup>; -S-R<sup>43</sup>; alquilo(C<sub>1-6</sub>) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH y -NH<sub>2</sub>; cicloalquilo(C<sub>3-7</sub>), cicloalquenilo(C<sub>5-6</sub>), heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros o heterocicloalquenilo de 5 a 7 miembros, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo(C<sub>1-3</sub>), alquenilenilo(C<sub>2-3</sub>) o alquinilenilo(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, oxo, tioxo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub> y -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>; o un grupo seleccionado de entre fenilo, naftilo, antraceno, pirrolilo, indolilo, furanilo, benzo[b]furanilo, tiofenilo, benzo[b]tiofenilo, benzo[d]tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, isoxazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, piranilo, indazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo y quinazolinilo; que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alquilenilo(C<sub>1-3</sub>), alquenilenilo(C<sub>2-3</sub>) o alquinilenilo(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> y -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>;

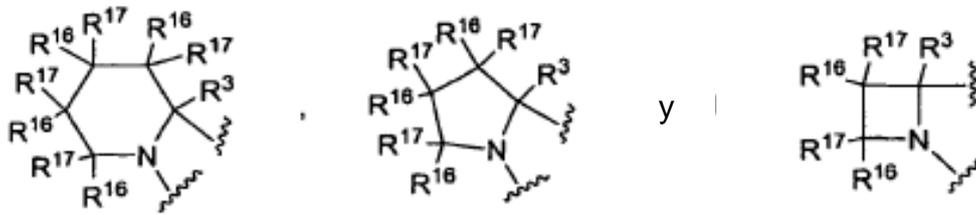
30

o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup>, o R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup>, o R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup>, o R<sup>14</sup> y R<sup>15</sup>, o R<sup>16</sup> y R<sup>17</sup>, o R<sup>18</sup> y R<sup>19</sup>, o R<sup>20</sup> y R<sup>21</sup>, o R<sup>22</sup> y R<sup>23</sup>, o R<sup>24</sup> y R<sup>25</sup>, o R<sup>26</sup> y R<sup>27</sup>, independientemente entre sí, representan juntos en cada caso un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en un grupo oxo (=O) y un grupo tioxo (=S);

o R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>(CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>)<sub>b</sub>-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>c</sub> que los une, forman un grupo seleccionado de entre

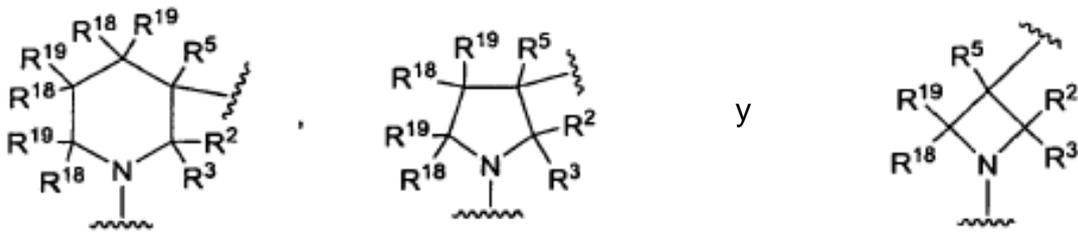


o  $R^1$  y  $R^2$ , junto con el grupo  $-N-CR^3$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre



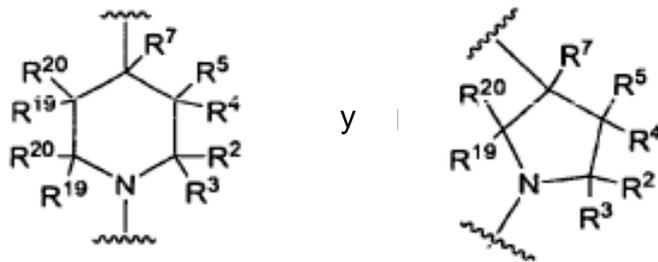
5 y en este caso b representa 1 y c representa 0;

o  $R^1$  y  $R^4$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^5$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre



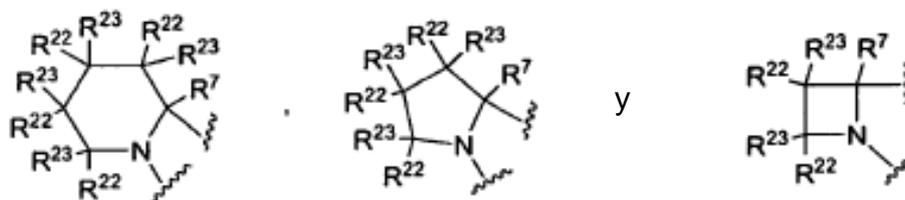
y en este caso c representa 0;

o  $R^1$  y  $R^6$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^4R^5-CR^7$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre



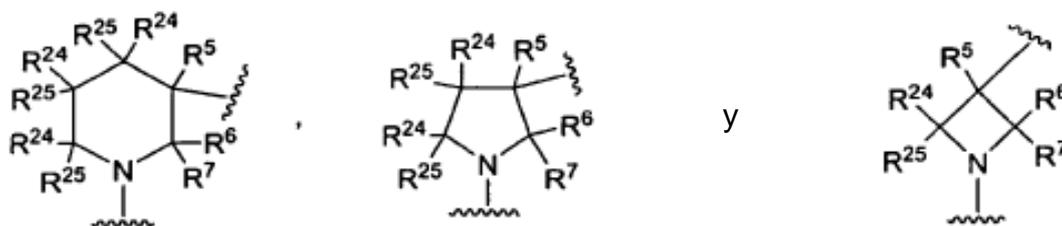
10

o  $R^6$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^7$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre



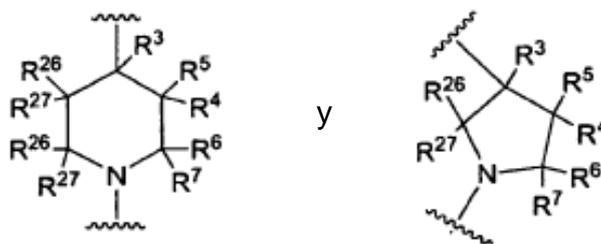
y en este caso b representa 1 y a representa 0;

o  $R^4$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^6R^7-CR^5$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre



5 y en este caso a representa 0;

o  $R^2$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^6R^7-CR^4R^5-CR^3$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre



10  $R^9$  representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, furilo, tienilo, pirazolilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, piridinilo, pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, triazolilo, imidazolilo, indolilo, benzo[b]tiofenilo, benzo[d]tiazolilo, benzo[b]furanilo, quinolinilo, isoquinolinilo y quinazolinilo, en cada caso no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo,  $-C=C-Si(CH_3)_3$ ,  $-C=C-Si(C_2H_5)_3$ ,  $-CH_2-O-CH_3$ ,  $-CH_2-O-C_2H_5$ , -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -CHF<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -NH-S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-H; -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> y fenilo;

20  $R^{10}$ ,  $R^{11}$  y  $R^{12}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -NO<sub>2</sub>; -CN; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -C(=O)-OH; -C(=O)-H; -NH-C(=O)-H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; -NH-R<sup>35</sup>; -NR<sup>36</sup>R<sup>37</sup>; -O-C(=O)-R<sup>38</sup>; -NH-C(=O)-R<sup>39</sup>; -NR<sup>40</sup>-C(=O)-R<sup>41</sup>; -O-R<sup>42</sup>; -S-R<sup>43</sup>-NH-C(=O)-NH-R<sup>44</sup>; -NH-C(=S)-NH-R<sup>45</sup>; -NH-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>46</sup>; -NR<sup>47</sup>-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>48</sup>; alquilo(C<sub>1-6</sub>) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -NO<sub>2</sub>, -CN, -OH, -SH y -NH<sub>2</sub>; alqueno(C<sub>2-6</sub>); alquino(C<sub>2-6</sub>); cicloalquilo(C<sub>3-7</sub>), cicloalqueno(C<sub>5-6</sub>), heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros o heterocicloalqueno de 5 a 7 miembros, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo C<sub>1-3</sub>-alqueno, C<sub>2-3</sub>-alqueno o C<sub>2-3</sub>-alquino y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado por 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, oxo, tioxo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -S-CH<sub>3</sub> y -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>; o un radical seleccionado entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, tienilo, furilo, piridinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo e isoxazolilo, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alqueno(C<sub>1-3</sub>), alqueno(C<sub>2-3</sub>) o alquino(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -C(=O)-OH, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F y -O-CF<sub>3</sub>;

$R^{13}$  representa H;  $-C(=O)-R^{28}$ ;  $-C(=O)-H$ ;  $-C(=O)-O-R^{29}$ ;  $-C(=O)-NH_2$ ;  $-C(=O)-NH-R^{30}$ ;  $-C(=O)-NR^{31}R^{32}$ ;  $-S(=O)-R^{33}$ ;  $-S(=O)_2-R^{34}$ ; alquilo(C<sub>1-6</sub>) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-SH$  y  $-NH_2$ ; cicloalquilo(C<sub>3-7</sub>), cicloalqueno(C<sub>5-6</sub>), heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros o heterocicloalqueno de 5 a 7 miembros, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alqueno(C<sub>1-3</sub>), alquilenilo(C<sub>2-3</sub>) o alquinileno(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ , oxo, tioxo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-NH_2$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NO_2$ ,  $-CF_3$ ,  $-O-CF_3$ ,  $-S-CF_3$ ,  $-SH$ ,  $-S-CH_3$  y  $-S-C_2H_5$ ; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, tienilo, furilo, piridinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo e isoxazolilo, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alqueno(C<sub>1-3</sub>), alquilenilo(C<sub>2-3</sub>) o alquinileno(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-S-CH_3$ ,  $-S-C_2H_5$ ,  $-S(=O)-CH_3$ ,  $-S(=O)_2-CH_3$ ,  $-S(=O)-C_2H_5$ ,  $-S(=O)_2-C_2H_5$ ,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-CF_3$ ,  $-CHF_2$ ,  $-CH_2F$  y  $-O-CF_3$ ;

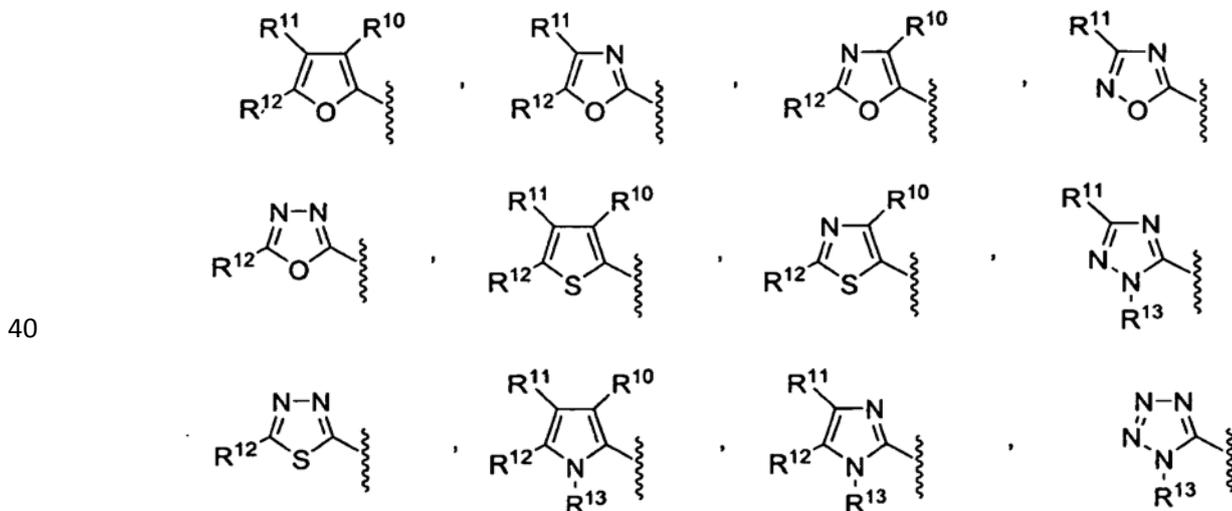
y  $R^{28}$ ,  $R^{29}$ ,  $R^{30}$ ,  $R^{31}$ ,  $R^{32}$ ,  $R^{33}$ ,  $R^{34}$ ,  $R^{35}$ ,  $R^{36}$ ,  $R^{37}$ ,  $R^{38}$ ,  $R^{39}$ ,  $R^{40}$ ,  $R^{41}$ ,  $R^{42}$ ,  $R^{43}$ ,  $R^{44}$ ,  $R^{45}$ ,  $R^{46}$ ,  $R^{47}$  y  $R^{48}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso alquilo(C<sub>1-6</sub>) no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-SH$  y  $-NH_2$ ; cicloalquilo(C<sub>3-7</sub>), cicloalqueno(C<sub>5-6</sub>), heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros o heterocicloalqueno de 5 a 7 miembros, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alqueno(C<sub>1-3</sub>), alquilenilo(C<sub>2-3</sub>) o alquinileno(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ , oxo, tioxo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-NH_2$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NO_2$ ,  $-CF_3$ ,  $-O-CF_3$ ,  $-S-CF_3$ ,  $-SH$ ,  $-S-CH_3$  y  $-S-C_2H_5$ ; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, naftilo, antraceno, pirrolilo, indolilo, furanilo, benzo[b]furanilo, tiofenilo, benzo[b]tiofenilo, benzo[d]tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, isoxazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, piranilo, indazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo y quinazolinilo, que puede estar unido en cada caso a través de un grupo alqueno(C<sub>1-3</sub>), alquilenilo(C<sub>2-3</sub>) o alquinileno(C<sub>2-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I,  $-CN$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo,  $-OH$ ,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-C_3H_7$ ,  $-NH_2$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NO_2$ ,  $-CF_3$ ,  $-O-CF_3$ ,  $-S-CF_3$ ,  $-SH$ ,  $-NH-S(=O)_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-N(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-NH-CH_3$ ,  $-NH-C(=O)-CH_3$ ,  $-NH-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-CH_3$  y  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ;

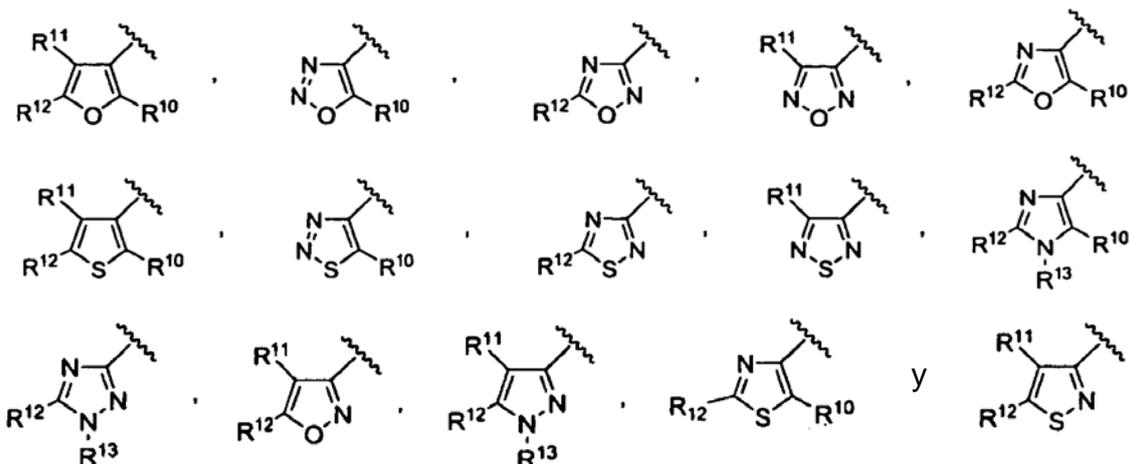
en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

4. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizados porque

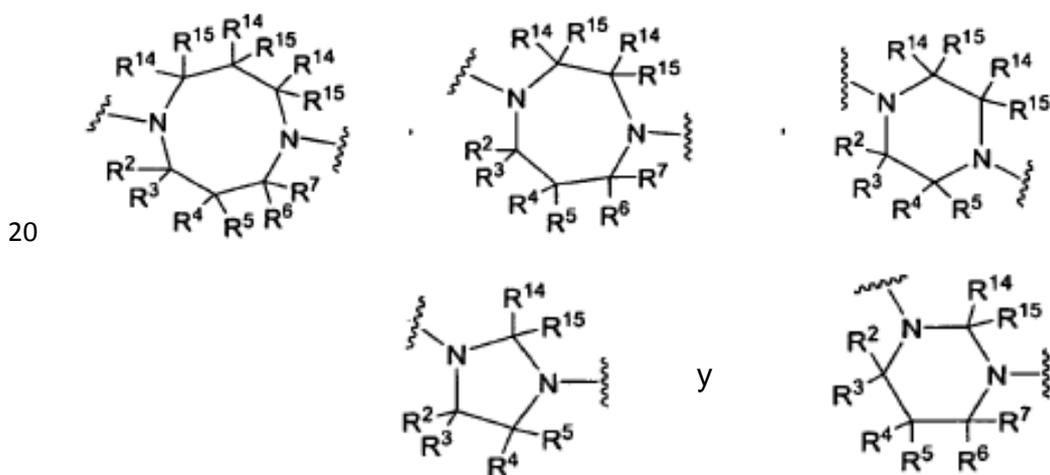
a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 1, 2 o 3;

A representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en

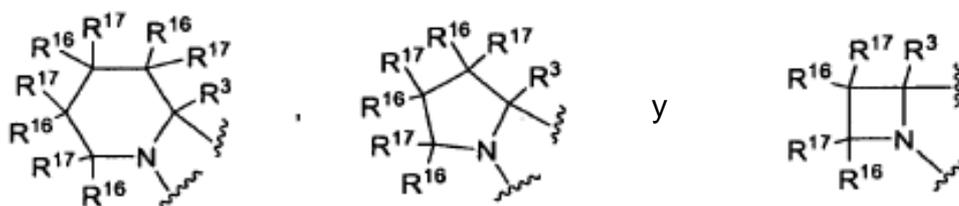




- 5 R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo; un grupo cicloalquilo seleccionado de entre el grupo consistente en ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo; o un grupo bencilo o fenilo no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> y -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>;
- 10 R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>, R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup>, R<sup>25</sup>, R<sup>26</sup> y R<sup>27</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -NH<sub>2</sub>; -OH; -SH; -CN; -NO<sub>2</sub>; -CF<sub>3</sub>; -NH-R<sup>35</sup>; -NR<sup>36</sup>R<sup>37</sup>; -O-R<sup>42</sup>; -S-R<sup>43</sup>; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo;
- 15 o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup>, o R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup>, o R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup>, o R<sup>14</sup> y R<sup>15</sup>, o R<sup>16</sup> y R<sup>17</sup>, o R<sup>18</sup> y R<sup>19</sup>, o R<sup>20</sup> y R<sup>21</sup>, o R<sup>22</sup> y R<sup>23</sup>, o R<sup>24</sup> y R<sup>25</sup>, o R<sup>26</sup> y R<sup>27</sup>, independientemente entre sí, representan juntos en cada caso un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en un grupo oxo (=O) y un grupo tioxo (=S);
- o R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>(CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>)<sub>b</sub>-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>c</sub> que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en

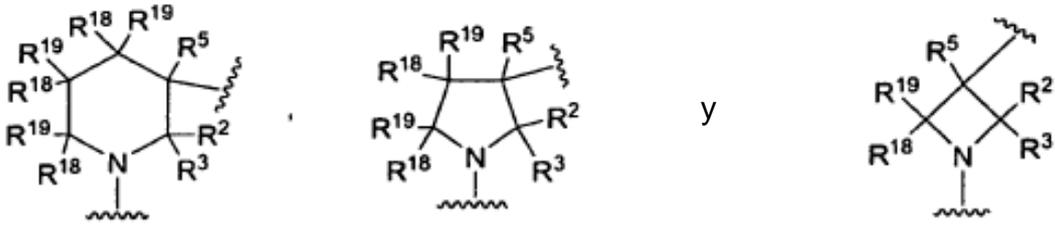


o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>3</sup> que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



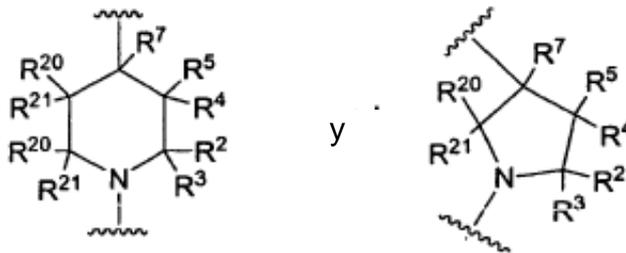
y en este caso b representa 1 y c representa 0;

o  $R^1$  y  $R^4$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^5$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en

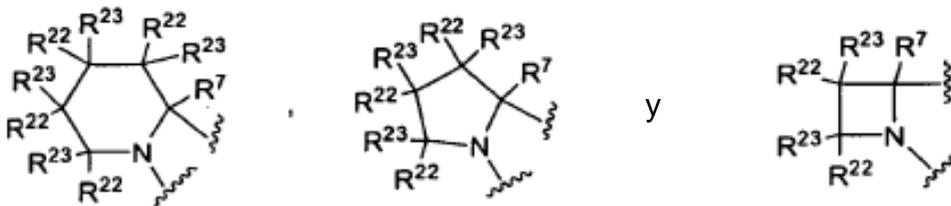


y en este caso c representa 0;

- 5  $R^1$  y  $R^6$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^4R^5-CR^7$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en

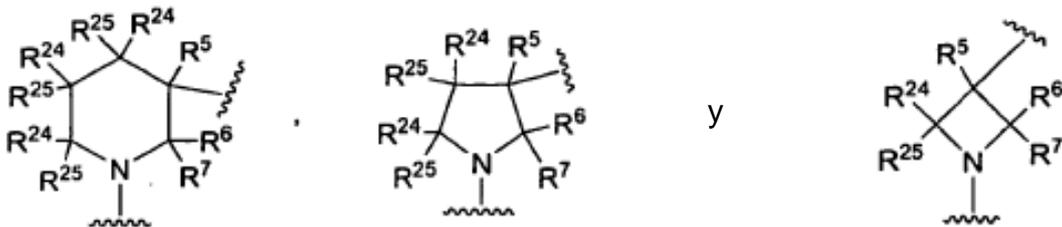


o  $R^6$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^7$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



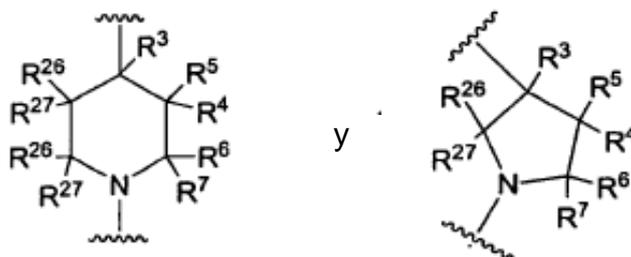
- 10 y en este caso b representa 1 y a representa 0;

o  $R^4$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^6R^7-CR^5$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



y en este caso a representa 0;

- 15 o  $R^2$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^6R^7-CR^4R^5-CR^3$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



5  $R^9$  representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, furilo, tienilo, pirazolilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, piridinilo, pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, triazolilo e imidazolilo, en cada caso no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, ciclopropilo, ciclobutilo, -C≡C-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C≡C-Si(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -CHF<sub>2</sub>, -O-CF<sub>3</sub>, -S-CF<sub>3</sub>, -SH, -NH-S(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-H; -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-CH<sub>3</sub>, -NH-C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> y fenilo;

10  $R^{10}$ ,  $R^{11}$  y  $R^{12}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -CF<sub>3</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CN; -C(=O)-OH; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -C(=O)-NH<sub>2</sub>; -C(=O)-NH-R<sup>30</sup>; -C(=O)-NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; -O-R<sup>42</sup>; -S-R<sup>43</sup>; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo; un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en etenilo, etinilo, alilo y propinilo; un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en ciclopropilo, ciclobutilo y ciclopentilo; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, bencilo, fenetilo, oxadiazolilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-furilo y 3-furilo, en cada caso no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>;

15  $R^{13}$  representa H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; -C(=O)-H; -C(=O)-O-R<sup>29</sup>; -S(=O)-R<sup>33</sup>; -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>34</sup>; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo; un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo; o un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, bencilo, fenetilo, oxadiazolilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-furilo y 3-furilo, que en cada caso puede estar unido a través de un grupo alquileo(C<sub>1-3</sub>) y/o que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>;

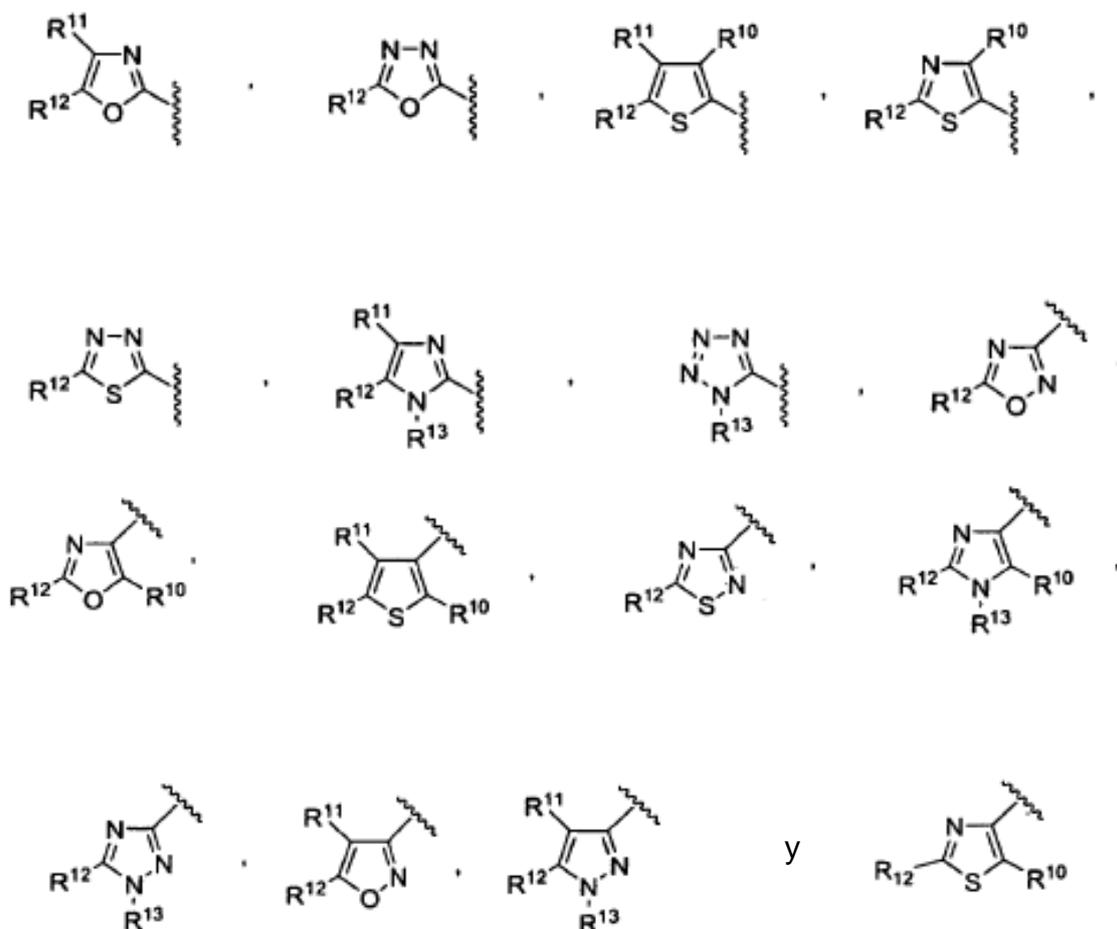
20 y  $R^{28}$ ,  $R^{29}$ ,  $R^{30}$ ,  $R^{31}$ ,  $R^{32}$ ,  $R^{33}$ ,  $R^{34}$ ,  $R^{35}$ ,  $R^{36}$ ,  $R^{37}$ ,  $R^{42}$  y  $R^{43}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo; -CF<sub>3</sub>; -C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>; -CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>; o un grupo fenilo, bencilo o fenetilo, que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>;

25 en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

30 **5.** Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizados porque

a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 1, 2 o 3;

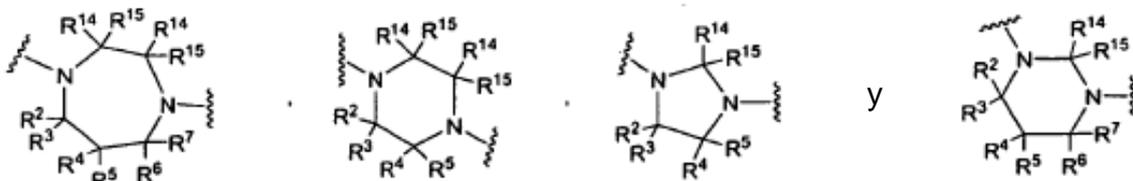
35 **A** representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



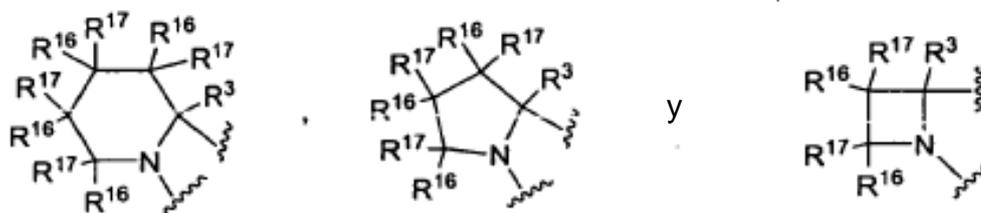
5  $R^1$  y  $R^8$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H;  $-C(=O)-R^{28}$ ;  $-C(=O)-O-R^{29}$ ; un grupo alquilo seleccionado entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo; o un grupo ciclopropilo;

10  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{18}$ ,  $R^{19}$ ,  $R^{22}$ ,  $R^{23}$ ,  $R^{24}$  y  $R^{25}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I;  $-NH_2$ ;  $-OH$ ;  $-SH$ ;  $-CN$ ;  $-NO_2$ ;  $-CF_3$ ;  $-NH-R^{35}$ ;  $-NR^{36}R^{37}$ ;  $-O-R^{42}$ ;  $-S-R^{43}$ ; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo; o un grupo ciclopropilo;

o  $R^1$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3(CR^4R^5)_b-(CR^6R^7)_c$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en

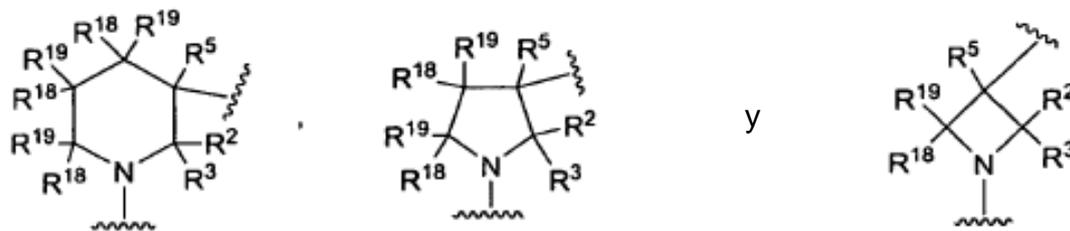


o  $R^1$  y  $R^2$ , junto con el grupo  $-N-CR^3$  que los une, forman un grupo seleccionado dentro del grupo consistente en



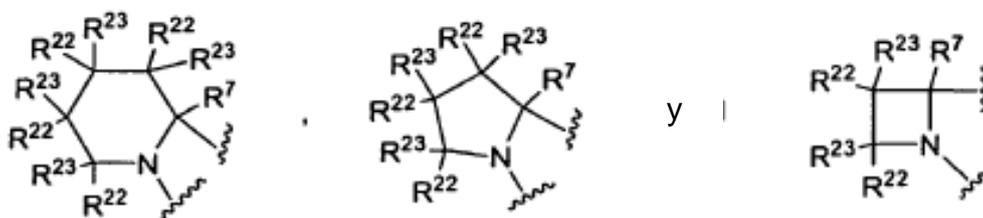
y en este caso b representa 1 y c representa 0;

o  $R^1$  y  $R^4$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^5$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



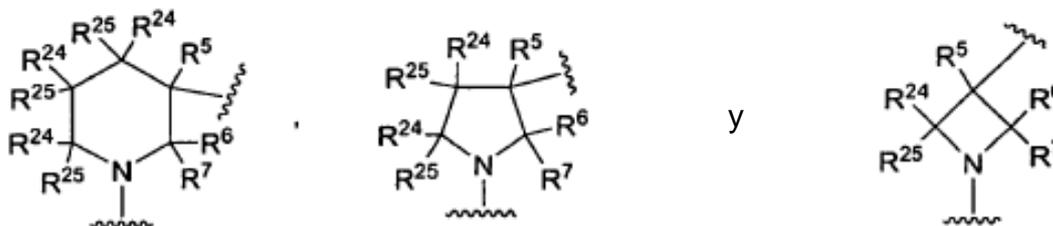
y en este caso c representa 0;

5 o  $R^6$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^7$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



y en este caso b representa 1 y a representa 0;

o  $R^4$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^6R^7-CR^5$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



10 y en este caso a representa 0;

$R^9$  representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo, tienilo, pirazolilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, piridinilo, tiazolilo y tiadiazolilo, en cada caso no sustituido o sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, ciclopropilo, ciclobutilo,  $-C\equiv C-$

15  $-Si(CH_3)_3$ ,  $-C\equiv C-Si(C_2H_5)_3$ ,  $-CH_2-O-CH_3$ ,  $-CH_2-O-C_2H_5$ , -OH, -O- $CH_3$ , -O- $C_2H_5$ , -O- $C_3H_7$ , -S- $CH_3$ , -S- $C_2H_5$ , -S(=O)- $CH_3$ , -S(=O)- $C_2H_5$ , -S(=O)- $C_2H_5$ , -NH $_2$ , -N( $CH_3$ ) $_2$ , -N( $C_2H_5$ ) $_2$ , -NH- $CH_3$ , -NH- $C_2H_5$ , -NO $_2$ , -CF $_3$ , -CH $_2$ F, -CHF $_2$ , -O-CF $_3$ , -S-CF $_3$ , -SH, -NH-S(=O)- $C_2H_5$ , -C(=O)-OH, -C(=O)-H, -C(=O)- $CH_3$ , -C(=O)- $C_2H_5$ , -C(=O)-NH $_2$ , -C(=O)-N( $CH_3$ ) $_2$ , -C(=O)-NH- $CH_3$ , -NH-C(=O)- $CH_3$ , -NH-C(=O)- $C_2H_5$ , -C(=O)-O- $CH_3$ , -C(=O)-O- $C_2H_5$ , -C(=O)-O-C( $CH_3$ ) $_3$  y fenilo;

20  $R^{10}$ ,  $R^{11}$  y  $R^{12}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I; -CF $_3$ ; -NO $_2$ ; -CN; -C(=O)-OH; -C(=O)-O- $R^{29}$ ; -C(=O)-NH $_2$ ; -O- $R^{42}$ ; -S- $R^{43}$ ; etenilo; etinilo; ciclopropilo o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;

$R^{13}$  representa H; -C(=O)- $R^{28}$ ; -C(=O)-H; -C(=O)-O- $R^{29}$ ; -S(=O)- $R^{33}$ ; -S(=O)- $R^{34}$ ; ciclopropilo; ciclobutilo; o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;

25 y  $R^{28}$ ,  $R^{29}$ ,  $R^{33}$ ,  $R^{34}$ ,  $R^{35}$ ,  $R^{36}$ ,  $R^{37}$ ,  $R^{42}$  y  $R^{43}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo; -CF $_3$ ; -C $_2$ F $_5$ ; -CH $_2$ -CF $_3$ ; o un grupo fenilo, bencilo o fenetilo, que no está sustituido o está sustituido en caso dado con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, -O- $CH_3$ , -O- $C_2H_5$ , -O- $C_3H_7$ ;

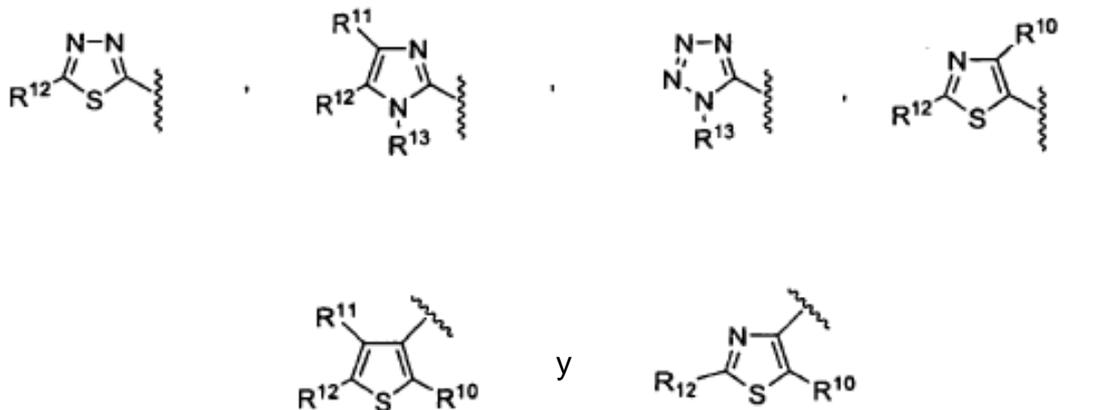
30 en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o

diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

6. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizados porque

a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 1 o 2;

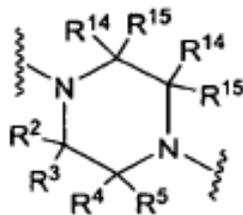
5 A representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



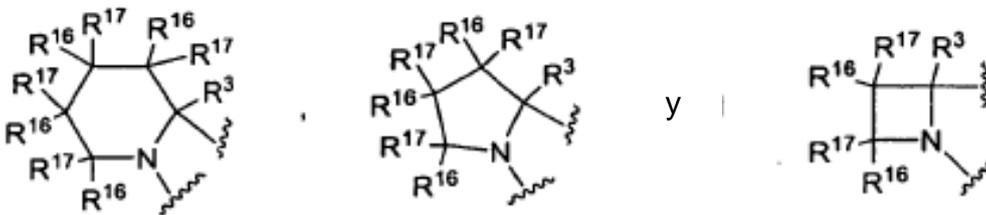
$R^1$  y  $R^8$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H;  $-C(=O)-R^{28}$ ; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo; o un grupo ciclopropilo;

10  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{22}$ ,  $R^{23}$ ,  $R^{24}$  y  $R^{25}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; I;  $-CN$ ;  $-NO_2$ ;  $-CF_3$ ;  $-O-R^{42}$ ; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo; o un grupo ciclopropilo;

o  $R^1$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^4R^5$  que los une, forman el siguiente grupo

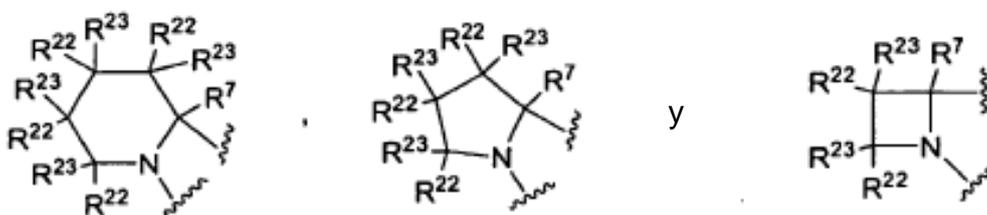


15 o  $R^1$  y  $R^2$ , junto con el grupo  $-N-CR^3$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



y en este caso b representa 1 y c representa 0;

o  $R^6$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^7$  que los une, forman un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



y en este caso b representa 1 y a representa 0;

5  $R^9$  representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en fenilo y tienilo, en cada caso no sustituido o sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, etenilo, etinilo, ciclopropilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub> y -O-CF<sub>3</sub>;

$R^{10}$ ,  $R^{11}$  y  $R^{12}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; -CF<sub>3</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CN; -O-R<sup>42</sup>; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, isobutilo y terc-butilo; etenilo; etinilo o ciclopropilo;

10  $R^{13}$  representa H; -C(=O)-H; -C(=O)-R<sup>28</sup>; ciclopropilo; o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;

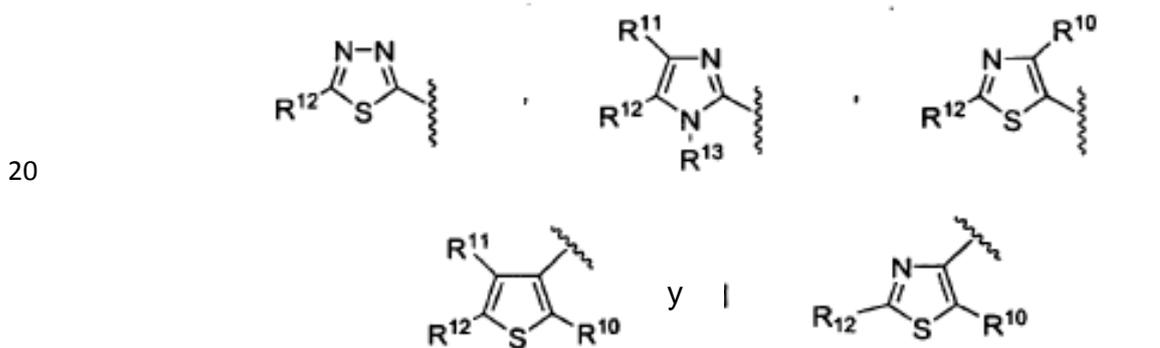
y  $R^{28}$  y  $R^{42}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo; o -CF<sub>3</sub>;

15 en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

7. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizados porque

a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 2;

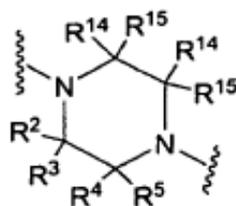
A representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



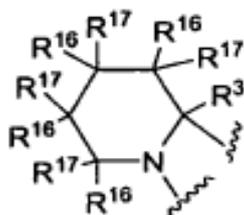
$R^1$  y  $R^8$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H; -C(=O)-CH<sub>3</sub>; metilo, isopropilo o ciclopropilo;

25  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{22}$  y  $R^{23}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo y n-hexilo;

o  $R^1$  y  $R^8$ , junto con el grupo -N-CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>-CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> que los une, forman el siguiente grupo

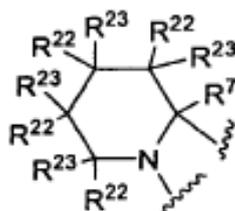


o  $R^1$  y  $R^2$ , junto con el grupo -N-CR<sup>3</sup> que los une, forman el siguiente grupo



y en este caso b representa 1 y c representa 0;

o R<sup>6</sup> y R<sup>8</sup>, junto con el grupo -N-CR<sup>7</sup> que los une, forman el siguiente grupo



5 y en este caso b representa 1 y a representa 0;

R<sup>9</sup> representa un grupo fenilo, en cada caso no sustituido o sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, etenilo, etinilo, ciclopropilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub> y -O-CF<sub>3</sub>;

10 R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> y R<sup>12</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H; F; Cl; Br; -CF<sub>3</sub>; -NO<sub>2</sub>; -CN; -O-CF<sub>3</sub>; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, isobutilo y terc-butilo; etenilo; etinilo o ciclopropilo;

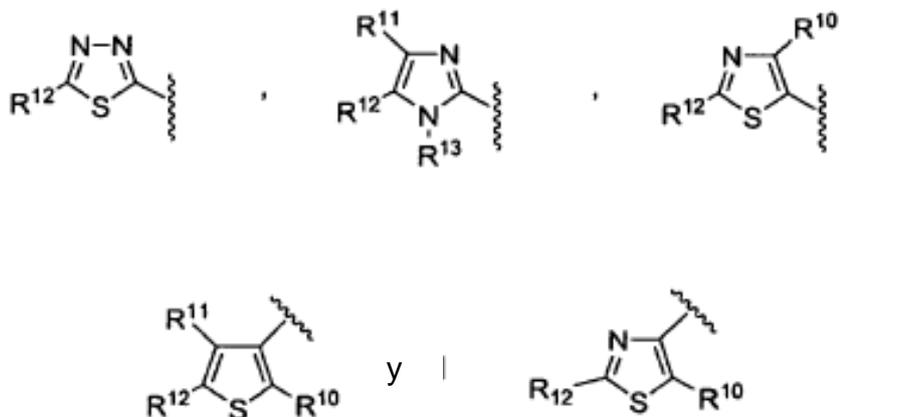
y R<sup>13</sup> representa H o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;

15 en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

8. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizados porque

a, b y c, independientemente entre sí, representan en cada caso 0 o 1, siendo la suma de a, b y c igual a 2;

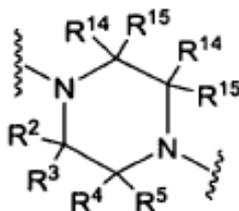
20 A representa un grupo seleccionado de entre el grupo consistente en



R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H, metilo o isopropilo;

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>14</sup> y R<sup>15</sup>, independientemente entre sí, representan en cada caso H o un grupo alquilo seleccionado de entre metilo y etilo;

o  $R^1$  y  $R^8$ , junto con el grupo  $-N-CR^2R^3-CR^4R^5$  que los une, forman el siguiente grupo



$R^9$  representa un grupo fenilo, en cada caso no sustituido o sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I y -CN;

5  $R^{10}$ ,  $R^{11}$  y  $R^{12}$ , independientemente entre sí, representan en cada caso H o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, isobutilo y terc-butilo;

y  $R^{13}$  representa H o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo consistente en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo;

10 en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

9. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 8 seleccionados entre el grupo consistente en

[1] 1-(3-fenilpropilil)-4-(tiofen-3-il)piperazina,

15 [2] 1-(3-fenilpropilil)-4-(tiazol-4-il)piperazina,

[3] 1-(3-fenilpropilil)-4-(1-metilimidazol-2-il)piperazina,

[4] (R)-2-metil-1-(3-(3-clorofenil)propilil)-4-(tiazol-4-il)-piperazina,

[5] 2-metil-1-(3-(3-clorofenil)propilil)-4-(1,3,4-tiadiazol-2-il)-piperazina,

[6] 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(1,3,4-tiadiazol-2-il)amino)etil)propiolamida,

20 [7] 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(tiazol-5-il)amino)etil)propiolamida y

[8] 3-(3-clorofenil)-N-(2-(metil(1-metil-1H-imidazol-2-il)amino)etil)-propiolamida;

25 en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de enantiómeros o diastereoisómeros, en forma de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes, o en cada caso en forma de solvatos correspondientes.

10. Medicamento que contiene al menos un compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 9 y en caso dado una o más sustancias auxiliares farmacéuticamente compatibles.

11. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 9 para el tratamiento y/o la profilaxis del dolor, preferentemente del dolor seleccionado de entre el grupo consistente en dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral; migrañas; depresiones; enfermedades neurodegenerativas, preferentemente seleccionadas de entre el grupo consistente en esclerosis múltiple, enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y enfermedad de Huntington; enfermedades cognitivas, preferentemente estados cognitivos carenciales, de forma especialmente preferente síndrome de atención deficiente (ADS); estados de ansiedad; ataques de pánico; epilepsia; tos; incontinencia urinaria; diarrea; prurito; esquizofrenia; isquemias cerebrales; espasmos musculares; calambres; enfermedades pulmonares, preferentemente seleccionadas de entre el grupo consistente en asma y pseudocrup; regurgitación (vómitos); ataques de apoplejía; discinesia; retinopatía; estados atímicos; laringitis; trastornos alimentarios, preferentemente seleccionados de entre el grupo consistente en bulimia, caquexia, anorexia y obesidad; alcoholismo; dependencia de medicamentos; drogodependencia, preferentemente dependencia de nicotina y/o cocaína; abuso de alcohol; abuso de medicamentos; abuso de drogas, preferentemente abuso de nicotina y/o cocaína; síndromes de abstinencia en caso de dependencia de alcohol, medicamentos y/o drogas (en particular nicotina y/o cocaína); desarrollo de tolerancia a medicamentos, en particular a opioides naturales o sintéticos; síndrome de reflujo gastroesofágico; enfermedad de reflujo gastroesofágico; síndrome del intestino irritable; para la diuresis; para la antinatriuresis; para influir en el sistema cardiovascular; para aumentar la vigilancia; para aumentar la libido; para modular la actividad motora o como anestésico local.

30

35

40

5  
10  
12. Compuestos según la reivindicación 11 para el tratamiento y/o la profilaxis del dolor, preferentemente del dolor seleccionado de entre el grupo consistente en dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral; estados de ansiedad; ataques de pánico; alcoholismo; dependencia de medicamentos; enfermedades cognitivas, preferentemente estados cognitivos carenciales, de forma especialmente preferente síndrome de atención deficiente (ADS); trastornos alimentarios, preferentemente seleccionados de entre el grupo consistente en bulimia, caquexia, anorexia y obesidad; drogodependencia, preferentemente dependencia de nicotina y/o cocaína; abuso de alcohol; abuso de medicamentos; abuso de drogas, preferentemente abuso de nicotina y/o cocaína; síndromes de abstinencia en caso de dependencia de alcohol, medicamentos y/o drogas (en particular nicotina y/o cocaína); desarrollo de tolerancia a medicamentos y/o drogas, en particular a opioides naturales o sintéticos; síndrome de reflujo gastroesofágico; enfermedad de reflujo gastroesofágico y síndrome del intestino irritable.

13. Compuestos según la reivindicación 11 o 12 para el tratamiento del dolor, preferentemente del dolor seleccionado de entre el grupo consistente en dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral.

14. Compuestos según la reivindicación 11 o 12 para el tratamiento de estados de ansiedad o ataques de pánico.