

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 375 817**

51 Int. Cl.:

**C07D 295/145** (2006.01) **C07D 271/12** (2006.01)

**C07D 295/096** (2006.01)

**C07D 207/50** (2006.01)

**C07D 207/335** (2006.01)

**C07D 213/74** (2006.01)

**C07D 231/12** (2006.01)

**C07D 237/14** (2006.01)

**A61K 31/495** (2006.01)

**A61K 31/496** (2006.01)

**A61P 25/24** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **05824122 .5**

96 Fecha de presentación: **29.12.2005**

97 Número de publicación de la solicitud: **1851210**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **07.11.2007**

54 Título: **COMPUESTOS DE FENILPIPERAZINA NITRO-SUSTITUIDOS, SU PREPARACIÓN Y USO EN MEDICAMENTOS.**

30 Prioridad:  
**30.12.2004 EP 04380288**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**06.03.2012**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**06.03.2012**

73 Titular/es:  
**LABORATORIOS DEL DR. ESTEVE, S.A.  
AV. MARE DE DÉU DE MONTSERRAT, 221  
08041 BARCELONA, ES**

72 Inventor/es:  
**ASCHEBRENNER, Andrea;  
KRAUS, Jürgen;  
TASLER, Stefan;  
WUZIK, Andreas y  
QUINTANA-RUIZ, Jordi-Ramon**

74 Agente: **Arias Sanz, Juan**

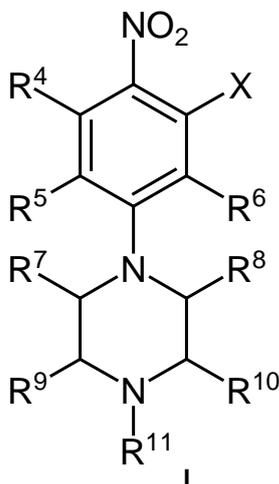
ES 2 375 817 T3

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

## DESCRIPCIÓN

Compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos, su preparación y uso en medicamentos.

5 La presente invención se refiere a compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula general I,



10 un procedimiento para su preparación, medicamentos que comprenden dichos compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos, así como el uso de dichos compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos para la preparación de medicamentos, que son particularmente adecuados para la profilaxis y/o tratamiento de trastornos o enfermedades que están mediadas al menos parcialmente a través de receptores 5-HT<sub>6</sub>.

15 La superfamilia de los receptores de serotonina (5-HT) incluye 7 clases (5-HT<sub>1</sub>-5-HT<sub>7</sub>) que engloban 14 subclases humanas [D. Hoyer, et al., *Neuropharmacology*, 1997, 36, 419]. El receptor 5-HT<sub>6</sub> es el último receptor de serotonina identificado por clonación molecular tanto en ratas [F.J. Monsma et al., *Mol. Pharmacol.*, 1993, 43, 320; M. Ruat et al., *Biochem. Biophys. Res. Commun.*, 1993, 193, 268] como en humanos [R. Kohen, et al., *J. Neurochem.*, 1996, 66, 47].

20 Los compuestos con afinidad por el receptor 5-HT<sub>6</sub> son útiles para el tratamiento de diversos trastornos del Sistema Nervioso Central y del tracto gastrointestinal, tales como síndrome del intestino irritable. Los compuestos con afinidad por el receptor 5-HT<sub>6</sub> son útiles también en el tratamiento de la ansiedad, depresión y trastornos de memoria cognitiva [M. Yoshioka et al., *Ann. NY Acad. Sci.*, 1998, 861, 244; A. Bourson et al., *Br. J. Pharmacol.*, 1998, 125, 1562; D.C. Rogers et al., *Br. J. Pharmacol. Suppl.*, 1999, 127, 22P; A. Bourson et al., *J. Pharmacol. Exp. Ther.*, 1995, 274, 173; A.J. Sleight, et al., *Behav. Brain Res.*, 1996, 73, 245; T.A. Branchek et al., *Annu. Rev. Pharmacol. Toxicol.*, 2000, 40, 319; C. Routledge et al., *Br. J. Pharmacol.*, 2000, 130, 1606]. Se ha demostrado que los fármacos antipsicóticos típicos y atípicos para tratar la esquizofrenia tienen una alta afinidad por los receptores 5-HT<sub>6</sub> [B.L. Roth et al., *J. Pharmacol. Exp. Ther.*, 1994, 268, 1403; C.E. Glatt et al., *Mol. Med.*, 1995, 1, 398; F.J. Mosma, et al., *Mol. Pharmacol.*, 1993, 43, 320; T. Shinkai et al., *Am. J. Med. Genet.*, 1999, 88, 120]. Los compuestos con afinidad por el receptor 5-HT<sub>6</sub> son útiles para tratar la hiperkinesia infantil (ADHD, trastorno por déficit de atención / hiperactividad) [W.D. Hirst et al., *Br. J. Pharmacol.*, 2000, 130, 1597; C. Gérard et al., *Brain Research*, 1997, 746, 207; M.R. Pranzatelli, *Drugs of Today*, 1997, 33, 379].

35 Se ha demostrado recientemente que el receptor 5-HT<sub>6</sub> desempeña también un papel importante en la ingestión de alimentos [*Neuropharmacology*, 41, 2001, 210-219].

40 Los trastornos de ingestión de alimentos, particularmente la obesidad, son una grave amenaza que crece rápidamente para la salud de los seres humanos de todos los grupos de edad, puesto que incrementan el riesgo de desarrollar otras enfermedades graves, incluso potencialmente mortales, tales como diabetes así como también enfermedades coronarias.

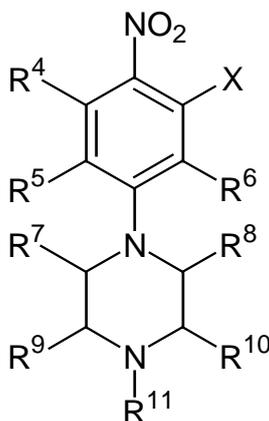
45 Por lo tanto, un objeto de la presente invención era proporcionar compuestos que son particularmente adecuados como principios activos en medicamentos, especialmente en medicamentos para la profilaxis y/o tratamiento de trastornos o enfermedades relacionadas con los receptores 5-HT<sub>6</sub>, tales como los trastornos relacionados con la ingestión de alimentos.

De manera sorprendente, se ha encontrado que los compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula

general I, la e Ib facilitados a continuación muestran una afinidad de buena a excelente por los receptores 5-HT<sub>6</sub>. Estos compuestos son, por lo tanto, particularmente adecuados como principios farmacológicamente activos en un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento de trastornos o enfermedades relacionadas con los receptores 5-HT<sub>6</sub>, tales como los trastornos relacionados con la ingestión de alimentos, como la obesidad.

5

Por lo tanto, en un aspecto la presente invención se refiere a compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula general I,



10

I

en la que

X representa un resto  $-NR^1R^2$  o un resto  $-OR^3$ ;

15

R<sup>1</sup> representa un radical cicloalifático de 3 a 9 miembros saturado o insaturado, que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, fenilo -S(=O)<sub>2</sub>-, fenilo, fenoxilo y bencilo y que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo y que está unido a través de un grupo lineal o ramificado alquileno C<sub>1-6</sub>, alquenileno C<sub>2-6</sub> o alquilileno C<sub>2-6</sub> que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;

20

25

un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

30

35

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)-$  y puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

40

45

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un

50

- 5 grupo  $-(CH_2)_2-$  y/o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;
- 10 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)_3$  y/o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;
- 15 o
- 20 un resto  $-C(=O)-R^{12}$ ;
- 25 R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y  $-N(alquilo C_{1-5})_2$ ; o
- 30 R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el nitrógeno puente un anillo heterocíclico de 3 a 6 miembros, saturado o insaturado, pero no aromático, que contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) adicional(es) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno y azufre como miembro(s) del anillo y que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, oxo (=O), tioxo (=S), -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;
- 35 R<sup>3</sup> representa un radical de 5 a 10 miembros de arilo o heteroarilo, que puede estar no sustituido o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que puede estar unido a través de un grupo lineal o ramificado alquilenilo C<sub>1-6</sub>, alquenileno C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y  $-N(alquilo C_{1-5})_2$  y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;
- 40
- 45 R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;
- 50 R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y  $-N(alquilo C_{1-5})_2$ ;
- 55 R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y  $-N(alquilo C_{1-5})_2$ ;
- 60 R<sup>11</sup> representa un radical alifático C<sub>1-10</sub> grupo lineal o ramificado, saturado o insaturado, no sustituido o un radical de 5 a 10 miembros de arilo o heteroarilo que puede estar no sustituido o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;
- 65

y

5  $R^{12}$  representa un radical arilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -C(=O)-N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo  $C_{1-5}$ , -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

10 un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo que puede estar no sustituido o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -C(=O)-N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo  $C_{1-5}$ , -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

20 o

25 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, que puede estar no sustituido o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -C(=O)-N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo  $C_{1-5}$ , -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que está unido a través de un grupo  $-(CH_2)_{1,2 \text{ o } 3}$ ;

35 opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

Preferiblemente, el compuesto bencil-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina puede excluirse en cualquiera de las definiciones dadas en el presente documento.

40 Se prefieren compuestos de fórmula general I anteriormente facilitados, en la que  $R^1$  representa

45 un radical (hetero)cicloalifático seleccionado del grupo que consiste en ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclopentenilo, ciclohexilo, ciclohexenilo, cicloheptilo, cicloheptenilo, ciclooctilo, ciclooctenilo, ciclononilo, imidazolidinilo, aziridinilo, azetidino, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, piperazinilo, pirazolidinilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidrotiofenilo y azepanilo, en los que dicho radical (hetero)cicloalifático puede unirse a través de un grupo  $-(CH_2)_{1,2 \text{ o } 3}$  y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>,

55 un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>,

5 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)-$  y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-O-C(CH_3)_3$ ,  $-S-CH_3$ ,  $-S-C_2H_5$ ,  $-S-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-S-CH(CH_3)_2$ ,  $-S-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-C(CH_3)_3$ , F, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NH-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-NH-CH(CH_3)_2$ ,  $-NH-C(CH_3)_3$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH-CH_3$ ,  $-C(=O)-NH-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-N(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-N(C_2H_5)_2$  y  $-S(=O)_2-CH_3$ ,

15 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)_2-$  y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-O-C(CH_3)_3$ ,  $-S-CH_3$ ,  $-S-C_2H_5$ ,  $-S-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-S-CH(CH_3)_2$ ,  $-S-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-C(CH_3)_3$ , F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NH-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-NH-CH(CH_3)_2$ ,  $-NH-C(CH_3)_3$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH-CH_3$ ,  $-C(=O)-NH-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-N(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-N(C_2H_5)_2$  y  $-S(=O)_2-CH_3$ ,

25 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)_3-$  y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-O-C(CH_3)_3$ ,  $-S-CH_3$ ,  $-S-C_2H_5$ ,  $-S-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-S-CH(CH_3)_2$ ,  $-S-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-C(CH_3)_3$ , F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NH-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-NH-CH(CH_3)_2$ ,  $-NH-C(CH_3)_3$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH-CH_3$ ,  $-C(=O)-NH-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-N(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-N(C_2H_5)_2$  y  $-S(=O)_2-CH_3$ ,

o

40 un resto  $-C(=O)-R^{12}$ ;  
preferiblemente,  $R^1$  representa un radical pirrolilo no sustituido;

45 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y pirrolilo, en los que dicho radical fenilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)-$  y dicho radical pirrolilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)_2-$  y/o dicho radical fenilo o pirrolilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-O-C(CH_3)_3$ ,  $-S-CH_3$ ,  $-S-C_2H_5$ ,  $-S-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-S-CH(CH_3)_2$ ,  $-S-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-C(CH_3)_3$ , F, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NH-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-NH-CH(CH_3)_2$ ,  $-NH-C(CH_3)_3$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH-CH_3$ ,  $-C(=O)-NH-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-N(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-N(C_2H_5)_2$  y  $-S(=O)_2-CH_3$  o

50 un  $-C(=O)-R^{12}$  resto;  
55 más preferiblemente,  $R^1$  representa un radical pirrolilo no sustituido;

60 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y pirrolilo, en los que dicho radical fenilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)-$  y dicho radical pirrolilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)_2-$  y/o dicho radical fenilo o pirrolilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, F, Br y I o

un  $-C(=O)-R^{12}$  resto;

65 y X y  $R^2$  a  $R^{12}$  tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos

estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

Además, se prefieren tales compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula general, en la que

$R^2$  representa un átomo de hidrógeno o un radical lineal o ramificado, no sustituido alquilo  $C_{1-10}$ ;

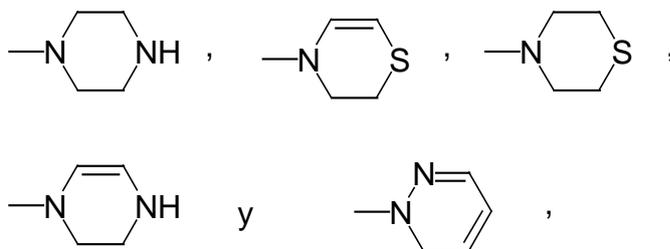
preferiblemente,  $R^2$  representa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

más preferiblemente,  $R^2$  representa un átomo de hidrógeno o un radical metilo;

y X,  $R^1$  y  $R^3$  a  $R^{12}$  tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren tales compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula general I, en la que

$R^1$  y  $R^2$  junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en



en los que cada uno de esos restos cíclicos antes mencionados puede estar sustituido en cualquier posición incluyendo los grupos -NH con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

preferiblemente,  $R^1$  y  $R^2$  junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto piridazin-3-ona que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, fenilo, fenoxilo y bencilo;

más preferiblemente,  $R^1$  y  $R^2$  junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto piridazin-3-ona no sustituido;

y X y  $R^3$  a  $R^{12}$  tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

Además, se prefieren tales compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula general I anteriormente facilitados, en la que

$R^3$  representa un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirroliolo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar unido a través de un grupo  $-(CH_2)_{1, 2 \text{ o } 3}$  y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-

C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

5

preferiblemente, R<sup>3</sup> representa un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

10

15 más preferiblemente, R<sup>3</sup> representa un radical fenilo no sustituido;

y X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>4</sup> a R<sup>12</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

20

También, se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos de fórmula general I, en la que

R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido;

25

preferiblemente, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

30 más preferiblemente, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

y X, R<sup>1</sup> a R<sup>6</sup> y R<sup>9</sup> a R<sup>12</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

35

También, se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos de fórmula general I, en la que R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido;

40

preferiblemente, R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

45 más preferiblemente, R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

45

y X, R<sup>1</sup> a R<sup>8</sup> y R<sup>11</sup> y R<sup>12</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

50

También, se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos de fórmula general I, en la que

R<sup>11</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo; o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, piridinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotriazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

60

65

preferiblemente, R<sup>11</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo y n-butilo; o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y piridinilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

más preferiblemente, R<sup>11</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo y n-butilo; o un radical fenilo o piridinilo no sustituido;

y X, R<sup>1</sup> a R<sup>10</sup> y R<sup>12</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos de fórmula general I, en la que

R<sup>12</sup> representa un radical arilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

o

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1, 2 o 3</sub>- y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

preferiblemente, R<sup>12</sup> representa un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

más preferiblemente, R<sup>12</sup> representa un radical fenilo no sustituido;

y X y R<sup>1</sup> a R<sup>11</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos

estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula general I, en la que

5  $R^1$  representa un radical pirrolilo no sustituido; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y pirrolilo, en los que dicho radical fenilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)-$  y dicho radical pirrolilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)_2-$  y/o dicho radical fenilo o pirrolilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-O-C(CH_3)_3$ ,  $-S-CH_3$ ,  $-S-C_2H_5$ ,  $-S-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-S-CH(CH_3)_2$ ,  $-S-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-C(CH_3)_3$ , F, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NH-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-NH-CH(CH_3)_2$ ,  $-NH-C(CH_3)_3$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH-CH_3$ ,  $-C(=O)-NH-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-N(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-N(C_2H_5)_2$  y  $-S(=O)_2-CH_3$  o un resto  $-C(=O)-R^{12}$ ;

$R^2$  representa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

20 o

$R^1$  y  $R^2$  junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto piridazin-3-ona que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ , F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ , fenilo, fenoxilo y bencilo;

30  $R^3$  representa un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-O-C(CH_3)_3$ ,  $-S-CH_3$ ,  $-S-C_2H_5$ ,  $-S-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-S-CH(CH_3)_2$ ,  $-S-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-C(CH_3)_3$ , F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NH-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-NH-CH(CH_3)_2$ ,  $-NH-C(CH_3)_3$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH-CH_3$ ,  $-C(=O)-NH-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-N(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-N(C_2H_5)_2$  y  $-S(=O)_2-CH_3$ ;

35  $R^4$ ,  $R^5$  y  $R^6$  representa cada uno un átomo de hidrógeno;

40  $R^7$  y  $R^8$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

$R^9$  y  $R^{10}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

45  $R^{11}$  representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo y n-butilo; o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y piridinilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-C_2H_5$ , F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NH-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-NH-CH(CH_3)_2$ ,  $-NH-C(CH_3)_3$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH-CH_3$ ,  $-C(=O)-NH-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-N(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-N(C_2H_5)_2$  y  $-S(=O)_2-CH_3$ ;

y

55  $R^{12}$  representa un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo,  $-O-CH_3$ ,  $-O-C_2H_5$ ,  $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-O-C(CH_3)_3$ ,  $-S-CH_3$ ,  $-S-C_2H_5$ ,  $-S-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-S-CH(CH_3)_2$ ,  $-S-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)-O-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-O-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-O-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ ,  $-C(=O)-CH_3$ ,  $-C(=O)-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-C(=O)-CH(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-C(CH_3)_3$ , F, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH-CH_3$ ,  $-NH-C_2H_5$ ,  $-NH-CH_2-CH_2-CH_3$ ,  $-NH-CH(CH_3)_2$ ,  $-NH-C(CH_3)_3$ ,  $-N(CH_3)_2$ ,  $-N(C_2H_5)_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH-CH_3$ ,  $-C(=O)-NH-C_2H_5$ ,  $-C(=O)-N(CH_3)_2$ ,  $-C(=O)-N(C_2H_5)_2$  y  $-S(=O)_2-CH_3$ .

65 opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o

diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

Particularmente se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula general I, en la que

R<sup>1</sup> representa un radical pirrolilo no sustituido; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y pirrolilo, en los que dicho radical fenilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)-$  y dicho radical pirrolilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)_2-$  y/o dicho radical fenilo o pirrolilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, F, Br y I o un resto  $-C(=O)-R^{12}$ ;

R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical metilo;

o

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto no sustituido piridazin-3-ona;

R<sup>3</sup> representa un radical fenilo no sustituido;

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

R<sup>11</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo y n-butilo; o un radical fenilo o piridinilo no sustituido

y

R<sup>12</sup> representa un radical fenilo no sustituido;

opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

Particularmente se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos seleccionado del grupo que consiste en

[1] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-pirrol-1-il-etil)-amina,

[2] (4-Fluoro-bencil)-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,

[3] N-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-benzamida,

[4] N-Metil-N-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-benzamida,

[5] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-pirrol-1-il-amina,

[6] 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-2H-piridazin-3-ona,

[7] 1-Metil-4-(4-nitro-3-fenoxi-fenil)-piperazina,

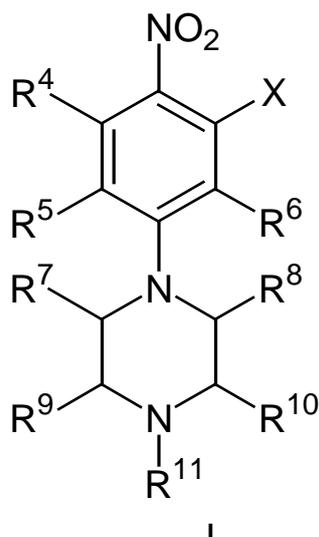
[8] Bencil-[5-(4-butyl-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,

[9] Bencil-[2-nitro-5-(4-piridin-2-il-piperazin-1-il)-fenil]-amina y

[10] Bencil-[2-nitro-5-(4-fenil-2-il-piperazin-1-il)-fenil]-amina;

opcionalmente en forma de una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

En todavía otro aspecto, la presente invención se refiere a compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula general I,



en la que

5 X representa un resto  $-NR^1R^2$  o un resto  $-OR^3$ ;

10  $R^1$  representa un radical cicloalifático, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido de 3 a 9 miembros, que está unido a través de un grupo alquileo  $C_{1-6}$ , alquilenilo  $C_{2-6}$  o alquinileno  $C_{2-6}$  lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido y/o que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

15 un radical heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo;

20 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)-$  y/o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)$ - $O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O$ - $C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ , F, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)$ - $NH_2$ ,  $-C(=O)$ - $NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-C(=O)$ - $N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-S(=O)_2$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S(=O)_2$ -fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

30 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)_2-$  y/o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)$ - $OH$ ,  $-C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)$ - $O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O$ - $C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)$ - $NH_2$ ,  $-C(=O)$ - $NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-C(=O)$ - $N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-S(=O)_2$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S(=O)_2$ -fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

40 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)_3-$  y/o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)$ - $OH$ ,  $-C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)$ - $O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O$ - $C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)$ - $NH_2$ ,  $-C(=O)$ - $NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-C(=O)$ - $N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-S(=O)_2$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S(=O)_2$ -fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

o

un  $-C(=O)-R^{12}$  resto;

5  $R^2$  representa un átomo de hidrógeno o un radical alifático  $C_{1-10}$  lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido;

10  $R^1$  y  $R^2$  junto con el nitrógeno puente forman un anillo heterocíclico opcionalmente al menos monosustituido, saturado o insaturado, pero no aromático de 3 a 9 miembros que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) adicional(es) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno y azufre como miembro(s) del anillo;

15  $R^3$  representa un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido de 5 a 10 miembros, que puede estar unido a través de un grupo alquileo  $C_{1-6}$ , alquenileno  $C_{2-6}$  o alquinileno  $C_{2-6}$  lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

20  $R^4$ ,  $R^5$  y  $R^6$  representa cada uno un átomo de hidrógeno;

$R^7$  y  $R^8$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático  $C_{1-10}$  lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido;

25  $R^9$  y  $R^{10}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático  $C_{1-10}$  lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido;

30  $R^{11}$  representa un radical alifático  $C_{1-10}$  lineal o ramificado, saturado o insaturado, no sustituido o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido de 5 a 10 miembros en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

y

35  $R^{12}$  representa un radical arilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)-alquilo C_{1-5}$ ,  $-C(=O)-O-alquilo C_{1-5}$ ,  $-O-C(=O)-alquilo C_{1-5}$ , F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH(alquilo C_{1-5})$ ,  $-C(=O)-N(alquilo C_{1-5})_2$ ,  $-S(=O)_2-alquilo C_{1-5}$ ,  $-S(=O)_2-fenilo$ , fenilo, fenoxilo y bencilo;

40 un radical heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo;

45 o

50 un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)_{1,2 \text{ o } 3}$ ;

con la condición de que puede excluirse preferiblemente, el compuesto siguiente

55 (1) Bencil-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina;

60 opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

65 Si cualquiera de los sustituyentes representa o comprende un radical (hetero)cicloalifático [grupo (hetero)cicloalifático], dicho radical (hetero)cicloalifático puede, a menos que se defina de otra forma, estar no sustituido o sustituido por uno o más sustituyentes, preferiblemente, no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s). Dicho(s) sustituyente(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)-alquilo C_{1-5}$ ,  $-C(=O)-$

O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que en cada caso alquilo C<sub>1-5</sub> puede ser lineal o ramificado y en los que dichos sustituyentes cíclicos pueden estar no sustituidos o sustituidos por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>.

Más preferiblemente, dichos sustituyentes pueden seleccionarse independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que en cada caso dichos sustituyentes cíclicos pueden estar no sustituidos o sustituidos por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>.

Si cualquiera de los sustituyentes representa o comprende un radical cicloalifático, que contiene uno o más, preferiblemente, 1, 2 o 3 heteroátomo(s) como miembro(s) del anillo, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos heteroátomo(s) puede preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en N, O y S.

Radicales (hetero)cicloalifáticos adecuados, que pueden estar no sustituidos o al menos monosustituidos, incluyen ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclopentenilo, ciclohexilo, ciclohexenilo, cicloheptilo, cicloheptenilo, ciclooctilo, ciclooctenilo, ciclononilo, imidazolidinilo, aziridinilo, azetidino, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, piperazinilo, pirazolidinilo, tetrahidrofurano, tetrahidrotiofenilo y azepanilo.

Si cualquiera de los sustituyentes representa o comprende un radical arilo (grupo arilo), incluyendo un grupo fenilo o naftilo, dicho radical arilo puede, a menos que se defina de otra forma, estar no sustituido o sustituido por uno o más sustituyentes, preferiblemente, no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s). Dicho(s) sustituyente(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que en cada caso alquilo C<sub>1-5</sub> puede ser lineal o ramificado y en los que dicho(s) sustituyente(s) cíclico(s) puede(n) estar no sustituido(s) o sustituido(s) por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>.

Más preferiblemente, dichos sustituyentes pueden seleccionarse independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>.

Los radicales arilo preferidos, que puede ser opcionalmente al menos monosustituidos, son fenilo y naftilo.

Si cualquiera de los sustituyentes representa o comprende un radical heteroarilo (grupo heteroarilo), dicho radical heteroarilo puede, a menos que se defina de otra forma, estar no sustituido o sustituido por uno o más sustituyentes, preferiblemente, no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s). Dicho(s) sustituyente(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que en cada caso alquilo C<sub>1-5</sub> puede ser lineal o ramificado y en los que dicho(s) sustituyente(s) cíclico(s) puede(n) estar no sustituido(s) o sustituido(s) por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>.

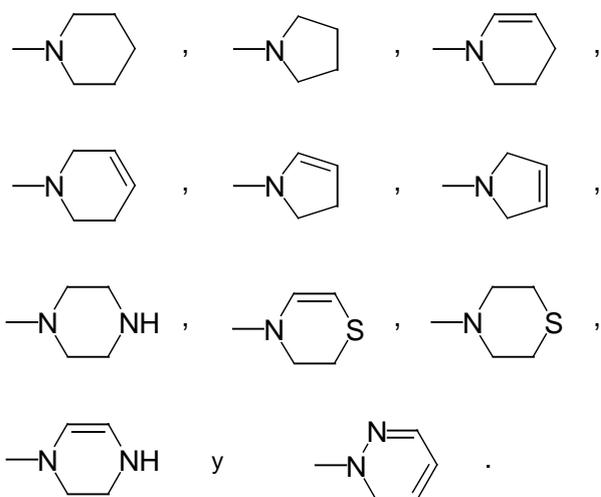
Más preferiblemente, dichos sustituyentes pueden seleccionarse independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-

CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>.

5 El (los) heteroátomo(s), que está(n) presente(s) como miembro(s) del anillo en el radical heteroarilo, puede(n), a menos que se defina de otra forma, seleccionarse independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre. Preferiblemente, el radical heteroarilo comprende 1, 2 o 3 heteroátomo(s).

10 Los radicales heteroarilo adecuados, que pueden ser opcionalmente al menos monosustituídos, pueden seleccionarse preferiblemente, del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo, benzoxadiazolilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, bencisoxazolilo, bencisotiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo.

15 Si al menos dos de los sustituyentes junto con el átomo de nitrógeno puente forman un anillo heterocíclico saturado o insaturado, dicho anillo heterocíclico puede preferiblemente seleccionarse del grupo que consiste en



Aquellos expertos en la técnica comprenderán que los restos cíclicos antes mencionados, que contienen un grupo NH también pueden estar sustituidos en esta posición, es decir, el átomo de hidrógeno puede cambiarse por otro sustituyente.

20 Dichos anillos heterocíclicos pueden, a menos que se defina de otra forma, estar no sustituidos o sustituidos por uno o más sustituyentes, preferiblemente, no sustituidos o sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s). Dicho(s) sustituyente(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, oxo (=O), tioxo (=S), -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que en cada caso alquilo C<sub>1-5</sub> puede ser lineal o ramificado y en los que dicho(s) sustituyente(s) cíclico(s) puede(n) estar no sustituido(s) o sustituido(s) por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>.

35 Más preferiblemente, dichos sustituyentes pueden seleccionarse independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que dicho(s) sustituyente(s) cíclico(s) puede(n) estar no sustituido(s) o sustituido(s) por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>.

45 Si cualquiera de los sustituyentes representa un radical alifático saturado o insaturado (grupo alifático), es decir, un radical alquilo, un radical alquenilo o un radical alquinilo, dicho radical alifático puede, a menos que se defina de otra forma, estar no sustituido o sustituido por uno o más sustituyentes, preferiblemente, no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s). Dicho(s) sustituyente(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse independientemente del

grupo que consiste en -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, en los que en cada caso alquilo C<sub>1-5</sub> puede ser lineal o ramificado. Más preferiblemente, Dicho(s) sustituyente(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>.

Un radical alqueno comprende al menos un doble enlace carbono-carbono, un radical alquino comprende al menos un triple enlace carbono-carbono.

Los radicales alquilo adecuados, que pueden estar sustituidos por uno o más sustituyentes, pueden preferiblemente seleccionarse del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo y n-decilo.

Los radicales alqueno adecuados, que pueden estar sustituidos por uno o más sustituyentes, pueden preferiblemente seleccionarse del grupo que consiste en vinilo, 1-propeno, 2-propeno, 1-buteno, 2-buteno y 3-buteno.

Los radicales alquino adecuados, que pueden estar sustituidos por uno o más sustituyentes, pueden preferiblemente seleccionarse del grupo que consiste en etino, 1-propino, 2-propino, 1-butino, 2-butino y 3-butino.

Se prefieren compuestos de fórmula general I anteriormente facilitados, en la que R<sup>1</sup> representa un radical (hetero)cicloalifático seleccionado del grupo que consiste en ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclopentenilo, ciclohexilo, ciclohexenilo, cicloheptilo, cicloheptenilo, ciclooctilo, ciclooctenilo, ciclonoililo, imidazolidinilo, aziridinilo, azetidino, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, piperazinilo, pirazolidinilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidrotiofenilo y azepanilo, en los que dicho radical (hetero)cicloalifático puede unirse a través de un grupo alqueno C<sub>1-6</sub>, alqueno C<sub>2-6</sub> o alquino C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en el que dicho radical heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> y/o puede estar sustituido



C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>,

5 o

un resto -C(=O)-R<sup>12</sup>;

10 más preferiblemente, R<sup>1</sup> representa un radical pirrolilo no sustituido; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y pirrolilo, en los que dicho fenilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)- y dicho radical pirrolilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1 o 2</sub>- y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> o un resto -C(=O)-R<sup>12</sup>

20 y X y R<sup>2</sup> a R<sup>12</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

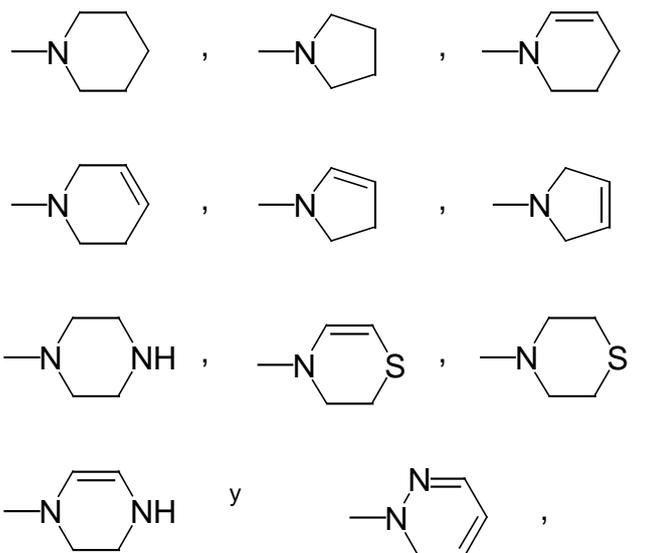
25 Además, se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos tales de fórmula general I, en la que R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido;

30 preferiblemente, R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

más preferiblemente, R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical metilo;

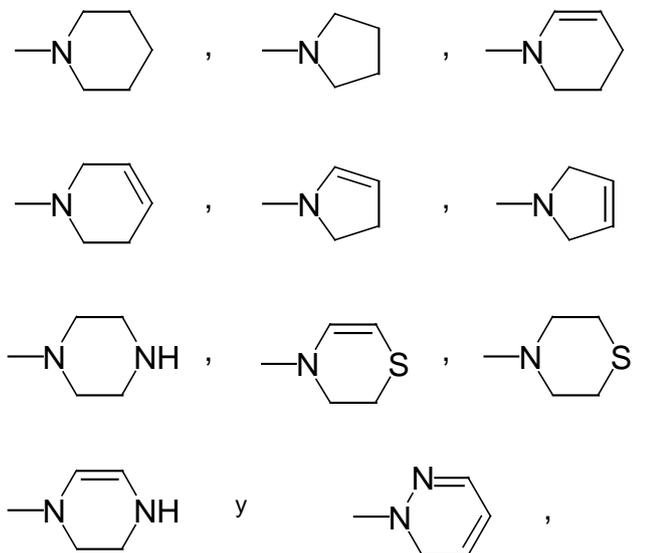
35 y X, R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> a R<sup>12</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos tales de fórmula general I, en la que R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno puenen formar un resto seleccionado del grupo que consiste en



40 en los que cada uno de esos restos cíclicos antes mencionados pueden estar sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, oxo (=O), tioxo (=S), -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

preferiblemente, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en



5 en los que cada uno de esos restos cíclicos antes mencionados pueden estar sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

más preferiblemente, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto piridazin-3-ona;

15 y X y R<sup>3</sup> a R<sup>12</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

20 Además, se prefieren tales compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos de fórmula general I anteriormente facilitados, en la que R<sup>3</sup> representa un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1, 2 o 3</sub>- y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

30 preferiblemente, R<sup>3</sup> representa un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1, 2 o 3</sub>- y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>,

más preferiblemente, R<sup>3</sup> representa un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

y X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>4</sup> a R<sup>12</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos de fórmula general I, en la que R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido;

preferiblemente, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

más preferiblemente, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

y X, R<sup>1</sup> a R<sup>6</sup> y R<sup>9</sup> a R<sup>12</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos de fórmula general I, en la que R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido;

preferiblemente, R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

más preferiblemente, R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

y X, R<sup>1</sup> a R<sup>8</sup> y R<sup>11</sup> y R<sup>12</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos de fórmula general I, en la que R<sup>11</sup> representa un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido; o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

preferiblemente, R<sup>11</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo; o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo pueden estar sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

más preferiblemente, R<sup>11</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo y n-butilo; o un radical fenilo o piridinilo no sustituido;

y X, R<sup>1</sup> a R<sup>10</sup> y R<sup>12</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula general I, en la que R<sup>12</sup> representa un radical arilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en, en los que dicho radical arilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

un radical heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

o

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2,3</sub>- y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

preferiblemente, R<sup>12</sup> representa un radical arilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

un radical heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

o

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2,3</sub>- y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-

5 CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

10 más preferiblemente, R<sup>12</sup> representa un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

15 y X y R<sup>1</sup> a R<sup>11</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

20 También, se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos de fórmula general I, en la que

X representa un resto -NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> o un resto -OR<sup>3</sup>;

25 R<sup>1</sup> representa un radical pirrolilo no sustituido; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y pirrolilo, en los que dicho radical fenilo se une a través de un grupo (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> y dicho radical pirrolilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1 o 2</sub> y puede estar sustituido con 1 átomo de flúor; o un resto -C(=O)-R<sup>12</sup>;

30 R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical metilo;

o

35 R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto piridazin-3-ona;

R<sup>3</sup> representa un radical fenilo no sustituido;

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

40 R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

45 R<sup>11</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo y n-butilo; o un radical fenilo o piridinilo no sustituido y

R<sup>12</sup> representa un radical fenilo no sustituido;

50 opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

55 Particularmente, se prefieren compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos seleccionados del grupo que consiste en

[1] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-pirrol-1-il-etil)-amina,

60 [2] (4-Fluoro-bencil)-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,

[3] N-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-benzamida,

[4] N-Metil-N-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-benzamida,

65 [5] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-pirrol-1-il-amina,

[6] 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-2H-piridazin-3-ona,

[7] 1-Metil-4-(4-nitro-3-fenoxi-fenil)-piperazina,

5 [8] Bencil-[5-(4-butyl-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,

[9] Bencil-[2-nitro-5-(4-piridin-2-il-piperazin-1-il)-fenil]-amina y

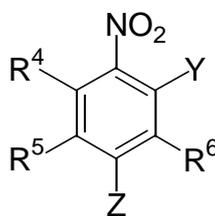
[10] Bencil-[2-nitro-5-(4-fenil-2-il-piperazin-1-il)-fenil]-amina;

10

opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

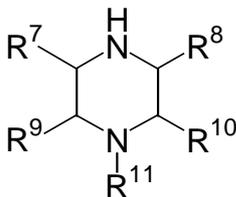
15

Otro aspecto de la presente invención se refiere a un procedimiento para la preparación de un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general I, en la que X representa  $-NR^1R^2$ , en la que al menos un compuesto de nitrobenzeno de fórmula general II,



II

en la que  $R^4$  a  $R^6$  tiene cualquiera de los significados facilitados anteriormente, Y representa un átomo de cloro, y Z representa un átomo de bromo o yodo; se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general III,

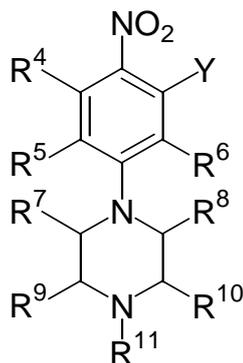


III

20

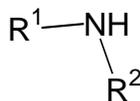
en la que  $R^7$  a  $R^{11}$  tienen cualquiera de los significados facilitados anteriormente, en un medio de reacción adecuado, preferiblemente en al menos un disolvente orgánico, más preferiblemente en al menos un disolvente orgánico seleccionado del grupo que consiste en tetrahidrofurano, tolueno y dioxano, preferiblemente en presencia de al menos un catalizador, más preferiblemente en presencia de al menos una fuente de paladio, incluso más preferiblemente en presencia de  $PdCl_2(dppf)$  en la que dppf es 1,1-bis(difenilfosfino)-ferroceno, y/o al menos un agente auxiliar, preferiblemente 1,1-bis(difenilfosfino)-ferroceno, y/o al menos una base, preferiblemente *terc*-pentóxido de sodio, para dar un compuesto de fórmula general IV,

25



IV

en la que  $R^4$  a  $R^{11}$  tiene cualquiera de los significados facilitados anteriormente e Y representa un átomo de cloro; que se purifica y/o aísla opcionalmente, y el compuesto de fórmula general IV se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general V,

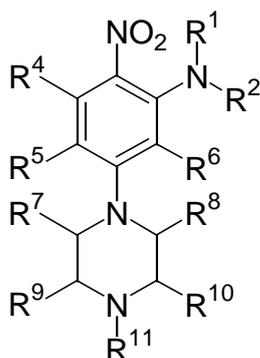


V

5

10

en la que  $R^1$  y  $R^2$  tienen cualquiera de los significados facilitados anteriormente, en un medio de reacción adecuado, preferiblemente en al menos un disolvente orgánico, más preferiblemente en al menos un disolvente orgánico seleccionado del grupo que consiste en tolueno o dimetoxietano, preferiblemente en presencia de al menos un catalizador, más preferiblemente en presencia de al menos una fuente de paladio, incluso más preferiblemente en presencia de al menos una fuente de paladio seleccionada del grupo que consiste en  $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ , en la que OAc es acetato, y  $\text{Pd}_2\text{dba}_3$ , en la que dba es dibencilidenacetona, y/o al menos un agente auxiliar, preferiblemente  $(\text{biph})\text{P}(\text{tBu})_2$ , en la que biph es bifenilo y tBu es *tert*-butilo, y/o al menos una base, preferiblemente al menos una base seleccionada del grupo que consiste en  $\text{K}_3\text{PO}_4$  y *tert*-pentóxido de sodio para dar un compuesto de fórmula general VI,



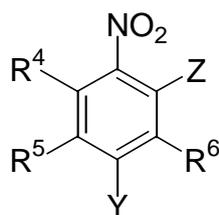
VI

15

en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^4$  a  $R^{11}$  tienen cualquiera de los significados facilitados anteriormente, que se purifica y/o aísla opcionalmente.

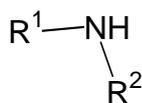
20

En otro aspecto, la invención se refiere a un procedimiento para la preparación de un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general I, en la que X representa  $-\text{NR}^1\text{R}^2$ , en la que al menos un compuesto nitrobenzeno de fórmula general VII,



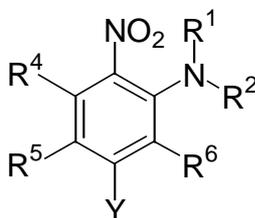
VII

en la que  $R^4$  a  $R^6$  tiene cualquiera de los significados facilitados anteriormente, Z representa un átomo de bromo o yodo, e Y representa un átomo de cloro, se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general V,



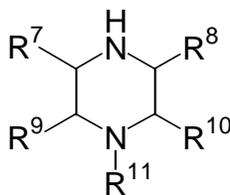
V

5 en la que  $R^1$  y  $R^2$  tienen cualquiera de los significados facilitados anteriormente en un medio de reacción adecuado, preferiblemente en al menos un disolvente orgánico, más preferiblemente en al menos un disolvente orgánico seleccionado del grupo que consiste en tolueno y dioxano, preferiblemente en presencia de al menos un catalizador, más preferiblemente en presencia de al menos una fuente de paladio y/o cobre, incluso más preferiblemente en presencia de al menos una fuente de paladio y/o cobre seleccionada del grupo que consiste en  $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ , en la que OAc es acetato,  $\text{Pd}_2\text{dba}_3$ , en la que dba es dibencilidenacetona, y yoduro de cobre (I), y/o al menos un agente auxiliar, preferiblemente al menos un agente auxiliar seleccionado del grupo que consiste en 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno (Xantphos), 1,1-bis(difenilfosfino-ferroceno) y  $\text{P}(\text{tBu})_3$ , en la que tBu es terc-butilo, y/o al menos una base, preferiblemente al menos una base seleccionada del grupo que consiste en  $\text{K}_3\text{PO}_4$ ,  $\text{Cs}_2\text{CO}_3$  y trans-1,2-diamino-metilciclohexano, para dar un compuesto de fórmula general VIII



VIII

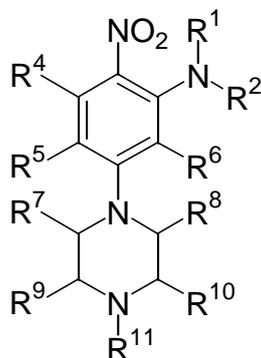
20 en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^4$  a  $R^6$  tienen cualquiera de los significados facilitados anteriormente e Y representa un átomo de cloro; que se purifica y/o aísla opcionalmente, y el compuesto de fórmula general VIII se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general III,



III

25 en la que  $R^7$  a  $R^{11}$  tienen cualquiera de los significados facilitados anteriormente, en un medio de reacción adecuado, preferiblemente en al menos un disolvente orgánico, más preferiblemente en al menos un disolvente orgánico seleccionado del grupo que consiste en tolueno, tetrahidrofurano y dimetoxietano, preferiblemente en presencia de al menos un catalizador, más preferiblemente en presencia de al menos una fuente de paladio, incluso más preferiblemente en presencia de al menos una fuente de paladio seleccionada del grupo que consiste en  $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ , en la que OAc es acetato, y  $\text{Pd}_2\text{dba}_3$ , en la que dba es dibencilidenacetona, y/o al menos un agente

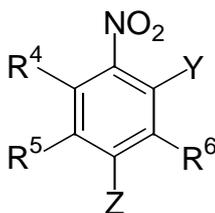
auxiliar, preferiblemente, (biph)P(*t*Bu)<sub>2</sub>, en la que biph es bifenilo y *t*Bu es *tert*-butilo, y/o al menos una base, preferiblemente al menos una base seleccionada del grupo que consiste en K<sub>3</sub>PO<sub>4</sub> o *tert*-pentóxido de sodio, para dar un compuesto de fórmula general VI



VI

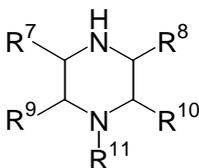
5 en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>4</sup> a R<sup>11</sup> tienen cualquiera de los significados facilitados anteriormente, que se purifica y/o aísla opcionalmente.

Otro aspecto de la presente invención se refiere a un procedimiento para la preparación de un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general I en la que X representa –OR<sup>3</sup>, en la que al menos un compuesto  
10 nitrobenzeno de fórmula general II,



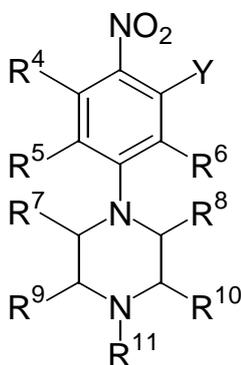
II

15 en la que R<sup>4</sup> a R<sup>6</sup> tiene cualquiera de los significados facilitados anteriormente, Y representa un átomo de cloro, y Z representa un átomo de bromo o yodo; se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general III,



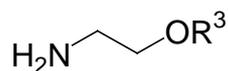
III

20 en la que R<sup>7</sup> a R<sup>11</sup> tienen cualquiera de los significados facilitados anteriormente, en un medio de reacción adecuado, preferiblemente en al menos un disolvente orgánico, más preferiblemente en al menos un disolvente orgánico seleccionado del grupo que consiste en tetrahidrofurano o dioxano, preferiblemente en presencia de al menos un catalizador, más preferiblemente en presencia de al menos una fuente de paladio, incluso más preferiblemente en presencia de PdCl<sub>2</sub>(dppf), en la que dppf es 1,1-bis(difenilfosfino)-ferroceno, y/o al menos un agente auxiliar, preferiblemente, 1,1-bis(difenilfosfino)-ferroceno, y/o al menos una base, preferiblemente, *tert*-pentóxido de sodio, para dar un compuesto de fórmula general IV,



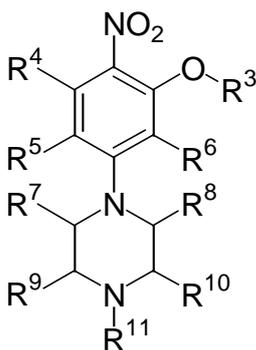
IV

- 5 en la que R<sup>4</sup> a R<sup>11</sup> tienen cualquiera de los significados facilitados anteriormente e Y representa un átomo de cloro; que se purifica y/o aísla opcionalmente, y el compuesto de fórmula general IV se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general IX,



IX

- 10 en la que R<sup>3</sup> tiene cualquiera de los significados facilitados anteriormente, en un medio de reacción adecuado, preferiblemente en al menos un disolvente orgánico, más preferiblemente en al menos un disolvente orgánico seleccionado del grupo que consiste en tolueno o dimetoxietano, preferiblemente en presencia de al menos un catalizador, más preferiblemente en presencia de al menos una fuente de paladio, incluso más preferiblemente en presencia de al menos una fuente de paladio seleccionado del grupo que consiste en Pd(OAc)<sub>2</sub>, en la que OAc es acetato, y Pd<sub>2</sub>dba<sub>3</sub>, en la que dba es dibencilidenacetona, y/o al menos un agente auxiliar, preferiblemente, (biph)P(*t*Bu)<sub>2</sub>, en la que biph es bifenilo y *t*Bu es *terc*-butilo, y/o al menos una base, preferiblemente al menos una base seleccionada del grupo que consiste en K<sub>3</sub>PO<sub>4</sub> y *terc*-pentóxido de sodio para dar un compuesto de fórmula general X,



X

- 20 en la que R<sup>3</sup> a R<sup>11</sup> tiene cualquiera de los significados facilitados anteriormente, que se purifica y/o aísla opcionalmente.
- 25 Medios de reacción adecuados incluyen disolvente orgánicos, tales como dialquil éter, preferiblemente, dietil éter y dimetoxietano, o un éter cíclico, preferiblemente, tetrahydrofurano o dioxano; o un hidrocarburo halogenado, preferiblemente, diclorometano o cloroformo; un alcohol, preferiblemente, metanol o etanol; un disolvente aprótico, preferiblemente, acetonitrilo, tolueno, piridina o dimetilformamida, o cualquier otro medio de reacción adecuado. Por

supuesto, pueden también usarse mezclas de al menos dos clases de disolventes o de al menos dos disolventes de una clase.

5 Todas las reacciones mencionadas anteriormente se llevan a cabo preferiblemente en un vial secado en horno. El catalizador, el agente auxiliar, la base y el compuesto de fórmula general II, IV, VII o VIII se añaden en cada caso y el vial se vacía posteriormente y se purga con argón. El disolvente orgánico y el compuesto de fórmula general III, V o IX se añaden y la reacción se lleva a cabo en un vial sellado a una temperatura de entre 100°C y 110°C, preferiblemente, a 100°C en caso de tetrahidrofurano o tolueno como el disolvente orgánico y a 110°C en caso de dimetoxietano y dioxano como el disolvente orgánico.

10 En las referencias de J.F. Hartwig et al., J. Am. Chem. Soc. 1996, 118, 7217-7218; S.L. Buchwald et al., J. Am. Chem. Soc. 2002, 124, 6043-6048; S. L. Buchwald et al. J. Am. Chem. Soc. 2002, 124, 7241-7424 y S.L. Buchwald et al., J. Am. Chem. Soc. 2002, 124, 11684-11688 se describen condiciones de reacción adecuadas para llevar a cabo la reacción entre compuestos de fórmula general II, IV, VII o VIII y compuestos de fórmula general III, V o IX .  
15 La parte respectiva de la descripción se incorpora en el presente documento como referencia y forma parte de la presente descripción.

20 Los compuestos de fórmulas generales IV, VI, VIII y X anteriormente facilitados pueden purificarse y/o aislarse según métodos bien conocidos por los expertos en la técnica .

25 Los compuestos de fórmula general IV, VI, VIII y X pueden aislarse por evaporación del medio de reacción, adición de agua y ajuste del valor de pH para obtener el compuesto en forma de un sólido que puede aislarse por filtración, o por extracción con un disolvente que no sea miscible con agua tal como cloroformo y purificación por cromatografía o recristalización en un disolvente adecuado.

30 Preferiblemente, los compuestos de fórmula general IV, VI, VIII y X pueden obtenerse por filtración de la mezcla de reacción y separación posterior de la mezcla de reacción en una placa de CCF. Alternativamente, los compuestos de fórmula general I pueden aislarse por adición de agua y metanol a la mezcla de reacción, evaporación de la mezcla de reacción y purificación del residuo por HPLC preparativa.

35 Los compuestos de fórmula general II y VII están disponibles comercialmente o pueden prepararse según métodos bien conocidos en la técnica, por ejemplo, similares a los métodos descritos en la bibliografía de A. McKillop et al., Tetrahedron 1987, 43, 1753. La parte respectiva de la descripción de la bibliografía se incorpora en el presente documento como referencia y forma parte de la descripción.

Los compuestos de fórmula general III, V e IX están disponibles comercialmente o pueden prepararse según métodos bien conocidos en la técnica.

40 Durante algunas reacciones sintéticas descritas anteriormente, o mientras que se preparan los compuestos de fórmula general III, V, VI, IX o X puede ser necesario y/o deseable la protección de grupos reactivos o sensibles. Esto puede realizarse usando grupos protectores convencionales como los descritos en Protective groups in Organic Chemistry, ed. J. F. W. McOmie, Plenum Press, 1973; T.W. Greene & P.G.M. Wuts y Protective Groups in Organic Chemistry, John Wiley & sons, 1991. Las partes respectivas de la descripción se incorporan en el presente documento como referencia y forma parte de la descripción. Los grupos protectores pueden eliminarse cuando sea  
45 conveniente, por medios bien conocidos para los expertos en la técnica.

50 Si los compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula general I se obtienen en forma de una mezcla de estereoisómeros, particularmente enantiómeros o diastereómeros, dichas mezclas pueden separarse por procedimientos estándar conocidos por los expertos en la técnica, por ejemplo, métodos cromatográficos o de cristalización con reactivos quirales.

55 Los compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula general I y en cada caso los estereoisómeros de los mismos pueden obtenerse en forma de su sal correspondiente según métodos bien conocidos por los expertos en la técnica, por ejemplo haciendo reaccionar dicho compuesto con al menos un ácido inorgánico y/u orgánico, preferiblemente en un medio de reacción adecuado. Medios de reacción adecuados incluyen, por ejemplo, cualquiera de los anteriormente facilitados.

60 El término "sal" debe entenderse que significa cualquier forma de compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula general I en los que asumen una forma iónica, o están cargados y se acoplan con un contraión (un catión o anión) o están en disolución. Por esto debe entenderse también complejos del compuesto activo con otras moléculas e iones, y en particular complejos que se complejan a través de interacciones iónicas.

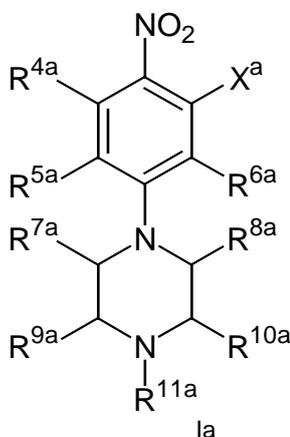
65 El término "sal fisiológicamente aceptable" se entiende en particular, en el contexto de esta invención, como una sal (según se definió anteriormente) formada bien con un ácido tolerado fisiológicamente, es decir, sales del compuesto activo particular con ácidos inorgánicos u orgánicos que son fisiológicamente tolerados, especialmente si se usan en humanos y/o mamíferos, o con al menos un catión, preferiblemente inorgánico, que es tolerado fisiológicamente,

especialmente si se usan en humanos y/o mamíferos. Ejemplos de sales toleradas fisiológicamente de ácidos particulares son sales de: ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, bromhidrato, monobromhidrato, monoclorhidrato o clorhidrato, metioduro, ácido metanosulfónico, ácido fórmico, ácido acético, ácido oxálico, ácido succínico, ácido málico, ácido tartárico, ácido mandélico, ácido fumárico, ácido láctico, ácido cítrico, ácido glutámico, ácido hipúrico, ácido pícrico y/o ácido aspártico. Ejemplos de sales de bases particulares toleradas fisiológicamente son sales de metales alcalinos y metales alcalinotérreos y con NH<sub>4</sub>.

Pueden también obtenerse solvatos, preferiblemente hidratos, de los compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula general I o en cada caso los estereoisómeros correspondientes, por procedimientos estándar conocidos por los expertos en la técnica.

El término "solvato" según esta invención debe entenderse que significa cualquier forma de los compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituídos de fórmula general I los cuales tienen unidos a través de un enlace no covalente otra molécula (más probablemente un disolvente polar) que incluye especialmente hidratos y alcoholatos, por ejemplo metanolato.

Un aspecto adicional de la presente invención se refiere a un medicamento que comprende al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituído de fórmula general Ia,



en la que

X<sup>a</sup> representa un resto -NR<sup>1a</sup>R<sup>2a</sup> o un resto -OR<sup>3a</sup>,

R<sup>1a</sup> representa un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;

un radical cicloalifático de 3 a 9 miembros saturado o insaturado, que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que está unido a través de un grupo alquilenos C<sub>1-6</sub>, alquilenos C<sub>2-6</sub> o alquilenos C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, fenilo, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y/o que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

un radical arilo o heteroarilo de 5 a 10 miembros que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y en los que dicho radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

radical arilo de 5 a 10 miembros en los que dicho radical arilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -

5 NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y dicho radical arilo se une a través de un grupo alquilenilo C<sub>1-6</sub>, alquenileno C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, fenilo, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) de la cadena;

10 un radical heteroarilo de 5 a 10 miembros, que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que está unido a través de un grupo alquilenilo C<sub>1-6</sub>, alquenileno C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, fenilo, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) de la cadena y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

o un resto -C(=O)-R<sup>12a</sup>,

25 R<sup>2a</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;

30 O  
R<sup>1a</sup> y R<sup>2a</sup> junto con el nitrógeno puente forman un anillo heterocíclico saturado, insaturado o aromático de 3 a 6 miembros que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, oxo (=O), tioxo (=S), -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) adicional(es) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo y/o que puede estar condensado con un sistema de anillo mono o bicíclico que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, oxo (=O), tioxo (=S), -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo en los que dichos sustituyente(s) cíclicos fenilo, fenoxilo y bencilo pueden estar no sustituido o sustituido por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>;

50 en los que los anillos del sistema de anillo tienen 5, 6 o 7 miembros y pueden contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre;

55 R<sup>3a</sup> representa un radical arilo o heteroarilo de 5 a 10 miembros que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que puede estar unido a través de un grupo alquilenilo C<sub>1-6</sub>, alquenileno C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado y que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

60 R<sup>4a</sup>, R<sup>5a</sup> y R<sup>6a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un átomo halógeno;

65 o

- 5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55  
60  
65
- R<sup>4a</sup> y R<sup>5a</sup> junto con los átomos de carbono puente forman un anillo heterocíclico no sustituido con 5 o 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo y que junto con el anillo de fenilo al que se fusiona forma un sistema de anillo aromático bicíclico de 9 o 10 miembros;
- R<sup>7a</sup> y R<sup>8a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;
- R<sup>9a</sup> y R<sup>10a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;
- R<sup>11a</sup> representa un átomo de hidrógeno; un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) de la cadena;
- un radical arilo o heteroarilo de 5 a 10 miembros que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que puede estar unido a través de un grupo alquilenilo C<sub>1-6</sub>, alquenileno C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo; un resto -C(=O)-R<sup>13a</sup> o un resto -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>14a</sup>;
- R<sup>12a</sup> representa un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;
- o un radical arilo o heteroarilo de 5 a 10 miembros, que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que puede estar unido a través de un grupo alquilenilo C<sub>1-6</sub>, alquenileno C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;
- y
- R<sup>13a</sup> y R<sup>14a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;
- o un radical arilo o heteroarilo de 5 a 10 miembros, que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y/o que puede estar unido a través de un grupo alquilenilo C<sub>1-6</sub>, alquenileno C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y en los que el radical heteroarilo contiene

1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo.

opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo;

y opcionalmente al menos un agente auxiliar compatible fisiológicamente.

También, se prefieren medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que

R<sup>1a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo que está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH y -NH<sub>2</sub>;

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

un radical arilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y naftilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y dicho radical arilo se une a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub> lineal o ramificado que puede contener 1, 2 o 3 átomo(s) de oxígeno como miembro(s) de la cadena y que puede estar sustituido con 1 radical fenilo;

un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y dicho radical heteroarilo se une a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub> lineal o ramificado que puede contener 1, 2 o 3 átomo(s) de oxígeno como miembro(s) de la cadena;

o un resto -C(=O)-R<sup>12a</sup>,

preferiblemente, R<sup>1a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo e isopropilo, en los que dicho radical alquilo está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en -OH, F, Cl, Br y -CN;

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo y piridinilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

un radical arilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y naftilo, en los que dicho arilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-

CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o se une a través de un grupo alquileo seleccionado del grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH(fenilo)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-;

5

un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo y piridinilo, en los que dicho radical heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o se une a través de un grupo alquileo seleccionado del grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-;

10

15

o un resto -C(=O)-R<sup>12a</sup>;

20

más preferiblemente, R<sup>1a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH;

un radical fenilo o pirrolilo no sustituido;

25

un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, terc-butilo, metoxilo, F y Cl y dicho radical fenilo se une a través de un grupo alquileo seleccionado del grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH(fenilo)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-;

30

un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en piridinilo, furanilo y pirrolilo, en los que dichos radicales piridinilo, furanilo o pirrolilo pueden estar sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, terc-butilo, metoxilo, F y Cl y dichos radicales piridinilo, furanilo o pirrolilo se unen a través de un grupo alquileo seleccionado del grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-;

35

o un resto -C(=O)-R<sup>12a</sup>;

y X<sup>a</sup> y R<sup>2a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

40

Además, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que

45

R<sup>2a</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido;

preferiblemente, R<sup>2a</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

50

más preferiblemente, R<sup>2a</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical metilo;

y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> y R<sup>3a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

55

También, se prefieren medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que

60

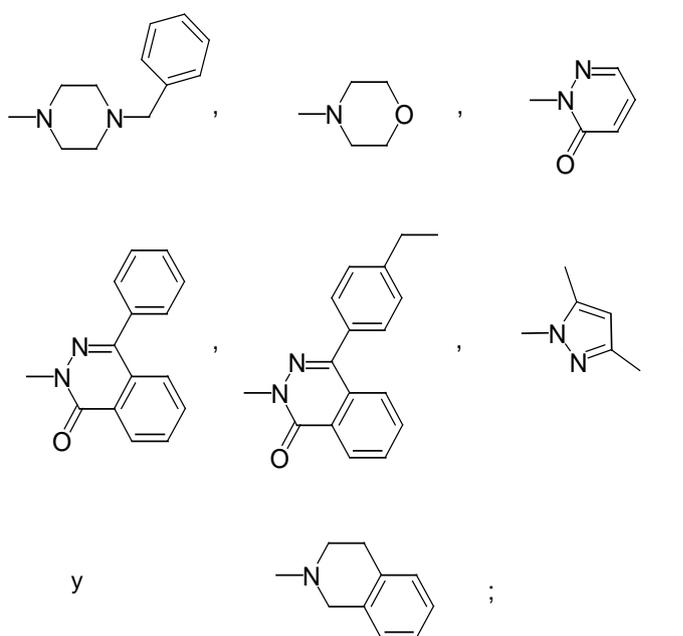
R<sup>1a</sup> y R<sup>2a</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en



en los que cada uno de esos restos cíclicos antes mencionados puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que dicho(s) sustituyente(s) cíclico(s) fenilo, fenoxilo y bencilo puede(n) estar no sustituido(s) o sustituido(s) por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>;

más preferiblemente, R<sup>1a</sup> y R<sup>2a</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en

15



20 y X<sup>a</sup> y R<sup>3a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

25 También, se prefieren medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que

R<sup>3a</sup> representa un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirroliilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo y piridinilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

40 preferiblemente, R<sup>3a</sup> representa un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

más preferiblemente, R<sup>3a</sup> representa un radical fenilo no sustituido;

5 y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup>, R<sup>2a</sup> y R<sup>4a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

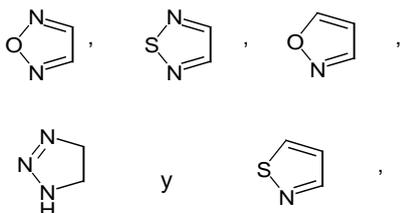
10 Además, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que

R<sup>4a</sup>, R<sup>5a</sup> y R<sup>6a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un átomo halógeno seleccionado del grupo que consiste en F, Cl y Br;

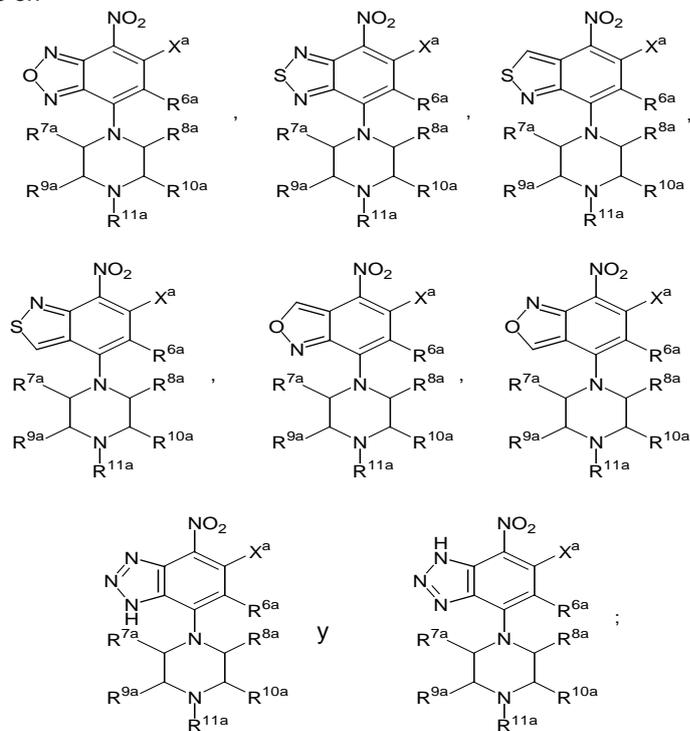
15 preferiblemente, R<sup>4a</sup>, R<sup>5a</sup> y R<sup>6a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un átomo de flúor;

20 y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> a R<sup>3a</sup> y R<sup>7a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

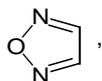
25 Además, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que R<sup>4a</sup> y R<sup>5a</sup> junto con los átomos de carbono puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en



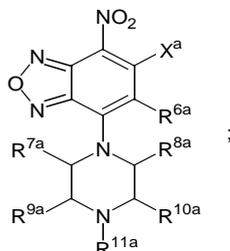
que junto con el anillo de fenilo al que se fusiona forma un sistema de anillo aromático bicíclico seleccionado del grupo que consiste en



preferiblemente, R<sup>4a</sup> y R<sup>5a</sup> junto con los átomos de carbono puente forman el resto siguiente,



que junto con el anillo de fenilo al que se fusiona forma el sistema de anillo aromático bicíclico sustituido siguiente



- 5 y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> a R<sup>3a</sup> y R<sup>6a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.
- 10 También, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que
- R<sup>7a</sup> y R<sup>8a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido;
- 15 preferiblemente, R<sup>7a</sup> y R<sup>8a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;
- 20 más preferiblemente, R<sup>7a</sup> y R<sup>8a</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;
- y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> a R<sup>6a</sup> y R<sup>9a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo.
- 25 También, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que
- R<sup>9a</sup> y R<sup>10a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido;
- 30 preferiblemente, R<sup>9a</sup> y R<sup>10a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;
- 35 más preferiblemente, R<sup>9a</sup> y R<sup>10a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical metilo;
- y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> a R<sup>8a</sup> y R<sup>11a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo.
- También, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que
- 45 R<sup>11a</sup> representa un átomo de hidrógeno;
- un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo, en los que dicho radical alquilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en -OH, F, Cl, Br y -CN;
- 50 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo,

piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>;

un resto -C(=O)-R<sup>13a</sup> o un resto -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>14a</sup>;

preferiblemente, R<sup>11a</sup> representa un átomo de hidrógeno;

un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo, en los que dicho radical alquilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en -OH, F, Cl, Br y -CN;

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, piridinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o puede estar unido a través de un -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>-grupo;

un resto -C(=O)-R<sup>13a</sup> o un resto -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>14a</sup>;

más preferiblemente, R<sup>11a</sup> representa un átomo de hidrógeno;

un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, n-butilo y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH;

un radical fenilo o piridinilo no sustituido en los que dicho radical fenilo o piridinilo puede estar unido a través de un -(CH<sub>2</sub>)- grupo;

un resto -C(=O)-R<sup>12a</sup> o un resto -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>13a</sup>;

y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> a R<sup>10a</sup> y R<sup>12a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que

R<sup>12a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>;

preferiblemente, R<sup>12a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo e isopropilo,

o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo y piridinilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s)

independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)-;

más preferiblemente, R<sup>12a</sup> representa un radical fenilo o un tiofenilo, en los que dicho radical fenilo o tiofenilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado del grupo que consiste en metilo y cloro;

y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> a R<sup>11a</sup>, R<sup>13a</sup> y R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que

R<sup>13a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo, en los que dicho radical alquilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en -OH, F, Cl, Br y -CN;

o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, piridinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1, 2 o 3</sub>;

preferiblemente, R<sup>13a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, y tienilo (tiofenilo), en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1, 2 o 3</sub>;

más preferiblemente, R<sup>13a</sup> representa un radical metilo o un radical fenilo o un tiofenilo, en los que dicho radical fenilo o tiofenilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) del grupo que consiste en metilo y cloro;

y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> a R<sup>12a</sup> y R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que

R<sup>14a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;  
o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e

imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>;

preferiblemente, R<sup>14a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo e isopropilo,

o un radical fenilo, que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

más preferiblemente, R<sup>14a</sup> representa un radical metilo o un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 radical(es) metilo(s).

También, se prefieren medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que

X<sup>a</sup> representa un resto -NR<sup>1a</sup>R<sup>2a</sup> o un resto -OR<sup>3a</sup>;

R<sup>1a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH;

un radical fenilo o pirrolilo no sustituido;

un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, terc-butilo, metoxilo, F y Cl y dicho radical fenilo se une a través de un grupo alquileo seleccionado del grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH(fenilo)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-;

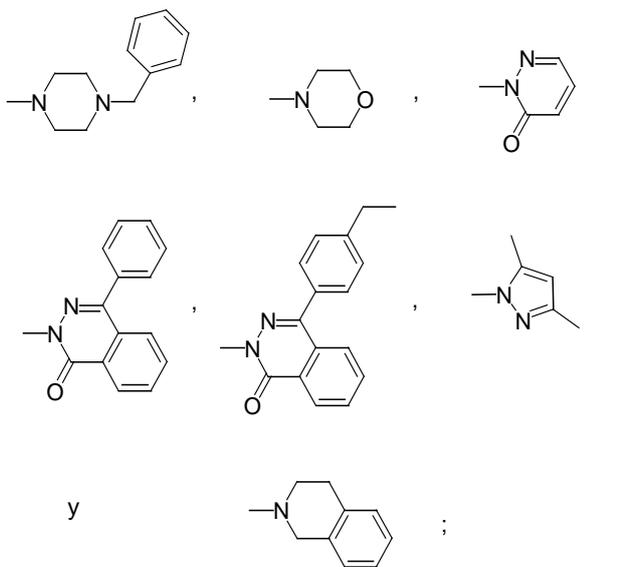
un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en piridinilo, furanilo y pirrolilo, en los que dichos radicales piridinilo, furanilo o pirrolilo pueden estar sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, terc-butilo, metoxilo, F y Cl y dichos radicales piridinilo, furanilo o pirrolilo se unen a través de un grupo alquileo seleccionado del grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-;

o un resto -C(=O)-R<sup>12a</sup>;

R<sup>2a</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical metilo;

o

R<sup>1a</sup> y R<sup>2a</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en



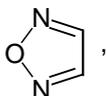
$R^{3a}$  representa un radical fenilo no sustituido;

$R^{4a}$ ,  $R^{5a}$  y  $R^{6a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un átomo de flúor;

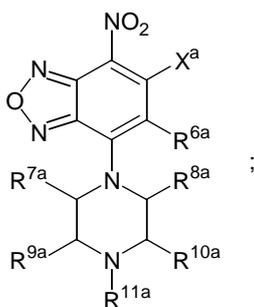
5

o

$R^{4a}$  y  $R^{5a}$  junto con los átomos de carbono puente forman el resto siguiente,



10 que junto con el anillo de fenilo al que se fusiona forma el sistema de anillo aromático bicíclico sustituido siguiente



$R^{7a}$  y  $R^{8a}$  representa cada uno un átomo de hidrógeno;

$R^{9a}$  y  $R^{10a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical metilo;

15

$R^{11a}$  representa un átomo de hidrógeno;

un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, n-butilo y  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{OH}$ ;

20 un radical fenilo o piridinilo no sustituido, en los que dicho radical fenilo o piridinilo puede estar unido a través de un grupo  $-(\text{CH}_2)-$ ;

un resto  $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{12a}$  o un resto  $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{13a}$ ;

25  $R^{12a}$  representa un radical fenilo o un tiofenilo, en los que dicho radical fenilo o tiofenilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado del grupo que consiste en metilo y cloro;

$R^{13a}$  representa un radical metilo o un radical fenilo o un tiofenilo, en los que dicho radical fenilo o tiofenilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) del grupo que consiste en metilo y cloro

y

R<sup>14a</sup> representa un radical metilo o un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 radical(es) metilo;

5 opcionalmente en forma una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

Se prefieren particularmente medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, seleccionado del grupo que consiste en

- 10 [1] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-pirrol-1-il-etil)-amina,  
 [2] (4-Fluoro-bencil)-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,  
 15 [3] N-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-benzamida,  
 [4] N-Metil-N-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-benzamida,  
 [5] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-pirrol-1-il-amina,  
 20 [6] 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-2H-piridazin-3-ona,  
 [7] 1-Metil-4-(4-nitro-3-fenoxi-fenil)-piperazina,  
 [8] Bencil-[5-(4-butil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,  
 25 [9] Bencil-[2-nitro-5-(4-piridin-2-il-piperazin-1-il)-fenil]-amina y  
 [10] Bencil-[2-nitro-5-(4-fenil-2-il-piperazin-1-il)-fenil]-amina;  
 30 [11] Furan-2-ilmetil-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,  
 [12] 2-[4-(4-Nitro-3-fenetilamino-fenil)-piperazin-1-il]-etanol,  
 [13] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-(2-o-toliloxi-etil)-amina  
 35 [14] 2-[4-(3-bencilamino-4-nitro-fenil)-piperazin-1-il]-etanol,  
 [15] 4-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-morfolina,  
 40 [16] 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-4-fenil-2H-ftalazin-1-ona,  
 [17] [2-(4-Cloro-fenoxi)-etil]-[5-(3,5-dimetil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,  
 [18] 2-[4-[3-(Bencidril-amino)-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-etanol,  
 45 [19] 4-[4-Fluoro-5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-morfolina,  
 [20] 2-[2-Nitro-5-[4-(tolueno-4-sulfonil)-piperazin-1-il]-fenil]-1,2,3,4-tetrahidro-isoquinolina,  
 50 [21] 1-[3-(3,5-Dimetil-pirazol-1-il)-4-nitro-fenil]-4-metil-piperazina,  
 [22] Bencil-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,  
 55 [23] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-fenetil-amina,  
 [24] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-piridin-3-ilmetil-amina,  
 [25] (3-Cloro-fenil)-[4-[3-[(furanil-2-ilmetil)-amino]-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-metanona,  
 60 [26] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-piridin-3-ilmetil-amina,  
 [27] 1-Bencil-4-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-piperazina,  
 65 [28] Furan-2-ilmetil-[5-(4-metanosulfonil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-

- amina,
- [29] Bencidril-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 5 [30] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-(2-fenoksi-etil)-amina,
- [31] 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-4-fenil-2H-ftalazin-1-ona,
- [32] 1-[3-(3,5-Dimetil-pirazol-1-il)-4-nitro-fenil]-piperazina,
- 10 [33] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-fenetil-amina,
- [34] [5-(4-Bencenosulfonil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-furan-2-ilmetil-amina,
- 15 [35] [2-(3,4-Dimetoksi-fenil)-etil]-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,
- [36] [4-[3-[(Furan-2-ilmetil)-amino]-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-m-tolil-metanona,
- 20 [37] [4-[3-[(Furan-2-ilmetil)-amino]-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-fenil-metanona,
- [38] [4-[3-(3,5-Dimetil-pirazol-1-il)-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-tiofen-2-il-metanona,
- 25 [39] 4-(4-Etil-fenil)-2-[5-[4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-2H-ftalalazin-1-ona,
- [40] 3-[7-(4-Metil-piperazin-1-il)-4-nitro-benzo[1,2,5]oxadiazol-5-ilamino]-propan-1-ol,
- 30 [41] 3-[4-Nitro-7-(4-fenil-piperazin-1-il)-benzo[1,2,5]oxadiazol-5-ilamino]-etan-1-ol,
- 35 [42] 3-[4-Nitro-7-(4-piridin-piperazin-1-il)-benzo[1,2,5]oxadiazol-5-ilamino]-propan-1-ol,
- [43] [2-(3,4-Dimetoksi-fenil)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 40 [44] [2-(3,4-Dimetil-fenil)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [45] [2-(4-terc-butil-fenoksi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 45 [46] [2-(4-Metoksi-fenoksi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 50 [47] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-m-toliloksi-etil)-amina,
- [48] [2-(4-Cloro-fenoksi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 55 [49] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-(1-fenil-etil)-amina,
- [50] [2-(3-Metoksi-fenoksi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 60 [51] [2-(2-Metoksi-fenoksi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [52] (4-Cloro-bencil)-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,
- 65 [53] Bencil-[5-(4-bencil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,

[54] Bencil-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,

[55] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-o-toliloxi-etil)-amina,

5 [56] (4-Cloro-bencil)-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,

[57] Furan-2-ilmetil-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,

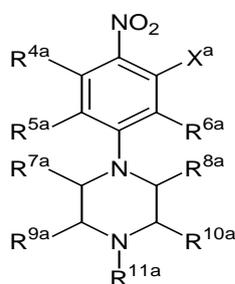
10 [58] [2-(4-Cloro-fenoxi)-etil]-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,

[59] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(1-fenil-etil)-amina y

[60] 1-[4-(3-bencilamino-4-nitro-fenil)-piperazin-1-il]-etanona,

15 opcionalmente en forma de una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

Todavía un aspecto adicional de la presente invención se refiere a un medicamento que comprende al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia,



Ia

en la que

25  $X^a$  representa un resto  $-NR^{1a}R^{2a}$  o un resto  $-OR^{3a}$ ,

30  $R^{1a}$  representa un radical alifático lineal o ramificado, saturado o insaturado, al menos monosustituido; un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente que contiene al menos un heteroátomo como miembro del anillo, que está unido a través de un grupo alquileo, alquenileno o alquinileno lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido; un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido; un radical arilo en el que dicho radical arilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -C(=O)-N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo  $C_{1-5}$ , -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y dicho radical arilo se une a través de un grupo alquileo, alquenileno o alquinileno lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente que contiene al menos un heteroátomo como un miembro de la cadena; un radical heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que está unido a través de un grupo alquileo, alquenileno o alquinileno lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido, opcionalmente que contiene al menos un heteroátomo como un miembro de la cadena; o un resto  $-C(=O)-R^{12a}$ ;

40  $R^{2a}$  representa un átomo de hidrógeno o un radical alifático lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido;

45 o

50  $R^{1a}$  y  $R^{2a}$  junto con el nitrógeno puente forman un anillo heterocíclico opcionalmente al menos monosustituido; saturado, insaturado o aromático que puede contener al menos un heteroátomo adicional como un miembro del anillo y/o que puede estar condensado con un sistema de anillo mono o bicíclico opcionalmente al menos monosustituido;

55  $R^{3a}$  representa un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede estar unido a través de un grupo alquileo, alquenileno o alquinileno lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido;

R<sup>4a</sup>, R<sup>5a</sup> y R<sup>6a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un átomo halógeno;

o

5 R<sup>4a</sup> y R<sup>5a</sup> junto con los átomos de carbono puente forman un anillo heterocíclico que contiene al menos un heteroátomo como miembro del anillo opcionalmente al menos monosustituido, que junto con el anillo de fenilo al que se fusiona forma un sistema de anillo aromático bicíclico sustituido;

10 R<sup>7a</sup> y R<sup>8a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido;

R<sup>9a</sup> y R<sup>10a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido;

15 R<sup>11a</sup> representa un átomo de hidrógeno; un radical alifático que contiene al menos un heteroátomo como miembro de la cadena, lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido; un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede estar unido a través de un grupo alquileo, alquenileno o alquinileno lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido; un resto -C(=O)-R<sup>13a</sup> o un resto -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>14a</sup>;

20 R<sup>12a</sup> representa un radical alifático lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido; o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede estar unido a través de un grupo alquileo, alquenileno o alquinileno lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido;

25 y

30 R<sup>13a</sup> y R<sup>14a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un radical alifático lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido; o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede estar unido a través de un grupo alquileo, alquenileno o alquinileno lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido;

35 opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo;

y opcionalmente al menos un agente auxiliar fisiológicamente compatible.

40 Un sistema de anillo mono o bicíclico según la presente invención, a menos que se defina de otra forma, significa un sistema de anillo de hidrocarburo mono o bicíclico que puede ser saturado, insaturado o aromático. Cada uno de sus diferentes anillos pueden mostrar un grado de saturación diferente, es decir, puede ser saturado, insaturado o aromático. Opcionalmente, cada uno de los anillos del sistema de anillo mono o bicíclico puede contener uno o más, preferiblemente, 1, 2 o 3, heteroátomo(s) como miembro(s) del anillo, que puede ser iguales o diferentes y que pueden seleccionarse preferiblemente del grupo que consiste en N, O y S. Los anillos del sistema de anillo mono o bicíclico tienen preferiblemente, 5, 6 o 7 miembros.

50 El término "condensado" según la presente invención significa que un anillo o sistema de anillo se une a otro anillo o sistema en anillo, en los que los términos "anulado" o "anillado" se usan también por aquellos expertos en la técnica para designar este tipo de unión.

55 Tal sistema de anillo mono o bicíclico puede, a menos que se defina de otra forma, estar no sustituido o sustituido por uno o más sustituyentes, preferiblemente, no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s). Dichos sustituyentes pueden preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, oxo (=O), tioxo (=S), -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que en cada caso alquilo C<sub>1-5</sub> puede ser lineal o ramificado y en los que dichos sustituyentes cíclicos pueden estar no sustituidos o sustituidos por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>.

65 Más preferiblemente, dichos sustituyentes pueden seleccionarse del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -

C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que en cada caso dichos sustituyentes cíclicos pueden estar no sustituidos o sustituidos por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>.

Si cualquiera de los sustituyentes representa o comprende un radical (hetero)cicloalifático [grupo (hetero)cicloalifático], dicho radical (hetero)cicloalifático puede, a menos que se defina de otra forma, estar no sustituido o sustituido por uno o más sustituyentes, preferiblemente, no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s). Dicho(s) sustituyente(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que en cada caso alquilo C<sub>1-5</sub> puede ser lineal o ramificado y en los que dichos sustituyentes cíclicos pueden estar no sustituidos o sustituidos por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>.

Más preferiblemente, dichos sustituyentes puede seleccionarse independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que en cada caso dichos sustituyentes cíclicos puede estar no sustituidos o sustituidos por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>.

Si cualquiera de los sustituyentes representa o comprende un radical cicloalifático, que contiene uno o más, preferiblemente, 1, 2 o 3 heteroátomo(s) como miembro(s) del anillo, a menos que se defina de otra forma, cada uno de este (os) heteroátomo(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en N, O y S.

Radicales (hetero)cicloalifáticos adecuados, que pueden estar no sustituidos o al menos monosustituido, incluyen ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclopentenilo, ciclohexilo, ciclohexenilo, cicloheptilo, cicloheptenilo, ciclooctilo, ciclooctenilo, ciclononilo, imidazolidinilo, aziridinilo, azetidino, piperidinilo, piperidinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, piperazinilo, pirazolidinilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidrotiofenilo y azepanilo.

Si cualquiera de los sustituyentes representa o comprende un radical arilo (grupo arilo), incluyendo un grupo fenilo o naftilo, dicho radical arilo puede, a menos que se defina de otra forma, estar no sustituido o sustituido por uno o más sustituyentes, preferiblemente, no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s). Dicho(s) sustituyente(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que en cada caso alquilo C<sub>1-5</sub> puede ser lineal o ramificado y en los que dicho(s) sustituyente(s) cíclico(s) puede(n) estar no sustituido(s) o sustituido(s) por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y -NO<sub>2</sub>.

Más preferiblemente, dichos sustituyentes puede seleccionarse independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>.

Radicales arilo preferidos, que pueden estar opcionalmente al menos monosustituidos, son fenilo y naftilo.

Si cualquiera de los sustituyentes representa o comprende un radical heteroarilo (grupo heteroarilo), dicho radical heteroarilo puede, a menos que se defina de otra forma, estar no sustituido o sustituido por uno o más sustituyentes, preferiblemente, no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s). Dicho(s) sustituyente(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -

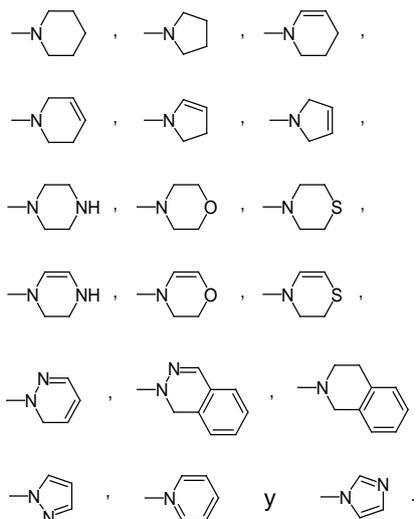
5  $\text{SCF}_3$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{NH}(\text{alquilo } \text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{N}(\text{alquilo } \text{C}_{1-5})_2$ ,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{CHO}$ ,  $-\text{CF}_2\text{H}$ ,  $-\text{CFH}_2$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{alquilo } \text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{alquilo } \text{C}_{1-5})_2$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{alquilo } \text{C}_{1-5}$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{fenilo}$ , fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que en cada caso alquilo  $\text{C}_{1-5}$  puede ser lineal o ramificado y en los que dicho(s) sustituyente(s) cíclico(s) puede(n) estar no sustituido(s) o sustituido(s) por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{OCF}_3$ ,  $-\text{SCF}_3$ ,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{NH}_2$  y  $\text{NO}_2$ .

10 Más preferiblemente, dichos sustituyentes pueden seleccionarse independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo,  $-\text{O}-\text{CH}_3$ ,  $-\text{O}-\text{C}_2\text{H}_5$ ,  $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$ ,  $-\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$ ,  $-\text{S}-\text{CH}_3$ ,  $-\text{S}-\text{C}_2\text{H}_5$ ,  $-\text{S}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$ ,  $-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{S}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{OH}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_2\text{H}_5$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_2\text{H}_5$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(\text{CH}_3)_3$ , F, Cl, Br, I,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{OCF}_3$ ,  $-\text{SCF}_3$ ,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{NH}-\text{CH}_3$ ,  $-\text{NH}-\text{C}_2\text{H}_5$ ,  $-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$ ,  $-\text{NH}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{NH}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$ ,  $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ ,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{CHO}$ ,  $-\text{CF}_2\text{H}$ ,  $-\text{CFH}_2$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}-\text{CH}_3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}-\text{C}_2\text{H}_5$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$  y  $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{CH}_3$ .

15 El (los) heteroátomo(s), que está(n) presente(s) como miembro(s) del anillo en el radical heteroarilo, puede(n), a menos que se defina de otra forma, independientemente seleccionarse del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre. Preferiblemente, el radical heteroarilo comprende 1, 2 o 3 heteroátomo(s).

20 Radicales heteroarilo adecuados, que pueden estar opcionalmente al menos monosustituídos, pueden preferiblemente seleccionarse del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo, benzoxadiazolilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, benzisoxazolilo, benzisotiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo.

25 Si al menos dos de los sustituyentes junto con el átomo de nitrógeno puente forman un anillo heterocíclico saturado o insaturado, que puede estar condensado con un sistema de anillo mono o bicíclico opcionalmente al menos monosustituído, dicho anillo heterocíclico puede preferiblemente seleccionarse del grupo que consiste en



30 Los expertos en la técnica comprenden que los restos cíclicos antes mencionados, que contienen un grupo NH pueden también estar sustituidos en esta posición, es decir, el átomo de hidrógeno puede cambiarse por otro sustituyente.

35 Dichos anillos heterocíclicos pueden, a menos que se defina de otra forma, estar no sustituidos o sustituidos por uno o más sustituyentes, preferiblemente, no sustituidos o sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s). Dicho(s) sustituyente(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en alquilo  $\text{C}_{1-5}$ ,  $-\text{O}-\text{alquilo } \text{C}_{1-5}$ ,  $-\text{S}-\text{alquilo } \text{C}_{1-5}$ , oxo ( $=\text{O}$ ), tioxo ( $=\text{S}$ ),  $-\text{C}(=\text{O})-\text{OH}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{alquilo } \text{C}_{1-5}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{alquilo } \text{C}_{1-5}$ ,  $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{alquilo } \text{C}_{1-5}$ , F, Cl, Br, I,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{OCF}_3$ ,  $-\text{SCF}_3$ ,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{NH}(\text{alquilo } \text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{N}(\text{alquilo } \text{C}_{1-5})_2$ ,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{CHO}$ ,  $-\text{CF}_2\text{H}$ ,  $-\text{CFH}_2$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{alquilo } \text{C}_{1-5})$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{alquilo } \text{C}_{1-5})_2$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{alquilo } \text{C}_{1-5}$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{fenilo}$ , fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que en cada caso alquilo  $\text{C}_{1-5}$  puede ser lineal o ramificado y en los que dicho(s) sustituyente(s) cíclico(s) puede(n) estar no sustituido(s) o sustituido(s) por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{OCF}_3$ ,  $-\text{SCF}_3$ ,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{NH}_2$  y  $\text{NO}_2$ .

45 Más preferiblemente, dichos sustituyentes pueden seleccionarse independientemente del grupo que consiste en oxo ( $=\text{O}$ ), tioxo ( $=\text{S}$ ), metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo,  $-\text{O}-\text{CH}_3$ ,  $-\text{O}-\text{C}_2\text{H}_5$ ,  $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$ ,  $-\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$ ,  $-\text{S}-\text{CH}_3$ ,  $-\text{S}-\text{C}_2\text{H}_5$ ,  $-\text{S}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$ ,  $-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{S}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$ , -

5 C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que dicho(s) sustituyente(s) cíclico(s) puede(n) estar no sustituido(s) o sustituido(s) por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>.

10 Si cualquiera de los sustituyentes representa un radical alifático saturado o insaturado (grupo alifático), es decir, un radical alquilo, un radical alqueno o un radical alquino, dicho radical alifático puede, a menos que se defina de otra forma, estar no sustituido o sustituido por uno o más sustituyentes, preferiblemente, no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s). Dicho(s) sustituyente(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, en los que en cada caso alquilo C<sub>1-5</sub> puede ser lineal o ramificado. Más  
15 preferiblemente, dicho(s) sustituyente(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>.

20 Un radical alqueno comprende al menos un doble enlace carbono-carbono, un radical alquino comprende al menos un triple enlace carbono-carbono.

Los radicales alquilo adecuados, que pueden estar sustituidos por uno o más sustituyentes, pueden preferiblemente seleccionarse del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo y n-decilo.  
25

Los radicales alqueno adecuados, que pueden estar sustituidos por uno o más sustituyentes, pueden preferiblemente seleccionarse del grupo que consiste en vinilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-butenilo, 2-butenilo y 3-butenilo.  
30

Los radicales alquino adecuados, que pueden estar sustituidos por uno o más sustituyentes, pueden preferiblemente seleccionarse del grupo que consiste en etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo y 3-butinilo.

35 Si cualquiera de los sustituyentes representa un grupo alqueno, un grupo alqueno o un grupo alquino, que puede estar sustituido, dicho grupo alqueno, grupo alqueno o grupo alquino puede, a menos que se defina de otra forma, estar no sustituido o sustituido por uno o más sustituyentes, preferiblemente, no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s). Dicho(s) sustituyente(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse independientemente del grupo que consiste en -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y fenilo, en los que en cada caso alquilo C<sub>1-5</sub> puede ser lineal o ramificado y el radical fenilo está preferiblemente, no sustituido. Un grupo alqueno comprende al menos un doble enlace carbono-carbono, un grupo alquino comprende al menos un triple enlace carbono-carbono.  
40

Los grupos alqueno adecuados incluyen -(CH<sub>2</sub>)-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH(fenilo), -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub> y -(CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>-, los grupos alqueno adecuados incluyen -CH=CH-, -CH<sub>2</sub>-CH=CH- y -CH=CH-CH<sub>2</sub>- y los grupos alquino adecuados incluyen -C≡C-, -CH<sub>2</sub>-C≡C- y -C≡C-CH<sub>2</sub>-.  
45

Si el grupo alqueno, alqueno o alquino contiene uno o más, preferiblemente, 1, 2 o 3, más preferiblemente, 1, heteroátomo(s) como miembro(s) de la cadena, a menos que se defina de otra forma, cada uno de estos heteroátomo(s) puede(n) preferiblemente seleccionarse del grupo que consiste en N, O y S. Los grupos alqueno adecuados que contienen uno o más heteroátomo(s) incluyen -CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O.  
50

En otro aspecto, la invención se refiere a un medicamento que comprende al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia,  
55

en la que

X<sup>a</sup> representa un resto -NR<sup>1a</sup>R<sup>2a</sup> o un resto -OR<sup>3a</sup>,

60 R<sup>1a</sup> representa un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, al menos monosustituido; un radical cicloalifático saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido de 3 a 9 miembros, que está unido a través de un grupo alqueno C<sub>1-6</sub>, alqueno C<sub>2-6</sub> o alquino C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido y/o que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo; un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido de 5 a 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre  
65

- 5 como miembro(s) del anillo; un radical arilo de 5 a 10 miembros, en los que dicho radical arilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y dicho radical arilo se une a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub>, alquilenilo C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) de la cadena; un radical heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido de 5 a 10 miembros, que está unido a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub>, alquilenilo C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) de la cadena y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo; o un resto -C(=O)-R<sup>12a</sup>;
- 10 R<sup>2a</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido;
- 20 o
- R<sup>1a</sup> y R<sup>2a</sup> junto con el nitrógeno puente forman un anillo heterocíclico opcionalmente al menos monosustituido; saturado, insaturado o aromático de 3 a 9 miembros que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) adicional(es) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo y/o que puede estar condensado con un sistema de anillo mono o bicíclico opcionalmente al menos monosustituido;
- 25 en los que los anillos del sistema de anillo son de 5, 6 o 7 miembros y pueden contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre;
- 30 R<sup>3a</sup> representa un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido de 5 a 10 miembros, que puede estar unido a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub>, alquilenilo C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;
- 35 R<sup>4a</sup>, R<sup>5a</sup> y R<sup>6a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un átomo halógeno;
- 40 o
- R<sup>4a</sup> y R<sup>5a</sup> junto con los átomos de carbono puente forman un anillo heterocíclico opcionalmente al menos monosustituido de 5 o 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo y que junto con el anillo de fenilo al que se fusiona forma un sistema de anillo aromático bicíclico sustituido de 9 o 10 miembros;
- 45 R<sup>7a</sup> y R<sup>8a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido;
- 50 R<sup>9a</sup> y R<sup>10a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido;
- 55 R<sup>11a</sup> representa un átomo de hidrógeno; un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) de la cadena; un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido de 5 a 10 miembros que puede estar unido a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub>, alquilenilo C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo; un resto -C(=O)-R<sup>13a</sup> o un resto -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>14a</sup>;
- 60 R<sup>12a</sup> representa un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido; o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede estar unido a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub>, alquilenilo C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s)
- 65

seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

y

$R^{13a}$  y  $R^{14a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un radical alifático  $C_{1-10}$  lineal o ramificado, saturado o insaturado, opcionalmente al menos monosustituido; o un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido, que puede estar unido a través de un grupo alquileo  $C_{1-6}$ , alquilenilo  $C_{2-6}$  o alquínileo  $C_{2-6}$  lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo.

También, se prefieren medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que  $R^{1a}$  representa un radical alifático  $C_{1-10}$  lineal o ramificado, al menos monosustituido; un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo; un radical arilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y naftilo, en los que dicho radical arilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -C(=O)-N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo  $C_{1-5}$ , -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y dicho radical arilo se une a través de un grupo alquileo  $C_{1-6}$  opcionalmente al menos monosustituido que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) de la cadena; un radical heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical heteroarilo se une a través de un grupo alquileo  $C_{1-6}$  opcionalmente al menos monosustituido que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) de la cadena; o un resto -C(=O)-R<sup>12a</sup>;

preferiblemente,  $R^{1a}$  representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo, en los que dicho radical alquilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en -OH, F, Cl, Br y -CN; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -C(=O)-N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo  $C_{1-5}$ , -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; un radical arilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y naftilo, en los que dicho radical arilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -C(=O)-N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo  $C_{1-5}$ , -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y dicho radical arilo se une a través de un grupo alquileo  $C_{1-6}$  lineal o ramificado que puede contener 1, 2 o 3 átomo(s) de oxígeno como miembro(s) de la cadena y que puede estar sustituido con 1 radical fenilo; un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -C(=O)-N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo  $C_{1-5}$ , -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y dicho radical heteroarilo se une a través de un grupo alquileo  $C_{1-6}$  lineal o ramificado que puede contener 1, 2 o 3 átomo(s) de oxígeno como miembro(s) de la cadena; o un resto -C(=O)-R<sup>12a</sup>;

más preferiblemente,  $R^{1a}$  representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo e isopropilo, en los que dicho radical alquilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en -OH, F, Cl, Br y -CN; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo y piridinilo, en los que dicho radical arilo o

heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

un radical arilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y naftilo, en los que dicho arilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y/o se une a través de un grupo alquileo seleccionado forman el grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH(fenilo)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-; un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo y piridinilo, en los que dicho radical heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y/o se une a través de un grupo alquileo seleccionado forman el grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-; o un resto -C(=O)-R<sup>12a</sup>;

y X<sup>a</sup> y R<sup>2a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

Además, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que R<sup>2a</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido;

preferiblemente, R<sup>2a</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

más preferiblemente, R<sup>2a</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical metilo;

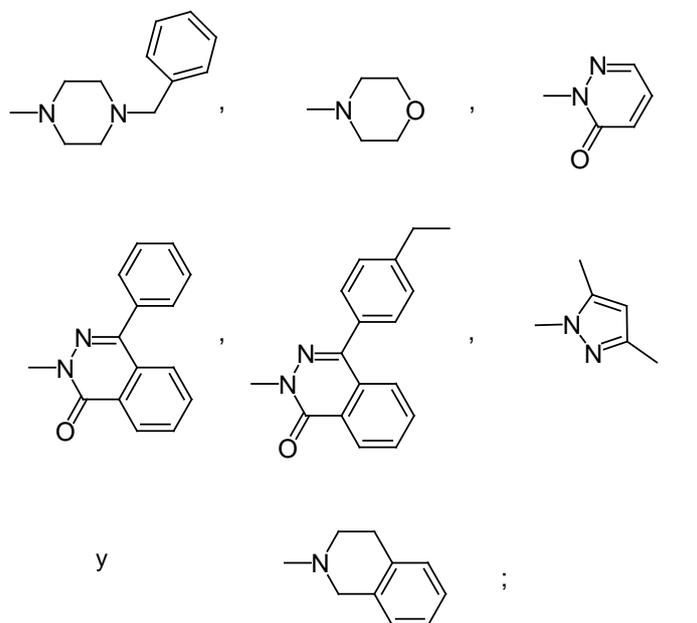
y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> y R<sup>3a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que R<sup>1a</sup> y R<sup>2a</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en



seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>;

5 más preferiblemente, R<sup>1a</sup> y R<sup>2a</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en



10 y X<sup>a</sup> y R<sup>3a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

15 También, se prefieren medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que R<sup>3a</sup> representa un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar unido a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub> opcionalmente al menos monosustituido;

20 preferiblemente, R<sup>3a</sup> representa un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y dicho radical arilo o heteroarilo puede estar unido a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub> lineal o ramificado;

25 más preferiblemente, R<sup>3a</sup> representa un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo y piridinilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

y  $X^a$ ,  $R^{1a}$ ,  $R^{2a}$  y  $R^{4a}$  a  $R^{14a}$  tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

5

Además, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que  $R^{4a}$ ,  $R^{5a}$  y  $R^{6a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un átomo halógeno seleccionado del grupo que consiste en F, Cl y Br;

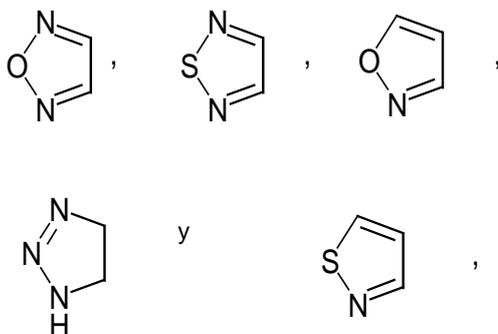
10 preferiblemente,  $R^{4a}$ ,  $R^{5a}$  y  $R^{6a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un átomo de flúor;

y  $X^a$ ,  $R^{1a}$  a  $R^{3a}$  y  $R^{7a}$  a  $R^{14a}$  tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

15

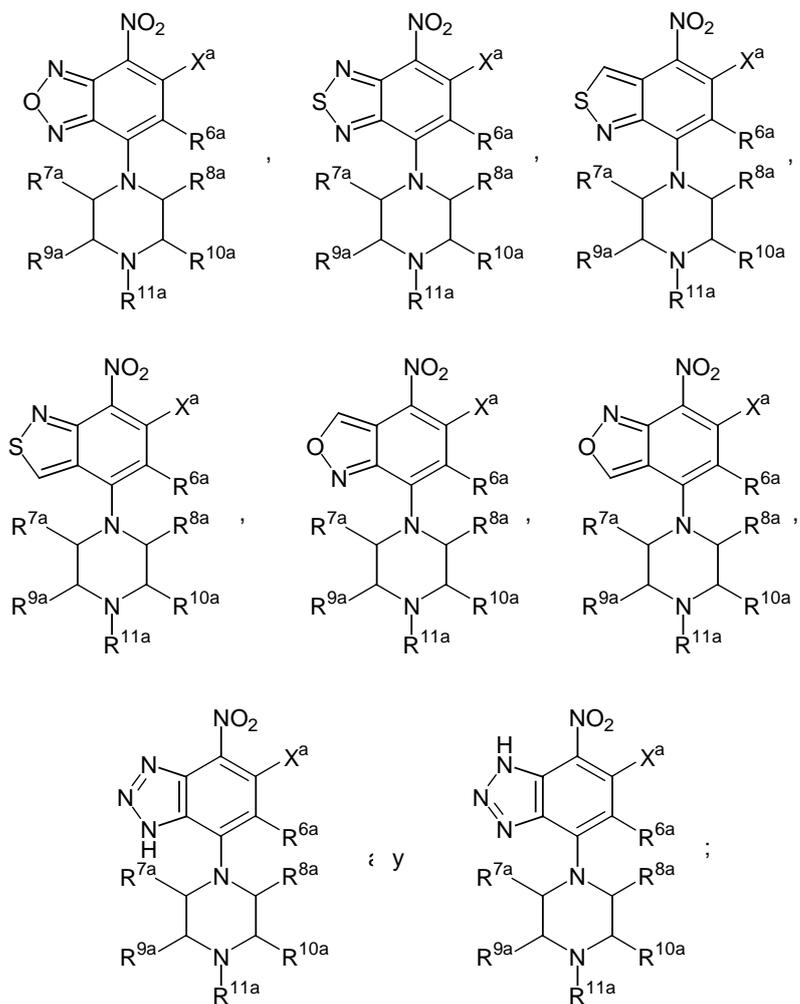
Además, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que  $R^{4a}$  y  $R^{5a}$  junto con los átomos de carbono puente forman un resto seleccionado del grupo constituido por

20



en los que cada uno de esos restos cíclicos antes mencionados pueden estar sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub> y -NO<sub>2</sub>; que junto con el anillo de fenilo al que se fusiona forman un sistema de anillo aromático bicíclico sustituido seleccionado del grupo que consiste en

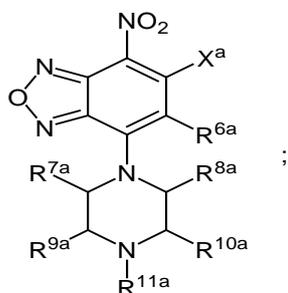
25



preferiblemente, R<sup>4a</sup> y R<sup>5a</sup> junto con los átomos de carbono puente forman el resto siguiente,



5 que junto con el anillo de fenilo al que se fusiona forman el sistema de anillo aromático bicíclico sustituido siguiente



10 y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> a R<sup>3a</sup> y R<sup>6a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que R<sup>7a</sup> y R<sup>8a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido;

5 preferiblemente, R<sup>7a</sup> y R<sup>8a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

más preferiblemente, R<sup>7a</sup> y R<sup>8a</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

10 y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> a R<sup>6a</sup> y R<sup>9a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

15 También, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que R<sup>9a</sup> y R<sup>10a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido;

20 preferiblemente, R<sup>9a</sup> y R<sup>10a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

más preferiblemente, R<sup>9a</sup> y R<sup>10a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical metilo;

25 y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> a R<sup>8a</sup> y R<sup>11a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

30 También, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que R<sup>11a</sup> representa un átomo de hidrógeno; un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y piridinilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-

35 OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -CN, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y/o puede estar unido a través de un grupo alquileno C<sub>1-6</sub>; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-

40 OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -C(=O)-

45 N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y/o puede estar unido a través de un grupo alquileno C<sub>1-6</sub>; un resto -C(=O)-R<sup>13a</sup> o un resto -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>14a</sup>,

preferiblemente, R<sup>11a</sup> representa un átomo de hidrógeno; un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo, en los que dicho radical alquilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en -OH, F, Cl, Br y -CN; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y piridinilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-

55 C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CN, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>;

60 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-

65 C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -

C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1, 2 o 3</sub>; un resto -C(=O)-R<sup>13a</sup> o un resto -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>14a</sup>;

y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> a R<sup>10a</sup> y R<sup>12a</sup> a R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que R<sup>12a</sup> representa un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido; un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, que puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>;

preferiblemente, R<sup>12a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo; o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>;

más preferiblemente, R<sup>12a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo e isopropilo, o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo y piridinilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y/o puede estar unido a través de un -(CH<sub>2</sub>) - grupo;

y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> a R<sup>11a</sup>, R<sup>13a</sup> y R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que R<sup>13a</sup> representa un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y piridinilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo es sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -CN, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y/o puede estar unido a través de un grupo alquilenilo C<sub>1-6</sub>; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y/o puede estar unido a través de un grupo alquilenilo C<sub>1-6</sub>; un resto -C(=O)-R<sup>13a</sup> o un resto -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>14a</sup>;

preferiblemente, R<sup>13a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo, en los que dicho radical alquilo puede estar sustituido con 1, 2 o

3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en -OH, F, Cl, Br y -CN; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y piridinilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CN, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1, 2 o 3</sub>; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1, 2 o 3</sub>; un resto -C(=O)-R<sup>13a</sup> o un resto -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>14a</sup>;

y X<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> a R<sup>12a</sup> y R<sup>14a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

También, se prefieren tales medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que R<sup>14a</sup> representa un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, opcionalmente al menos monosustituido; un radical arilo o heteroarilo opcionalmente al menos monosustituido seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo que puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>;

preferiblemente, R<sup>14a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo; o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>;

más preferiblemente, R<sup>14a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo e isopropilo, o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo y piridinilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>;

y X<sup>a</sup> y R<sup>1a</sup> a R<sup>13a</sup> tienen el significado definido anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

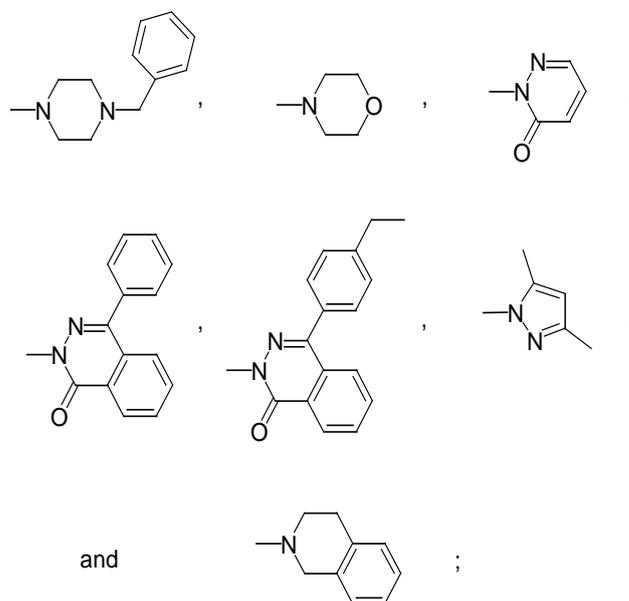
También, se prefieren medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, en la que

$X^a$  representa un resto  $-NR^{1a}R^{2a}$  o un resto  $-OR^{3a}$ ;

$R^{1a}$  representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en  $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-OH}$  y  $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-OH}$ ; un radical fenilo o pirrolilo no sustituido; un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, terc-butilo, metoxilo, F y Cl y dicho se une a través de un grupo alquileo seleccionado del grupo que consiste en  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ ,  $-\text{CH}(\text{fenilo})-$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2-$  y  $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-O}-$ ; un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en piridinilo, furanilo y pirrolilo, en los que dicho radical piridinilo, furanilo o pirrolilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, terc-butilo, metoxilo, F y Cl y dicho radical piridinilo, furanilo o pirrolilo se une a través de un grupo alquileo seleccionado del grupo que consiste en  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2-$  y  $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-O}-$ ; o un resto  $-\text{C}(=\text{O})\text{-R}^{12a}$ ;

$R^{2a}$  representa un átomo de hidrógeno o un radical metilo;

o



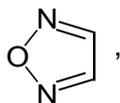
$R^{1a}$  y  $R^{2a}$  junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en

$R^{3a}$  representa un radical fenilo no sustituido;

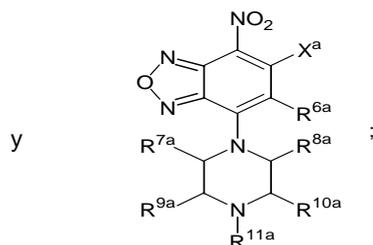
$R^{4a}$ ,  $R^{5a}$  y  $R^{6a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un átomo de flúor;

o

$R^{4a}$  y  $R^{5a}$  junto con los átomos de carbono puente forman el resto siguiente,



que junto con el anillo de fenilo al que se fusiona forma el sistema de anillo aromático bicíclico sustituido siguiente



R<sup>7a</sup> y R<sup>8a</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

R<sup>9a</sup> y R<sup>10a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical metilo;

5 R<sup>11a</sup> representa un átomo de hidrógeno; un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, n-butilo y  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{OH}$ ; un radical fenilo o piridinilo no sustituido, en los que dicho radical fenilo o piridinilo puede estar unido a través de un grupo  $-(\text{CH}_2)-$ ; un resto  $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{12a}$  o un resto  $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{13a}$ ;

10 R<sup>12a</sup> representa un radical metilo o un radical fenilo o un tiofenilo, en los que dicho radical fenilo o tiofenilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) del grupo que consiste en metilo y cloro;

R<sup>13a</sup> representa un radical metilo o un radical fenilo o un tiofenilo, en los que dicho radical fenilo o tiofenilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) del grupo que consiste en metilo y cloro;

15 y

R<sup>14a</sup> representa un radical metilo o un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 radical(es) metilo;

20 opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

25 Se prefiere particularmente medicamentos que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia, seleccionado del grupo que consiste en

[1] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-pirrol-1-il-etil)-amina,

30 [2] (4-Fluoro-bencil)-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,

[3] N-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-benzamida,

[4] N-Metil-N-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-benzamida,

35 [5] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-pirrol-1-il-amina,

[6] 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-2H-piridazin-3-ona,

40 [7] 1-Metil-4-(4-nitro-3-fenoxi-fenil)-piperazina,

[8] Bencil-[5-(4-butyl-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,

[9] Bencil-[2-nitro-5-(4-piridin-2-il-piperazin-1-il)-fenil]-amina y

45 [10] Bencil-[2-nitro-5-(4-fenil-2-il-piperazin-1-il)-fenil]-amina;

[11] Furan-2-il-metil-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,

50 [12] 2-[4-(4-Nitro-3-fenilamino-fenil)-piperazin-1-il]-etanol,

[13] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-(2-o-toliloxi-etil)-amina

[14] 2-[4-(3-bencilamino-4-nitro-fenil)-piperazin-1-il]-etanol,

55 [15] 4-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-morfolina,

[16] 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-4-fenil-2H-ftalazin-1-ona,

60 [17] [2-(4-Cloro-fenoxi)-etil]-[5-(3,5-dimetil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,

[18] 2-[4-[3-(Bencidril-amino)-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-etanol,

[19] 4-[4-Fluoro-5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-morfolina,

65 [20] 2-[2-Nitro-5-[4-(tolueno-4-sulfonyl)-piperazin-1-il]-fenil]-1,2,3,4-

- tetrahidro-isoquinolina,
- [21] 1-[3-(3,5-Dimetil-pirazol-1-il)-4-nitro-fenil]-4-metil-piperazina,
- 5 [22] Bencil-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,
- [23] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-fenetil-amina,
- [24] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-piridin-3-ilmetil-amina,
- 10 [25] (3-Cloro-fenil)-[4-[3-[(furanil-2-ilmetil)-amino]-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-metanona,
- [26] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-piridin-3-ilmetil-amina,
- 15 [27] 1-Bencil-4-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-piperazina,
- [28] Furan-2-ilmetil-[5-(4-metanosulfonil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 20 [29] Bencidril-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [30] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-(2-fenoksi-etil)-amina,
- 25 [31] 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-4-fenil-2H-ftalazin-1-ona,
- [32] 1-[3-(3,5-Dimetil-pirazol-1-il)-4-nitro-fenil]-piperazina,
- 30 [33] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-fenetil-amina,
- [34] [5-(4-Bencenosulfonil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-furan-2-ilmetil-amina,
- 35 [35] [2-(3,4-Dimetoksi-fenil)-etil]-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,
- [36] [4-[3-[(Furan-2-ilmetil)-amino]-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-m-tolil-metanona,
- 40 [37] [4-[3-[(Furan-2-ilmetil)-amino]-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-fenil-metanona,
- [38] [4-[3-(3,5-Dimetil-pirazol-1-il)-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-tiofen-2-il-metanona,
- 45 [39] 4-(4-Etil-fenil)-2-[5-[4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-2H-ftalalazin-1-ona,
- [40] 3-[7-(4-Metil-piperazin-1-il)-4-nitro-benzo[1,2,5]oxadiazol-5-ilamino]-propan-1-ol,
- 50 [41] 3-[4-Nitro-7-(4-fenil-piperazin-1-il)-benzo[1,2,5]oxadiazol-5-ilamino]-etan-1-ol,
- [42] 3-[4-Nitro-7-(4-piridin-piperazin-1-il)-benzo[1,2,5]oxadiazol-5-ilamino]-propan-1-ol,
- 55 [43] [2-(3,4-Dimetoksi-fenil)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 60 [44] [2-(3,4-Dimetil-fenil)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [45] [2-(4-terc-butil-fenoksi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-

fenil]-amina,

- 5 [46] [2-(4-Metoxi-fenoxi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [47] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-m-toliloxi-etil)-amina,
- [48] [2-(4-Cloro-fenoxi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 10 [49] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-(1-fenil-etil)-amina,
- [50] [2-(3-Metoxi-fenoxi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 15 [51] [2-(2-Metoxi-fenoxi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [52] (4-Cloro-bencil)-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,
- 20 [53] Bencil-[5-(4-bencil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [54] Bencil-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 25 [55] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-o-toliloxi-etil)-amina,
- [56] (4-Cloro-bencil)-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [57] Furan-2-ilmetil-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,
- 30 [58] [2-(4-Cloro-fenoxi)-etil]-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,
- [59] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(1-fenil-etil)-amina y
- 35 [60] 1-[4-(3-bencilamino-4-nitro-fenil)-piperazin-1-il]-etanona,
- [61] 2-[4-[3-(4-Methylpiperazin-1-yl)-4-nitrophenyl]piperazin-1-yl]ethanol,
- 40 [62] 2-[4-[3[2-(Naphthalen-2-yloxy)ethylamino]-4-nitrophenyl]piperazin-1-yl]ethanol,
- [63] 2-[4-(3-[[1-(1-Adamantyl)ethyl]amino]-4-nitrophenyl)piperazin-1-yl]ethanol y
- [64] 2-[4-[3-(3,4-Dimethoxyphenethylamino)-4-nitrophenyl]piperazin-1-yl]ethanol

45 opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

50 Dicho medicamento es particularmente adecuado para la regulación del receptor 5-HT<sub>6</sub> y, por lo tanto, para la profilaxis y/o tratamiento de un trastorno o enfermedad que está mediado al menos parcialmente a través de receptores 5-HT<sub>6</sub>.

55 Preferiblemente, dicho medicamento es adecuado para la profilaxis y/o tratamiento de un trastorno o enfermedad relacionada con la ingestión de alimentos, preferiblemente, para la regulación del apetito; para el mantenimiento, incremento o reducción del peso corporal; para la profilaxis y/o tratamiento de la obesidad, bulimia, anorexia, caquexia, diabetes tipo II (diabetes mellitus no insulino dependiente), preferiblemente, diabetes tipo II que está producida por obesidad; para la profilaxis y/o el tratamiento del accidente cerebrovascular; migraña; traumatismo craneal; epilepsia; síndrome del colon irritable; síndrome del intestino irritable; trastornos del sistema nervioso central; ansiedad; ataques de pánico; depresión; trastornos bipolares; trastorno obsesivo-compulsivo; trastornos cognitivos; disfunción cognitiva asociada con enfermedades psiquiátricas; trastornos de la memoria; demencia senil; trastornos del estado de ánimo; trastornos del sueño; psicosis; trastornos neurodegenerativos, preferiblemente seleccionados del grupo que consiste en enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Huntington y esclerosis múltiple; esquizofrenia; hipoxia intermitente crónica; convulsiones; trastorno de hiperactividad (ADHD, trastorno por déficit de atención / hiperactividad); para la mejora de la cognición (potenciamiento cognitivo) o memoria cognitiva (potenciamiento de la memoria cognitiva); para la profilaxis y/o el

tratamiento de la adicción y/o abstinencia de las drogas; para la profilaxis y/o el tratamiento de la adicción y/o abstinencia del alcohol; o para la profilaxis y/o el tratamiento de la adicción y/o abstinencia de la nicotina.

5 Más preferiblemente, dicho medicamento es adecuado para la profilaxis y/o tratamiento de un trastorno o enfermedad relacionado con la ingestión de alimentos, preferiblemente, para la regulación del apetito; para el mantenimiento, incremento o reducción del peso corporal; para la profilaxis y/o tratamiento de la obesidad, bulimia, anorexia, caquexia, diabetes tipo II (diabetes mellitus no insulino dependiente), preferiblemente, diabetes de tipo II que está producida por obesidad.

10 Además, más preferiblemente, dicho medicamento es adecuado para la mejora de la cognición (potenciamiento cognitivo) o la memoria cognitiva (potenciamiento de la memoria cognitiva).

15 Además, más preferiblemente dicho medicamento es adecuado para la profilaxis y/o el tratamiento de la adicción y/o abstinencia de las drogas; para la profilaxis y/o el tratamiento de la adicción y/o abstinencia del alcohol; o para la profilaxis y/o el tratamiento de la adicción y/o abstinencia de nicotina.

Lo más preferiblemente, dichos medicamento es adecuado para la profilaxis y/o el tratamiento de la obesidad y/o trastornos o enfermedades relacionados con la misma.

20 Cualquier medicamento según la presente invención puede estar en cualquier forma adecuada para la aplicación a seres humanos y/o animales, preferiblemente, seres humanos incluyendo bebés, niños y adultos. El medicamento puede producirse por procedimientos estándar conocidos por aquellos expertos en la técnica, por ejemplo a partir del índice de "Pharmaceutics: The Science of Dosage Forms", segunda edición, Aulton, M.E. (ED. Churchill Livingstone, Edimburgo (2002); "Encyclopedia of Pharmaceutical Technology", segunda edición, Swarbrick, J. y Boilan J.C. (Eds.), Marcel Dekker, Inc. Nueva York (2002); "Modern Pharmaceutics", cuarta edición, Banker G.S. y Rhodes C.T. (Eds.) Marcel Dekker, Inc. Nueva York 2002 y "The Theory and Practice of Industrial Pharmacy", Lachman L., Lieberman H. y Kanig J. (Eds.), Lea & Febiger, Filadelfia (1986). Las respectivas descripciones se incorporan en el presente documento como referencia y forman parte de la invención. La composición del medicamento puede variar en función de la vía de administración.

30 El medicamento de la presente invención puede, por ejemplo, administrarse por vía parenteral en combinación con vehículos líquidos inyectables convencionales, tales como agua o alcoholes adecuados. Los excipientes farmacéuticos convencionales para inyección, tales como agentes estabilizantes, agentes solubilizantes y tampones, pueden incluirse en tales composiciones inyectables. Estos medicamentos pueden, por ejemplo, inyectarse por vía intramuscular, vía intraperitoneal, o vía intravenosa.

40 Los medicamentos según la presente invención pueden también formularse en composiciones administrables por vía oral que contienen uno o más vehículos o excipientes fisiológicamente compatibles, en forma sólida o líquida. Estas composiciones pueden contener componentes convencionales tales como agentes de unión, cargas, lubricantes y agentes humectantes aceptables. Las composiciones pueden tomar cualquier forma conveniente, tales como comprimidos, microgránulos, gránulos, cápsulas, pastillas, disoluciones acuosas u oleosas, suspensiones, emulsiones, formas en polvo anhidras adecuadas para su reconstitución antes de su uso con agua u otro medio líquido adecuado, para la liberación inmediata o sostenida. Las formas multiparticuladas, tales como microgránulos o gránulos, pueden, por ejemplo, rellenarse en una cápsula, prepararse como comprimidos o suspenderse en un líquido adecuado.

50 En la técnica anterior, se conocen formulaciones de liberación sostenida adecuadas, los materiales y los métodos para su preparación, por ejemplo, los del índice de "Modified-Release Drug Delivery Technology", Rathbone, M.J. Hadgraft, J. y Roberts, M.S. (Eds.), Marcel Dekker, Inc., Nueva York (2002); "Handbook of Pharmaceutical Controlled Release Technology", Wise, D.L. (Ed.), Marcel Dekker, Inc. New York, (2000); "Controlled Drug Delivery", Vol, I, Basic Concepts, Bruck, S.D. (Ed.), CRD Press Inc., Boca Raton (1983) y de Takada, K. y Yoshikawa, H., "Oral Drug Delivery", Encyclopedia of Controlled Drug Delivery, Matiwitz, E. (Ed.), John Wiley & Sons, Inc., Nueva York (1999), Vol. 2, 728-742; Fix, J., "Oral drug delivery, small intestine and colon", Encyclopedia of Controlled Drug Delivery, Matiwitz, E. (Ed.), John Wiley & Sons, Inc., New York (1999), Vol. 2, 698-728. Las respectivas descripciones se incorporan en el presente documento como referencia y forman parte de la descripción.

60 Los medicamentos según la presente invención pueden también comprender un recubrimiento entérico, de manera que su disolución depende del valor de pH. Debido a dicho recubrimiento, el medicamento puede pasar el estómago sin disolverse y los compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos respectivos se liberan en el tracto intestinal. Preferiblemente, el recubrimiento entérico es soluble a un valor de pH de 5 a 7,5. En la técnica anterior, se conocen materiales y métodos adecuados para su preparación.

65 De manera habitual, los medicamentos según la presente invención pueden contener del 1-60 % en peso de uno o más compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos según se definen en el presente documento y del 40-99 % en peso de una o más sustancias auxiliares (aditivos).

Las formas orales líquidas para la administración pueden también contener ciertos aditivos como agentes edulcorantes, aromatizantes, conservantes y emulsionantes. Se pueden también formular composiciones líquidas no acuosas para la administración oral que contienen aceites comestibles. Tales composiciones líquidas pueden encapsularse convenientemente, por ejemplo, en cápsulas de gelatina en una cantidad de dosis unitaria.

5

Las composiciones de la presente invención se pueden también administrar por vía tópica o a través de un supositorio.

10

La dosis diaria para seres humanos y animales puede variar dependiendo de factores que se basan en sus respectivas especies u otros factores tales como la edad, sexo, peso o grado de la enfermedad, etc. La dosis diaria en seres humanos puede estar preferiblemente en el intervalo de 1 a 2000 mg, preferiblemente de 1 a 1500 mg, más preferiblemente de 1 a 1000 miligramos de principio activo para administrarse durante una o varias ingestiones al día.

15

Se prefiere el uso de al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general I o la dadas anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento de un trastorno o enfermedad relacionado con la ingestión de alimentos, preferiblemente para la regulación del apetito; para el mantenimiento, incremento o reducción del peso corporal; para la profilaxis y/o tratamiento de la obesidad, bulimia, anorexia, caquexia, diabetes tipo II (diabetes mellitus no insulino dependiente), más preferiblemente para la profilaxis y/o tratamiento de la obesidad.

20

25

Se prefiere el uso de al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general I o la dadas anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento del accidente cerebrovascular; migraña; traumatismo craneal; epilepsia; síndrome del colon irritable; síndrome del intestino irritable; trastornos del sistema nervioso central; ansiedad; ataques de pánico; depresión; trastornos bipolares; trastorno obsesivo-compulsivo; trastornos cognitivos; disfunción cognitiva asociada con enfermedades psiquiátricas; trastornos de la memoria; demencia senil; trastornos del estado de ánimo; trastornos del sueño; psicosis; trastornos neurodegenerativos, preferiblemente seleccionados del grupo que consiste en enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Huntington y esclerosis múltiple; esquizofrenia; hipoxia intermitente crónica; convulsiones; trastorno de hiperactividad (ADHD, trastorno por déficit de atención / hiperactividad).

30

35

40

Se prefiere también el uso de al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general I o la dadas anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo, para la fabricación de un medicamento para la mejora de la cognición (potenciamiento cognitivo) y/o para la mejora de la memoria cognitiva (potenciamiento de la memoria cognitiva).

45

50

Se prefiere también el uso de al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general I o la dadas anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o el tratamiento de la adicción y/o abstinencia de las drogas, preferiblemente, para la profilaxis y/o tratamiento de la adicción y/o abstinencia relacionadas con una o más de las drogas seleccionadas del grupo consituido por benzodicepinas, opioides naturales, semisintéticos o sintéticos como la cocaína, etanol y/o nicotina.

55

60

Se prefiere más el uso de al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general I o la dadas anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento de un trastorno o enfermedad relacionado con la ingestión de alimentos, preferiblemente para la regulación del apetito; para el mantenimiento, incremento o reducción del peso corporal; para la profilaxis y/o tratamiento de la obesidad, bulimia, anorexia, caquexia, diabetes tipo II (diabetes mellitus no insulino dependiente), más preferiblemente para la profilaxis y/o tratamiento de la obesidad.

65

Se prefiere más el uso de al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general I o la dadas anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o

diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo, para la fabricación de un medicamento para la mejora de la cognición (potenciamiento cognitivo) y/o para la mejora de la memoria cognitiva (potenciamiento de la memoria cognitiva).

5 Se prefiere más el uso de al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general I o la dadas anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o el tratamiento de la adicción y/o abstinencia de las drogas, preferiblemente, para la profilaxis y/o tratamiento de la adicción y/o abstinencia relacionadas con una o más de las drogas seleccionadas del grupo consituido por benzodicepinas, opioides naturales, semisintéticos o sintéticos como la cocaína, etanol y/o nicotina.

15 Lo que más se prefiere es el uso de al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general I o la dadas anteriormente, opcionalmente en forma de uno de sus, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o el tratamiento de la obesidad y/o trastornos o enfermedades relacionados con la misma.

A continuación, se describen métodos para determinar la actividad farmacológica de los compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos.

## 25 MÉTODOS FARMACOLÓGICOS:

### I) UNIÓN AL RECEPTOR DE LA SEROTONINA 5-HT<sub>6</sub>

30 La membranas celulares de células HEK-293 que expresan el receptor recombinante humano 5HT<sub>6</sub> fueron suministradas por Receptor Biology. En dichas membranas, la concentración de receptor es de 2,18 pmol/mg de proteína y la concentración de proteína es de 9,17 mg/ml. El protocolo experimental sigue el método de B. L. Roth et al. [B. L. Roth, S. C. Craigo, M. S. Choudhary, A. Uluer, F. J. Monsma, Y. Shen, H. Y. Meltzer, D. R. Sibley: Binding of Typical and Atypical Antipsychotic Agents to 5-Hydroxytryptamine-6 y Hydroxytryptamine -7 Receptors. The Journal of Pharmacology and Experimental Therapeutics, 1994, 268, 1403] con los siguientes cambios pequeños. La parte respectiva de la descripción de la bibliografía se incorpora en el presente documento como referencia y forma parte de la descripción.

40 Se diluye la membrana comercial (dilución 1:40) con el tampón de unión: Tris-HCl 50 mM, MgCl<sub>2</sub> 10 mM, EDTA 0,5 mM (pH 7,4). El radioligando usado es [<sup>3</sup>H]-LSD a un concentración de 2,7 nM con un volumen final de 200 µl. Se inicia la incubación añadiendo 100 µl de suspensión de membranas, (≈ 22,9 µg de proteína de membrana), y se prolonga durante 60 minutos a una temperatura de 37°C. Se finaliza la incubación por filtración rápida en un aparato de cultivo celular de Brandel a través de filtros de fibra de vidrio fabricados por Schleicher & Schuell GF 3362, pretratados con una disolución de polietilenimina al 0,5 %. Se lavan los filtros tres veces con tres mililitros de tampón Tris-HCl 50 mM, pH 7,4. Se transfieren los filtros a matraces y se añade a cada matraz 5 ml de la mezcla de centelleo líquido Ecoscint H. Se deja que los matraces alcancen el equilibrio durante varias horas antes del recuento con un contador de centelleo Wallac Winspectral 1414. Se determina la unión no específica en presencia de serotonina 100 µM. Se realizan las pruebas por triplicado. Se calcularon las constantes de inhibición (K<sub>i</sub>, nM) mediante un análisis de regresión no lineal usando el programa EBDA/LIGAND descrito en Munson y Rodbard, Analytical Biochemistry, 1980, 107, 220, cuya parte respectiva se incorpora en el presente documento como referencia y forma parte de la descripción.

### II.) MEDIDA DE LA INGESTIÓN DE ALIMENTOS (MODELO DE COMPORTAMIENTO):

55 Se usan ratas macho W (200-270 g) obtenidas de Harlan, S.A. Los animales se aclimatan en las instalaciones para los animales al menos durante 5 días antes de que se sometan a cualquier tratamiento. Durante este periodo los animales se alojan (en grupos de cinco) en jaulas translúcidas, y se les da agua y comida a voluntad. Al menos 24 horas antes de que comience el tratamiento, los animales se adaptan a unas condiciones de alojamiento individual.

60 Entonces, se determina el efecto agudo de los compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos según la presente invención en ratas en ayuno según se indica a continuación:

Las ratas están en ayuno durante 23 horas en sus jaulas individuales. Después de este periodo, se les administra a las ratas por vía oral o intraperitoneal una composición que comprende un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido o una composición correspondiente (vehículo) sin dicho compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido. Inmediatamente después de esto, se deja a la rata con alimentos pesados previamente y se mide la ingestión de alimentos acumulada tras 1, 2, 4 y 6 horas.

Dicho método de medida de ingestión de alimentos se describe también en las publicaciones bibliográficas de Kask et al., European Journal of Pharmacology 414 (2001), 215-224 and Turnbull et al., Diabetes, Vol. 51, August 2002. Las partes respectivas de las descripciones se incorporan en el presente documento como referencia y forman parte de la descripción.

La presente invención se ilustra a continuación con la ayuda de ejemplos. Estas ilustraciones se facilitan solamente a modo de ejemplo y no limitan el espíritu general de presente invención.

10 Ejemplos

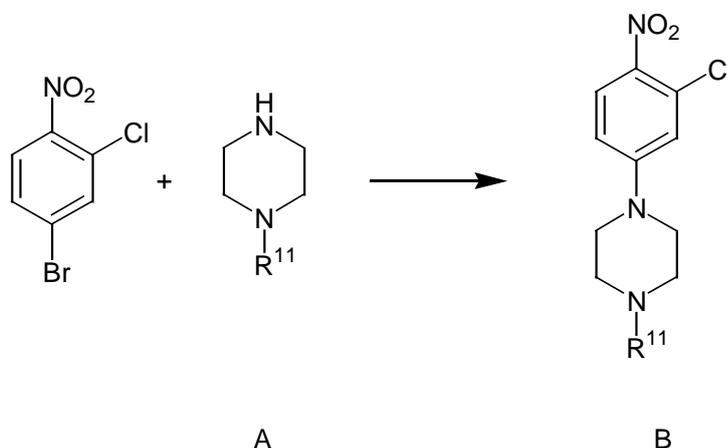
Abreviaturas

15	aq.	acuoso
	biph	bifenilo
	a	ancho
	d	doblete
	dba	dibencilidenacetona
	DCM	diclorometano
20	DME	1,2-dimetoxietano
	dppf	1,1-bis(difenilfosfino-ferroceno)
	AE	acetato de etilo
	eq.	equivalente
	h	horas
25	HPLC	cromatografía líquida de alta resolución
	m	multiplete
	MeOH	metanol
	OAc	acetato
	OrPent	terc-pentóxido
30	EP	éter de petróleo
	prep.	preparativa
	s	singlete
	t	triplete
	tBu	terc-butilo
35	THF	tetrahidrofurano
	CCF	cromatografía en capa fina
	xantphos	4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno

40 Preparación de compuestos de los ejemplos 1, 2, 5, 7, 8, 9 y 10

Etapa 1.

45 Se obtuvo el material de partida 4-bromo-2-cloro-1-nitro-benceno por oxidación a partir de 4-bromo-2-cloro-anilina según el método descrito en la bibliografía por A. McKillop et al., Tetrahedron 1987, 43, 1753.

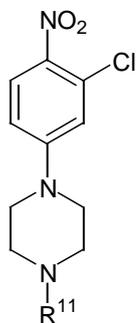


Un vial secado en horno, se cargó posteriormente con 0,05 eq. de  $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$ , 0,15 eq. de  $\text{dppf}$ , 1,0 eq. de 4-bromo-2-cloro-1-nitro-benceno y 1,25 eq. de *terc*-pentóxido de sodio. Se vació el vial y se purgó con argón y se añadieron THF y piperazina de fórmula general A (1,1 eq.). Se añadió THF en una cantidad para obtener una disolución 0,5 M de 4-bromo-2-cloro-1-nitro-benceno. Se selló el vial y se calentó hasta  $100^\circ\text{C}$  durante 3 h. La mezcla de reacción se disolvió en salmuera semisaturada y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Se redujo el volumen de las fases orgánicas combinadas a vacío y se extrajo con ácido clorhídrico al 5% en agua. La fase acuosa ácida se concentró, y se aisló el producto por HPLC preparativa. Para eliminar cualquier derivado de formiato de amonio formado durante la HPLC preparativa en RP18, el producto resultante se disolvió en cloroformo, se extrajo dos veces con  $\text{NaHCO}_3$  acuoso saturado, las fases acuosas combinadas se volvieron a extraer con cloroformo y las fases orgánicas combinadas se secaron sobre  $\text{MgSO}_4$  y se concentraron a vacío obteniendo el producto deseado.

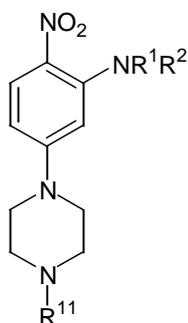
Dichos procesos se llevan a cabo según el método descrito en la referencia de J. F. Hartwig et al., J. Am. Chem. Soc. 1996, 118, 7217-7218. La parte respectiva de la descripción se incorpora en el presente documento como referencia y forma parte de la presente descripción.

15

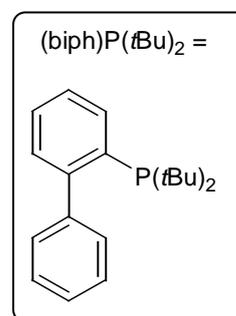
Etapa 2.



B



C



Un vial secado en horno, se cargó posteriormente con 0,1 eq. de una fuente de paladio [Pd], 0,2 eq. de  $(\text{biph})\text{P}(\text{tBu})_2$ , 1,0 eq. de haluro de arilo BI y 1.4 eq. de base. Se vació el vial y se purgó con argón, y se añadió la amina respectiva  $\text{HNR}^1\text{R}^2$  (1,3 eq.). Se añadió el disolvente para obtener una concentración de 1,0 M del haluro de arilo B. Se selló el vial y se calentó o bien hasta  $100^\circ\text{C}$  en caso de usar tolueno como el disolvente o  $110^\circ\text{C}$  en caso de usar DME como el disolvente, en cada caso durante 22 h. La mezcla se trató finalmente de forma diferente.

25

Tratamiento final 1:

La mezcla se filtró a través de una pipeta cargada con algodón hidrófilo y se montó directamente sobre una placa de CCF preparativa (placa de gel de sílice de 1 mm por cada 0,4 mmol de haluro de arilo de partida). Se eliminó el disolvente de reacción en una corriente fuerte de aire, y se logró la separación usando mezclas de éter de petróleo / acetato de etilo (EP/AE).

30

Tratamiento final 2:

La mezcla de reacción se transfirió a un matraz usando  $\text{H}_2\text{O}$  y  $\text{MeOH}$  y se redujo el volumen total a menos de 10 ml. Se logró la purificación por HPLC prep. Para eliminar cualquier derivado de formiato de amonio formado durante la HPLC preparativa, el producto resultante se disolvió en cloroformo, se extrajo dos veces con  $\text{NaHCO}_3$  acuoso saturado, las fases acuosas combinadas se volvieron a extraer con cloroformo y las fases orgánicas combinadas se secaron sobre  $\text{MgSO}_4$ .

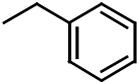
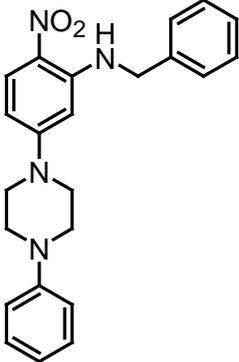
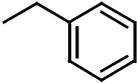
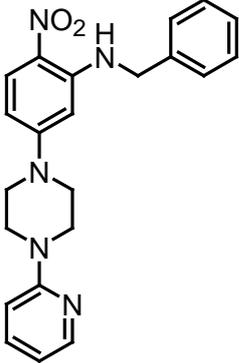
35

En la tabla 1, se enumeran las diferentes condiciones de reacción y los procedimientos de tratamiento final.

Dichos procesos se llevan a cabo según el método descrito en la referencia de S.L. Buchwald et al. J. Am. Chem. Soc. 2002, 124, 6043-6048. La parte respectiva de la descripción se incorpora en el presente documento como referencia y forma parte de la presente descripción.

40



10	Pd <sub>2</sub> dba <sub>3</sub>	NaOtPent	tolueno		H		2 + CCF prep. (CH <sub>2</sub> Cl <sub>2</sub> /Me OH 9:1)
9	Pd <sub>2</sub> dba <sub>3</sub>	NaOtPent	tolueno		H		4 + CCF prep. (CH <sub>2</sub> Cl <sub>2</sub> /Me OH 9:1)

Los espectros de <sup>1</sup>H-RMN para los compuestos de los ejemplos 1, 2, 5, 7, 8, 9 y 10 son tal como sigue:

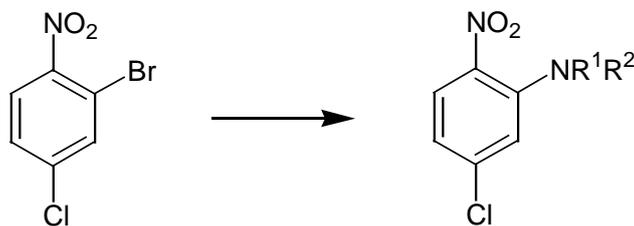
- 5      Compuesto 1. [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-pirrol-1-il-etil)-amina  
<sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 8,48 (s a, 1H), 8,06 (d, 1H), 6,71 (dd, 2H), 6,22 (dd, 1H), 6,17 (dd, 2H), 5,69 (d, 1H), 4,20 (dd, 2H), 3,62 (dd, 2H), 3,39 (dd, 4H), 2,54 (dd, 4H), 2,37 (s, 3H)
- 10      Compuesto 2. (4-Fluoro-bencil)-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina  
<sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 8,72 (s a, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,33 (t, 2H), 7,05 (t, 2H), 6,22 (dd, 1H), 5,82 (d, 1H), 4,85 (d, 2H), 3,36 (dd, 4H), 2,6 (s a, 4H), 2,41 (s, 3H)
- 15      Compuesto 5. [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-pirrol-1-il-amina  
<sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>/CD<sub>3</sub>OD): δ 8,17 (s, 1H), 8,10 (d, 1H), 6,76 (dd, 2H), 6,46 (dd, 1H), 6,25 (dd, 2H), 5,36 (d, 1H), 3,47 (dd, 4H), 3,10 (dd, 4H), 2,76 (s, 3H)
- 20      Compuesto 7. 1-Metil-4-(4-nitro-3-fenoxi-fenil)-piperazina  
<sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 8,06 (d, 1H), 7,35 (t, 2H), 7,14 (t, 1H), 7,00 (d a, 2H), 6,60 (dd, 1H), 6,34 (d, 1H), 3,30 (t, 4H), 2,48 (t, 4H), 2,32 (s, 3H)
- 25      Compuesto 8. Bencil-[5-(4-butyl-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina  
<sup>1</sup>H (300 MHz, d<sub>6</sub>-acetona): δ 8,78 (s a, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,46 (d, 2H), 7,38 (m, 2H), 7,31 (m, 1H), 6,38 (dd, 1H), 6,08 (d, 1H), 4,65 (d, 2H), 3,36 (t, 4H), 2,45 (t, 4H), 2,32 (t, 2H), 1,49 – 1,33 (m, 4H), 0,91 (t, 3H)
- 30      Compuesto 9. Bencil-[2-nitro-5-(4-piridin-2-il-piperazin-1-il)-fenil]-amina  
<sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 8,21 (s a, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,54 – 7,46 (m, 1H), 7,48 (d, 2H), 7,37 – 7,22 (m, 3H), 6,69 – 6,64 (m, 1H), 6,45 (dd, 1H), 6,24 (dd, 1H), 5,85 (d, 1H), 4,53 (d, 2H), 3,77 – 3,63 (m, 6H), 3,46 (m, 2H)
- 30      Compuesto 10. Bencil-[2-nitro-5-(4-fenil-2-il-piperazin-1-il)-fenil]-amina  
<sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 8,78 (s a, 1H), 8,14 (d, 1H), 7,47 – 7,27 (m, 10H), 6,24 (dd, 1H), 5,91 (d, 1H), 4,54 (d, 2H), 3,82 (m, 4H), 3,39 (m, 2H), 3,05 (m, 2H)

Preparación de los compuestos de los ejemplos 3, 4, 6 y 21

- 35      El material de partida 2-bromo-4-cloro-1-nitro-benceno se obtuvo por oxidación a partir de 2-bromo-4-cloro-anilina según un método descrito en la referencia de A. McKillop et al., Tetrahedron 1987, 43, 1753.

Etapas 1.

Preparación de compuestos intermedios 3-I, 4-I y 6-I



D

5 Un vial secado en horno, se cargó posteriormente con una fuente de paladio [Pd], xantphos (1,5 eq. de Pd), 1,0 eq. de 2-bromo-4-cloro-1-nitro-benceno, 1,1 eq. de amida  $\text{HNR}^1\text{R}^2$  y 1,4 eq. de base. Se vació el tubo, se purgó con argón y se añadió dioxano para obtener una concentración de 1,0 M para 2-bromo-4-cloro-1-nitro-benceno. Se selló el vial y se calentó hasta 110°C durante 21 h. La mezcla se trató finalmente de forma diferente.

Tratamiento final 1:

10 La mezcla se filtró a través de una pipeta cargada con algodón hidrófilo y se montó directamente sobre una placa de CCF preparativa (placa de gel de sílice de 1 mm por cada 0,4 mmol de haluro de arilo de partida). Se eliminó el disolvente de reacción en una corriente fuerte de aire, y se logró la separación usando mezclas de éter de petróleo / acetato de etilo (EP/AE).

15 Tratamiento final 2:

La mezcla de reacción se disolvió en salmuera semisaturada y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre  $\text{MgSO}_4$ , se concentraron y se purificaron por CCF preparativa (placa de gel de sílice de 1 mm por cada 0,4 mmol del haluro de arilo de partida) usando mezclas de EP/AE.

20 Tratamiento final 3:

La mezcla de reacción se transfirió a un matraz usando  $\text{H}_2\text{O}$  y MeOH. Se redujo el volumen total a menos de 10 ml y se logró la purificación por HPLC prep. Para eliminar cualquier derivado de formiato de amonio formado durante la HPLC preparativa en RP18, el producto resultante se disolvió en cloroformo, se extrajo dos veces con  $\text{NaHCO}_3$  acuoso saturado, las fases acuosas combinadas se volvieron a extraer con cloroformo y las fases orgánicas combinadas se secaron sobre  $\text{MgSO}_4$ .

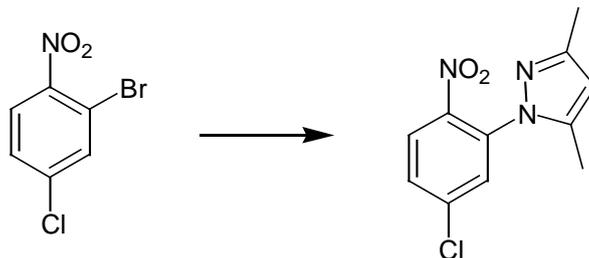
Dicho proceso se llevó a cabo según el método descrito en la referencia de S.L. Buchwald et al. J. Am. Chem. Soc. 2002, 124, 6043-6048. La parte respectiva de la descripción se incorpora en el presente documento como referencia y forma parte de la presente descripción.

30 En la tabla 2 siguiente, se enumeran las diferentes condiciones de reacción y los procedimientos de tratamiento final.

Tabla 2.

Ejemplo	[Pd] (eq.)	base	amida	Tratamiento final
4-I	$\text{Pd}(\text{OAc})_2$ (0,03)	$\text{Cs}_2\text{CO}_3$		1 (EP/AE = 5:1) o 2
3-I	$\text{Pd}(\text{OAc})_2$ (0,06)	$\text{Cs}_2\text{CO}_3$		2 (EP/AE = 4:1)
6-I	$\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ (0,02)	$\text{K}_3\text{PO}_4$		3

Preparación del compuesto intermedio 21-I

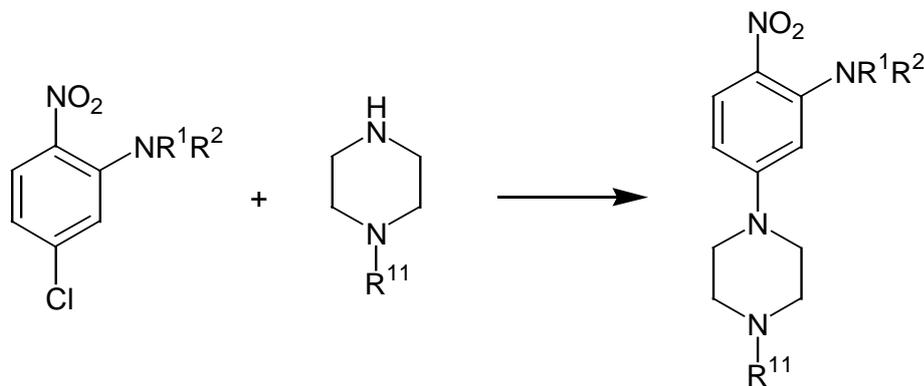


5 Un vial secado en horno, se cargó posteriormente con 0,1 eq. de CuI, 1,0 eq. de 2-bromo-4-cloro-1-nitro-benceno, 1,2 eq. de 3,5-dimetilpirazol y 2,1 eq. de K<sub>3</sub>PO<sub>4</sub>. Se vació el vial, y se purgó con argón y se añadieron 0,3 eq. de *trans*-1,2-diaminometil-ciclohexano. Se añadió tolueno para obtener una concentración de 1,0 M para 2-bromo-4-cloro-1-nitro-benceno. El vial se secó y se calentó hasta 110°C durante 21 h.

10 La mezcla se filtró a través de una pipeta cargada con algodón hidrófilo y se montó directamente sobre una placa de CCF preparativa (placa de gel de sílice de 1 mm por cada 0,4 mmol de haluro de arilo de partida). Se eliminó el disolvente de reacción en una corriente fuerte de aire, y se logró la separación usando mezclas de éter de petróleo / acetato de etilo (EP/AE 5:1 volumen / volumen).

15 Dicho proceso se llevó a cabo según el método descrito en la referencia de S.L. Buchwald et al. J. Am. Chem. Soc. 2002, 124, 11684-11688. La parte respectiva de la descripción se incorpora en el presente documento como referencia y forma parte de la presente descripción.

Preparación de los compuestos de los ejemplos 4, 5, 6 y 21



D

A

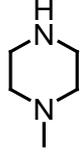
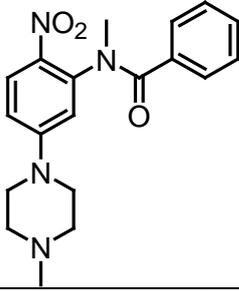
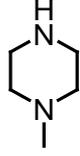
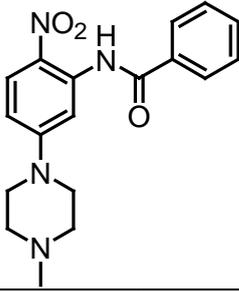
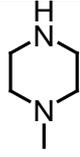
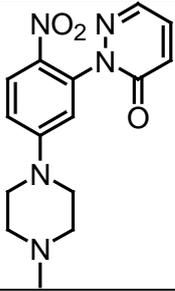
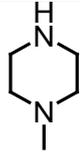
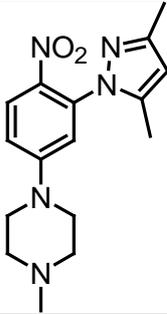
C

20 Un vial secado en horno, se cargó posteriormente con 0,1 eq. de una fuente de paladio [Pd], 0,2 eq. (biph)P(*t*Bu)<sub>2</sub>, 1,0 eq. de haluro de arilo D y 1,4 eq. de base. Se vació el vial y se purgó con argón y se añadió la piperazina respectiva A (1,3 eq.). Se añadió el disolvente para obtener una disolución 1,0 M del haluro de arilo D. Se selló el vial y se calentó hasta 100°C en caso de usar tolueno como disolvente o 110°C en caso de usar DME como disolvente, en cada caso durante 22 h. La mezcla de reacción se transfirió a un matraz usando H<sub>2</sub>O y MeOH y el volumen total se redujo a menos de 10 mL. Se logró la purificación por HPLC preparativa en RP18. Para eliminar cualquier derivado de formiato de amonio formado durante la HPLC preparativa, el producto resultante se disolvió en cloroformo, se extrajo dos veces con NaHCO<sub>3</sub> acuoso saturado, las fases acuosas combinadas se volvieron a extraer con cloroformo y las fases orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO<sub>4</sub>.

30 Dicho proceso se llevó a cabo según el método descrito en la referencia de S.L. Buchwald et al. J. Am. Chem. Soc. 2002, 124, 6043-6048. La parte respectiva de la descripción se incorpora en el presente documento como referencia y forma parte de la presente descripción.

35 En la tabla 3 a continuación, se enumeran las diferentes condiciones de reacción.

Tabla 3.

Ejemplo	[Pd]	base	disolvente	amina	producto
4	Pd(OAc) <sub>2</sub>	K <sub>3</sub> PO <sub>4</sub>	DME		
3	Pd(OAc) <sub>2</sub>	K <sub>3</sub> PO <sub>4</sub>	DME		
6	Pd(OAc) <sub>2</sub>	K <sub>3</sub> PO <sub>4</sub>	DME		
21	Pd <sub>2</sub> dba <sub>3</sub>	NaOtPent	tolueno		

5 Los espectros de <sup>1</sup>H-RMN para los compuestos de los ejemplos 3, 4 y 6 son como sigue:

Compuesto 3. N-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-benzamida

<sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 12,02 (s, 1H), 8,59 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 8,02 – 7,99 (m, 2H), 7,60 – 7,50 (m, 3H), 6,57 (dd, 1H), 3,57 (dd, 4H), 2,58 (dd, 4H), 2,38 (s, 3H)

10

Compuesto 4. N-Metil-N-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-benzamida

<sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 7,94 (s a, 1H), 7,28 – 7,18 (m, 5H), 6,63 (s a, 1H), 6,45 (s a, 1H), 3,38 (s a, 3H), 3,29 (s a, 4H), 2,48 (s a, 4H), 2,33 (s, 3H)

15

Compuesto 6. 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-2H-piridazin-3-ona

<sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 8,16 (d, 1H), 7,87 (dd, 1H), 7,28 (dd, 1H), 7,03 (dd, 1H), 6,88 (dd, 1H), 6,79 (d, 1H), 3,45 (t, 4H), 2,54 (t, 4H), 2,35 (s, 3H)

20

Compuesto 21. 1-[3-(3,5-Dimetil-pirazol-1-il)-4-nitro-fenil]-4-metil-piperazina

Según esto, se han preparado los compuestos de los ejemplos 11 a 20 y 22 a 60. Los expertos en la técnica conocerán qué materiales de partida se usaron para obtener los compuestos respectivos.

- 5 [11] Furan-2-ilmetil-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,  
 [12] 2-[4-(4-Nitro-3-fenetilamino-fenil)-piperazin-1-il]-etanol,  
 [13] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-(2-o-toliloxi-etil)-amina  
 10 [14] 2-[4-(3-bencilamino-4-nitro-fenil)-piperazin-1-il]-etanol,  
 [15] 4-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-morfolina,  
 15 [16] 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-4-fenil-2H-ftalazin-1-ona  
 [17] [2-(4-Cloro-fenoxi)-etil]-[5-(3,5-dimetil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,  
 20 [18] 2-[4-[3-(Bencidril-amino)-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-etanol,  
 [19] 4-[4-Fluoro-5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-morfolina,  
 [20] 2-[2-Nitro-5-[4-(tolueno-4-sulfonil)-piperazin-1-il]-fenil]-1,2,3,4-tetrahidro-isoquinolina,  
 25 [22] Bencil-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,  
 [23] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-fenetil-amina,  
 30 [24] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-piridin-3-ilmetil-amina,  
 [25] (3-Cloro-fenil)-[4-[3-[(furanil-2-ilmetil)-amino]-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-metanona,  
 35 [26] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-piridin-3-ilmetil-amina,  
 [27] 1-Bencil-4-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-piperazina,  
 40 [28] Furan-2-ilmetil-[5-(4-metanosulfonil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,  
 [29] Bencidril-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,  
 45 [30] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-(2-fenoxi-etil)-amina,  
 [31] 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-4-fenil-2H-ftalazin-1-ona,  
 [32] 1-[3-(3,5-Dimetil-pirazol-1-il)-4-nitro-fenil]-piperazina,  
 50 [33] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-fenetil-amina,  
 [34] [5-(4-Bencenosulfonil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-furan-2-ilmetil-amina,  
 55 [35] [2-(3,4-Dimetoxi-fenil)-etil]-[2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil]-amina,  
 [36] [4-[3-[(Furan-2-ilmetil)-amino]-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-m-tolil-metanona,  
 60 [37] [4-[3-[(Furan-2-ilmetil)-amino]-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-fenil-metanona,  
 [38] [4-[3-(3,5-Dimetil-pirazol-1-il)-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-tiofen-2-il-metanona,  
 65 [39] 4-(4-Etil-fenil)-2-[5-[4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-2H-

- ftalalazin-1-ona,
- 5 [40] 3-[7-(4-Metil-piperazin-1-il)-4-nitro-benzo[1,2,5]oxadiazol-5-ilamino]-propan-1-ol,
- [41] 3-[4-Nitro-7-(4-fenil-piperazin-1-il)-benzo[1,2,5]oxadiazol-5-ilamino]-etan-1-ol,
- 10 [42] 3-[4-Nitro-7-(4-piridin-piperazin-1-il)-benzo[1,2,5]oxadiazol-5-ilamino]-propan-1-ol,
- [43] [2-(3,4-Dimetoxi-fenil)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 15 [44] [2-(3,4-Dimetil-fenil)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [45] [2-(4-terc-butil-fenoxi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 20 [46] [2-(4-Metoxi-fenoxi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [47] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-m-toliloxi-etil)-amina,
- 25 [48] [2-(4-Cloro-fenoxi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [49] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-(1-fenil-etil)-amina,
- 30 [50] [2-(3-Metoxi-fenoxi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [51] [2-(2-Metoxi-fenoxi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 35 [52] (4-Cloro-bencil)-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,
- [53] Bencil-[5-(4-bencil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 40 [54] Bencil-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [55] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-o-toliloxi-etil)-amina,
- 45 [56] (4-Cloro-bencil)-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [57] Furan-2-ilmetil-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,
- [58] [2-(4-Cloro-fenoxi)-etil]-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,
- 50 [59] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(1-fenil-etil)-amina y
- [60] 1-[4-(3-bencilamino-4-nitro-fenil)-piperazin-1-il]-etanona.
- 55 [61] 2-[4-[3-(4-Methylpiperazin-1-yl)-4-nitrophenyl]piperazin-1-yl]ethanol,
- [62] 2-[4-[3[2-(Naphthalen-2-yloxy)ethylamino]-4-nitrophenyl]piperazin-1-yl]ethanol,
- [63] 2-[4-(3-[[1-(1-Adamantyl)ethyl]amino]-4-nitrophenyl)piperazin-1-yl]ethanol y
- 60 [64] 2-[4-[3-(3,4-Dimethoxyphenethylamino)-4-nitrophenyl]piperazin-1-yl]ethanol

**Datos farmacológicos:**

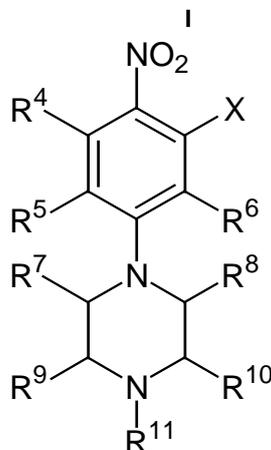
- 65 Se determinó la unión de los compuestos de fenilpiperazina nitro-sustituidos al receptor 5-HT<sub>6</sub> según se ha descrito anteriormente.

A continuación, en la tabla se facilitan los resultados de unión para algunos de estos compuestos:

<b>Compuesto según ejemplo:</b>	<b>K<sub>i</sub> (nM)</b>
2	172,4
5	480,8
7	26,6
11	61,2
12	6332,2
13	162,5
15	2710,1
16	732,0
17	5002,7
21	249,5
22	27,5
23	118,5
24	1266,7
26	1511,5
27	3778,8
29	4489,0
30	114,1
31	1710,1
32	481,8
33	33,1
45	80,3
46	245,2
51	19,1
52	8,3
53	34,3
55	26,1
56	59,0
57	25,0
58	289,9
59	11,9

## REIVINDICACIONES:

1. Compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general I,



5

en la que

X representa un resto  $-NR^1R^2$  o un resto  $-OR^3$ ;

10

$R^1$  representa un radical cicloalifático de 3 a 9 miembros saturado o insaturado, que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-O- alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -C(=O)-N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo  $C_{1-5}$ , fenilo -S(=O)<sub>2</sub>-, fenilo, fenoxilo y bencilo y que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo y que está unido a través de un grupo lineal o ramificado alquileno  $C_{1-6}$ , alquenileno  $C_{2-6}$  o alquilileno  $C_{2-6}$  que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -NH-(alquilo  $C_{1-5}$ ) y -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>;

15

20

con la codición de que  $R^1$  no representa un radical tetrahydrofurano;

25

un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -C(=O)-N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo  $C_{1-5}$ , -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

30

35

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)-$  y puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -C(=O)-N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo  $C_{1-5}$ , -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

40

45

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)_2-$  y/o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -

SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> y/o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

o

un resto -C(=O)-R<sup>12</sup>;

R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>; o

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un anillo heterocíclico de 3 a 6 miembros saturado o insaturado, pero no aromático, que contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) adicional(es) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno y azufre como miembro(s) del anillo y que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, oxo (=O), tioxo (=S), -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

R<sup>3</sup> representa un radical de 5 a 10 miembros de arilo o heteroarilo, que puede estar no sustituido o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que puede estar unido a través de un grupo lineal o ramificado alquilenilo C<sub>1-6</sub>, alquenileno C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;

R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;

R<sup>11</sup> representa un radical alifático C<sub>1-10</sub> grupo lineal o ramificado, saturado o insaturado, no sustituido o un radical de 5 a 10 miembros de arilo o heteroarilo que puede estar no sustituido o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

con la codición de que R<sup>11</sup> no representa un radical tiazolilo

y

R<sup>12</sup>

representa un radical arilo de 5 a 10 miembros que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo que puede estar no sustituido o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

o

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, que puede estar no sustituido o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que está unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>;

con la condición de que se excluye el compuesto siguiente

(1) Bencil-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina

opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

2. Compuesto según la reivindicación 1, caracterizado porque

X representa un resto -NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> o un resto -OR<sup>3</sup>;

R<sup>1</sup>

representa un radical (hetero)cicloalifático seleccionado del grupo que consiste en ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclopentenilo, ciclohexilo, ciclohexenilo, cicloheptilo, cicloheptenilo, ciclooctilo, ciclooctenilo, ciclononilo, imidazolidinilo, aziridinilo, azetidino, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, piperazinilo, pirazolidinilo, tetrahidrotiofenilo y azepanilo, que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, fenilo -S(=O)<sub>2</sub>, fenilo, fenoxilo y bencilo y que está unido a través de un grupo alquilenilo C<sub>1-6</sub>, alquenileno C<sub>2-6</sub> o alquilileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado que puede estar no sustituido o sustituido con con 1, 2 o 3 sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;

un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, fenilo -S(=O)<sub>2</sub>, fenilo, fenoxilo y bencilo;

5 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)-$  y puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O-C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ , F, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-C(=O)-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-S(=O)_2$ -alquilo  $C_{1-5}$ , fenilo  $-S(=O)_2$ , fenilo, fenoxilo y bencilo

10 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)_2-$  y/o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O-C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-C(=O)-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-S(=O)_2$ -alquilo  $C_{1-5}$ , fenilo  $-S(=O)_2$ , fenilo, fenoxilo y bencilo;

20 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo  $-(CH_2)_3-$  y/o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O-C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-C(=O)-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-S(=O)_2$ -alquilo  $C_{1-5}$ , fenilo  $-S(=O)_2$ , fenilo, fenoxilo y bencilo;

30 o

un resto  $-C(=O)-R^{12}$ ;

35  $R^2$  representa un átomo de hidrógeno o un radical alifático  $C_{1-10}$  lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ) y  $-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>; o

40  $R^1$  y  $R^2$  junto con el átomo de nitrógeno puente forman un anillo heterocíclico de 3 a 6 miembros saturado o insaturado, pero no aromático, que contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) adicional(es) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno y azufre como miembro(s) del anillo y que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-5}$ , oxo ( $=O$ ), tioxo ( $=S$ ),  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O-C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-C(=O)-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-S(=O)_2$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S(=O)_2$ -fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

50  $R^3$  representa un radical de 5 a 10 miembros de arilo o heteroarilo, que puede estar no sustituido o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O-C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-C(=O)-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-S(=O)_2$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S(=O)_2$ -fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que puede estar unido a través de un grupo lineal o ramificado alquilenilo  $C_{1-6}$ , alquenileno  $C_{2-6}$  o alquinileno  $C_{2-6}$  que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ) y  $-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub> y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

60  $R^4$ ,  $R^5$  y  $R^6$  representa cada uno un átomo de hidrógeno;

65  $R^7$  y  $R^8$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático  $C_{1-10}$  lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ) y  $-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>;

R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;

R<sup>11</sup> representa un radical alifático C<sub>1-10</sub> grupo lineal o ramificado, saturado o insaturado, no sustituido arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, fenilo -S(=O)<sub>2</sub>-, fenilo, fenoxilo y bencilo;

y

R<sup>12</sup> representa un radical arilo de 5 a 10 miembros que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo que puede estar no sustituido o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

o

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, que puede estar no sustituido o puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que está unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>-;

opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

3. Compuesto según la reivindicación 1 o 2, caracterizado porque R<sup>1</sup> representa

un radical (hetero)cicloalifático seleccionado del grupo que consiste en ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclopentenilo, ciclohexilo, ciclohexenilo, cicloheptilo, cicloheptenilo, ciclooctilo, ciclooctenilo, ciclónonilo, imidazolidinilo, aziridinilo, azetidino, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, piperazinilo, pirazolidinilo, tetrahidrotiofenilo y azepanilo, en los que dicho radical (hetero)cicloalifático puede unirse a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>- y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>,

5 un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>,

15 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>,

30 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>,

40 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>- y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>,

o

55 un resto -C(=O)-R<sup>12</sup>;

preferiblemente, R<sup>1</sup> representa

60 un radical pirrolilo no sustituido;

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y pirrolilo, en los que dicho radical fenilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- y dicho radical pirrolilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- y/o dicho radical fenilo o pirrolilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -

S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>,

un resto -C(=O)-R<sup>12</sup>;

más preferiblemente, R<sup>1</sup> representa un radical pirrolilo no sustituido;

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y pirrolilo, en los que dicho radical fenilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)- y dicho radical pirrolilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- y/o dicho radical fenilo o pirrolilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, F, Br e I o

un resto -C(=O)-R<sup>12</sup>.

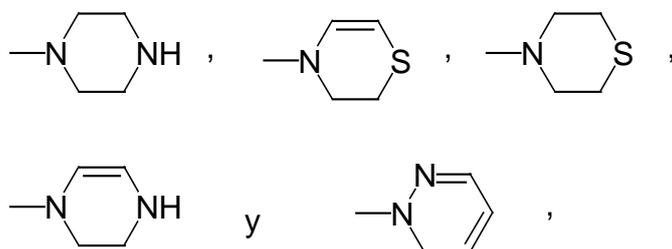
4. Compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque

R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado;

preferiblemente R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

más preferiblemente R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical metilo.

5. Compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en



en los que cada uno de esos restos cíclicos antes mencionados puede estar sustituidos en cualquier posición, incluyendo los grupos -NH, con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

preferiblemente, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto piridazin-3-ona que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, fenilo, fenoxilo y bencilo;

más preferiblemente, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto piridazin-3-ona no sustituido.

6. Compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque

R<sup>3</sup> representa un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o

heteroarilo puede estar unido a través de un grupo  $-(CH_2)_{1, 2 \text{ o } 3}$  y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

preferiblemente, R<sup>3</sup> representa un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

más preferiblemente, R<sup>3</sup> representa un radical fenilo no sustituido.

7. Compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizado porque R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido;

preferiblemente, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

más preferiblemente, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno.

8. Compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizado porque R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido;

preferiblemente, R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

más preferiblemente, R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno.

9. Compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizado porque

R<sup>11</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo; o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, piridinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

preferiblemente, R<sup>11</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo y n-butilo; o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y piridinilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

más preferiblemente, R<sup>11</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo y n-butilo; o un radical fenilo o piridinilo no sustituido.

5 10. Compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizado porque

10 R<sup>12</sup> representa un radical arilo de 5 a 10 miembros de carbono que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

20 un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

30 o

35 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1, 2 o 3</sub>- y/o puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

45 preferiblemente, R<sup>12</sup> representa un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

50 más preferiblemente, R<sup>12</sup> representa un radical fenilo no sustituido.

55 11. Compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 10, caracterizado porque

X representa un resto -NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> o un resto -OR<sup>3</sup>;

60 R<sup>1</sup> representa un radical pirrolilo no sustituido; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y pirrolilo, en los que dicho radical fenilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- y dicho radical pirrolilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- y/o dicho radical fenilo o pirrolilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>,

-C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> o un resto -C(=O)-R<sup>12</sup>;

5

R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

o

10

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto piridazin-3-ona que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, fenilo, fenoxilo y bencilo;

15

R<sup>3</sup> representa un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

20

25

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

30

R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

35

R<sup>11</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo y n-butil; o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y piridinilo, en los que dicho arilo o heteroarilo pueden estar sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

40

y

45

R<sup>12</sup> representa un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>.

50

12. Compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 11, caracterizado porque

55

X representa un resto -NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> o un resto -OR<sup>3</sup>;

R<sup>1</sup> representa un radical pirrolilo no sustituido; un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y pirrolilo, en los que dicho radical fenilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- y dicho radical pirrolilo se une a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- y/o dicho radical fenilo o pirrolilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, F, Br e I o un resto -C(=O)-R<sup>12</sup>;

60

R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical metilo;

65

o

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto piridazin-3-ona no sustituido;

R<sup>3</sup> representa un radical fenilo no sustituido;

5

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

10

R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup> representa cada uno un átomo de hidrógeno;

R<sup>11</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo y n-butilo; o un radical fenilo o piridinilo no sustituido

15

y

R<sup>12</sup> representa un radical fenilo no sustituido.

13. Compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 12, seleccionado del grupo que consiste en

20

[1] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-pirrol-1-il-etil)-amina,

[2] (4-Fluoro-bencil)-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,

25

[3] N-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-benzamida,

[4] N-Metil-N-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-benzamida,

30

[5] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-pirrol-1-il-amina,

[6] 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-2H-piridazin-3-ona,

[7] 1-Metil-4-(4-nitro-3-fenoxi-fenil)-piperazina,

35

[8] Bencil-[5-(4-butil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,

[9] Bencil-[2-nitro-5-(4-piridin-2-il-piperazin-1-il)-fenil]-amina y

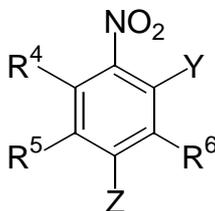
40

[10] Bencil-[2-nitro-5-(4-fenil-2-il-piperazin-1-il)-fenil]-amina;

opcionalmente en forma de una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

14. Procedimiento para la preparación de un compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, caracterizado porque al menos un compuesto nitrobenzeno de fórmula general II,

45

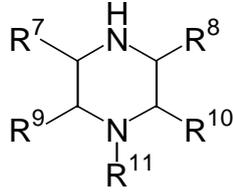


II

en la que R<sup>4</sup> a R<sup>6</sup> tienen el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, Y representa un átomo de cloro, y Z representa un átomo de bromo o yodo; se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general III,

50

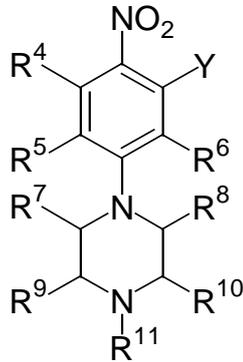
en la que  $R^7$  a  $R^{11}$  tienen el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, en un medio de



III

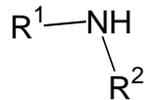
5

reacción adecuado, preferiblemente en presencia de al menos un catalizador y/o al menos un agente auxiliar y/o al menos una base para dar un compuesto de fórmula general IV,



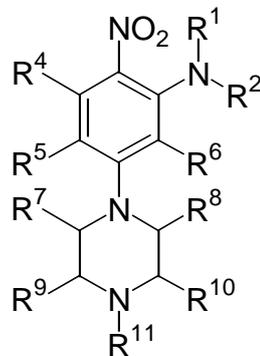
IV

en la que  $R^4$  a  $R^{11}$  tienen el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 13 e  $Y$  representa un átomo de cloro; que se purifica y/o aísla opcionalmente, y el compuesto de fórmula general IV se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general V,



V

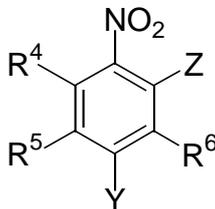
en la que  $R^1$  y  $R^2$  tienen el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, en un medio de reacción adecuado, preferiblemente en presencia de al menos un catalizador y/o al menos un agente auxiliar y/o al menos una base para dar un compuesto de fórmula general VI,



VI

en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^4$  a  $R^{11}$  tienen el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, que se purifica y/o aísla opcionalmente.

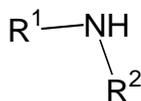
15. Procedimiento para la preparación de un compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, caracterizado porque al menos un compuesto nitrobenzeno de fórmula general VII,



VII

5

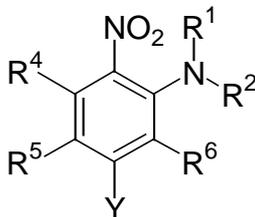
en la que  $R^4$  a  $R^6$  tienen el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, Z representa un átomo de bromo o yodo, e Y representa un átomo de cloro, se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general V,



V

10

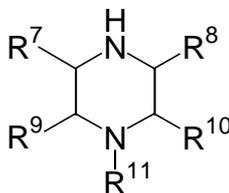
en la que  $R^1$  y  $R^2$  tienen el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, en un medio de reacción adecuado, preferiblemente en presencia de al menos un catalizador y/o al menos un agente auxiliar y/o al menos una base para dar un compuesto de fórmula general VIII,



VIII

15

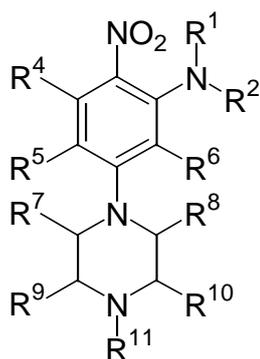
en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^4$  a  $R^6$  tienen el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 13 e Y representa un átomo de cloro; que se purifica y/o aísla opcionalmente, y el compuesto de fórmula general VIII se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general III,



III

20

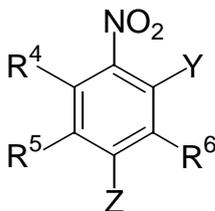
en la que  $R^7$  a  $R^{11}$  tienen el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 12, en un medio de reacción adecuado, preferiblemente en presencia de al menos un catalizador y/o al menos un agente auxiliar y/o al menos una base para dar un compuesto de fórmula general VI,



VI

en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>4</sup> a R<sup>11</sup> tienen el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, que se purifica y/o aísla opcionalmente.

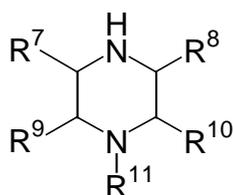
- 5 16. Procedimiento para la preparación de un compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, caracterizado porque al menos un compuesto nitrobenzeno de fórmula general II,



II

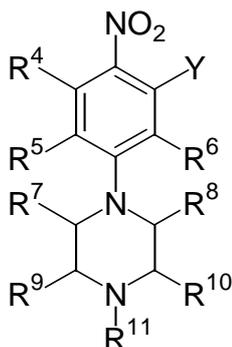
en la que R<sup>4</sup> a R<sup>6</sup> tienen el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, Y representa un átomo de cloro, y Z representa un átomo de bromo o yodo; se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general III,

10



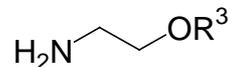
III

en la que R<sup>7</sup> a R<sup>11</sup> tienen el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, en un medio de reacción adecuado, preferiblemente en presencia de al menos un catalizador y/o al menos un agente auxiliar y/o al menos una base para dar un compuesto de fórmula general IV,



IV

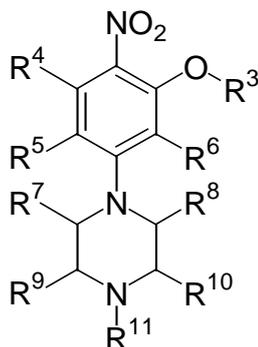
en la que R<sup>4</sup> a R<sup>11</sup> tienen el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 13 e Y representa un átomo de cloro; que se purifica y/o aísla opcionalmente, y el compuesto de fórmula general IV se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general IX,



IX

5

en la que R<sup>3</sup> tiene el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, en un medio de reacción adecuado, preferiblemente en presencia de al menos un catalizador y/o al menos un agente auxiliar y/o al menos una base para dar un compuesto de fórmula general X,

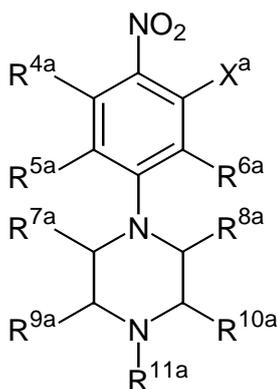


X

10

en la que R<sup>3</sup> a R<sup>11</sup> tienen el significado según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, que se purifica y/o aísla opcionalmente.

17. Medicamento que comprenden al menos un compuesto de fenilpiperazina nitro-sustituido de fórmula general Ia,



15

Ia

en la que

20

X<sup>a</sup> representa un resto -NR<sup>1a</sup>R<sup>2a</sup> o un resto -OR<sup>3a</sup>,

25

R<sup>1a</sup> representa un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;

Un radical seleccionado del grupo que consiste en adamantilo, biciclo[2.2.1]heptilo y biciclo[3.1.1]heptilo que puede estar sustituido con 1,2, o 3 sustituyente(s) independientemente seleccionado del grupo que consiste en en oxo (=O), tioxo (=S), alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -

C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O- alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo y/o está a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub> lineal o ramificado que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) independientemente seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno o azufre como miembro(s) de la cadena;

un radical cicloalifático de 3 a 9 miembros saturado o insaturado, que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que está unido a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub>, alquilenilo C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, fenilo, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y/o que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

un radical arilo o heteroarilo de 5 a 10 miembros que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y en los que dicho radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

un radical arilo de 5 a 10 miembros en los que dicho radical arilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y dicho radical arilo se une a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub>, alquilenilo C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, fenilo, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) de la cadena;

un radical heteroarilo de 5 a 10 miembros, que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que está unido a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub>, alquilenilo C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, fenilo, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) de la cadena y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

o un resto -C(=O)-R<sup>12a</sup>;

R<sup>2a</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH-(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;

o

- 5  $R^{1a}$  y  $R^{2a}$  junto con el nitrógeno puente forman un anillo heterocíclico saturado, insaturado o aromático de 3 a 6 miembros que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , oxo (=O), tioxo (=S), -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -C(=O)-N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo  $C_{1-5}$ , -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) adicional(es) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo y/o que puede estar condensado con un sistema de anillo mono o bicíclico que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , oxo (=O), tioxo (=S), -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -C(=O)-N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo  $C_{1-5}$ , -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo puede estar no sustituido o sustituido por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>;
- 10
- 15
- 20 en los que los anillos del sistema de anillo son de 5, 6 o 7 miembros y pueden contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre;
- 25  $R^{3a}$  representa un radical de 5 a 10 miembros de arilo o heteroarilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , -C(=O)-O-alquilo  $C_{1-5}$ , -O-C(=O)-alquilo  $C_{1-5}$ , F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH(alquilo  $C_{1-5}$ ), -C(=O)-N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo  $C_{1-5}$ , -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que puede estar unido a través de un grupo alquilenilo  $C_{1-6}$ , alquenileno  $C_{2-6}$  o alquinileno  $C_{2-6}$  lineal o ramificado y que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -NH-(alquilo  $C_{1-5}$ ) y -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub> y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;
- 30
- 35
- 40  $R^{4a}$ ,  $R^{5a}$  y  $R^{6a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un átomo halógeno;
- o
- 45  $R^{4a}$  y  $R^{5a}$  junto con los átomos de carbono puente forman un anillo heterocíclico no sustituido de 5 o 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo y que junto con el anillo de fenilo al que se fusiona forma un sistema de anillo aromático bicíclico de 9 o 10 miembros;
- 50  $R^{7a}$  y  $R^{8a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático  $C_{1-10}$  lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -NH-(alquilo  $C_{1-5}$ ) y -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>;
- 55  $R^{9a}$  y  $R^{10a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alifático  $C_{1-10}$  lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -NH-(alquilo  $C_{1-5}$ ) y -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>;
- 60  $R^{11a}$  representa un átomo de hidrógeno; un radical alifático  $C_{1-10}$  lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo  $C_{1-5}$ , -S-alquilo  $C_{1-5}$ , -NH-(alquilo  $C_{1-5}$ ) y -N(alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub> y que puede contener 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) de la cadena;
- 65 un radical de 5 a 10 miembros de arilo o heteroarilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ , -O-

alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que puede estar unido a través de un grupo alquilenilo C<sub>1-6</sub>, alquenileno C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo; un resto -C(=O)-R<sup>13a</sup> o un resto -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>14a</sup>;

R<sup>12a</sup> representa un radical alifático C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;

o un radical de 5 a 10 miembros de arilo o heteroarilo, que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y que puede estar unido a través de un grupo alquilenilo C<sub>1-6</sub>, alquenileno C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo;

y

R<sup>13a</sup> y R<sup>14a</sup>, iguales o diferentes, representa cada uno un radical alifático C<sub>1-10</sub> grupo lineal o ramificado, saturado o insaturado, que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>;

o un radical de 5 a 10 miembros de arilo o heteroarilo, que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y/o que puede estar unido a través de un grupo alquilenilo C<sub>1-6</sub>, alquenileno C<sub>2-6</sub> o alquinileno C<sub>2-6</sub> lineal o ramificado que puede estar no sustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>) y -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub> y en los que el radical heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre como miembro(s) del anillo.

opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo;

y opcionalmente al menos un agente auxiliar fisiológicamente compatible.

18. Medicamento según la reivindicación 17, caracterizado porque

R<sup>1a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo que está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH y -NH<sub>2</sub>;

un radical seleccionado del grupo que consiste en adamantilo, biciclo[2.2.1]heptilo y biciclo[3.1.1]heptilo que puede estar sustituido con 1, 2, o 3 sustituyente(s) independientemente seleccionado del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub> y/o puede estar unido a través de un

grupo alquileo C<sub>1-6</sub> lineal o ramificado que puede contener 1, 2 o 3 átomo(s) de oxígeno como miembro(s) de la cadena;

5 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo;

15 un radical arilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y naftilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y dicho radical arilo se une a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub> lineal o ramificado que puede contener 1, 2 o 3 oxígeno átomo(s) como miembro(s) de la cadena y que puede estar sustituido con 1 radical fenilo;

20 un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y dicho radical heteroarilo se une a través de un grupo alquileo C<sub>1-6</sub> lineal o ramificado que puede contener 1, 2 o 3 átomo(s) de oxígeno como miembro(s) de la cadena;

o un resto -C(=O)-R<sup>12a</sup>,

35 preferiblemente, R<sup>1a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo e isopropilo, en los que dicho radical alquilo está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en -OH, F, Cl, Br y -CN;

40 un radical seleccionado del grupo que consiste en adamantilo, biciclo[2.2.1]heptilo y biciclo[3.1.1] heptilo que puede estar sustituido con 1,2, o 3 sustituyente(s) independientemente seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub> y/o que puede estar unido via un grupo alquileo seleccionado del grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-;

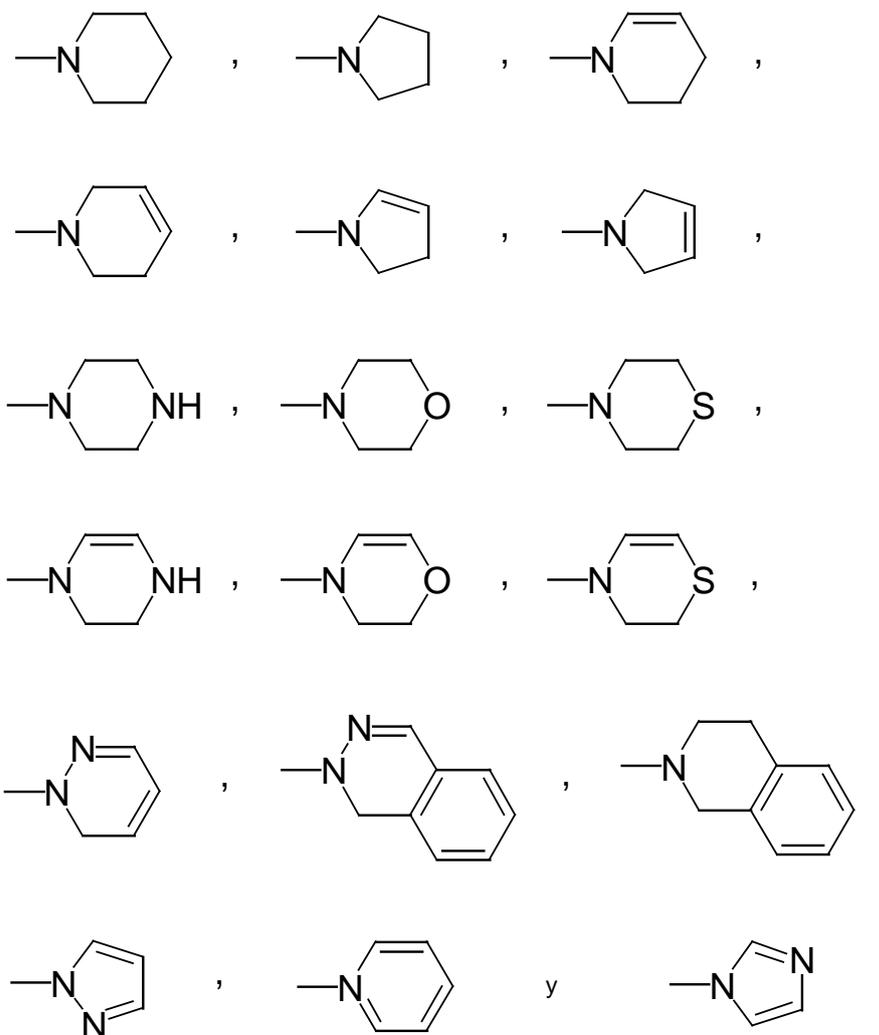
45 un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo y piridinilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

50 un radical arilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo y naftilo, en los que dicho arilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o se une a través de un grupo alquileo seleccionado forman el grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH(Fenil)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-;

- 5 un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo y piridinilo, en los que dicho radical heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o se une a través de un grupo alquileo seleccionado del grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-;
- 15 o un resto -C(=O)-R<sup>12a</sup>;
- más preferiblemente, R<sup>1a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH;
- 20 un radical adamantilo no sustituido,
- un radical fenilo o pirrolilo no sustituido;
- 25 un radical naftilo no sustituido que está unido via un grupo alquileo seleccionado del grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-;
- 30 un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, terc-butilo, metoxilo, F y Cl y dicho radical fenilo se une a través de un grupo alquileo seleccionado del grupo que consiste -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH(Fenil)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-;
- 35 un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en piridinilo, furanilo y pirrolilo, en los que dicho radical piridinilo, furanilo o pirrolilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, terc-butilo, metoxilo, F y Cl y dicho radical piridinilo, furanilo o pirrolilo se une a través de un grupo alquileo seleccionado forman el grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-;
- 40 o un resto -C(=O)-R<sup>12a</sup>.
19. Medicamento según reivindicación 17 o 18, caracterizado porque
- R<sup>2a</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo C<sub>1-10</sub> lineal o ramificado, no sustituido;
- 45 preferiblemente, R<sup>2a</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;
- más preferiblemente, R<sup>2a</sup> representa un átomo de hidrógeno o un radical metilo.
- 50 20. Medicamento según una o más de las reivindicaciones 17 a 19, caracterizado porque R<sup>1a</sup> y R<sup>2a</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en



preferiblemente, R<sup>1a</sup> y R<sup>2a</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en



5

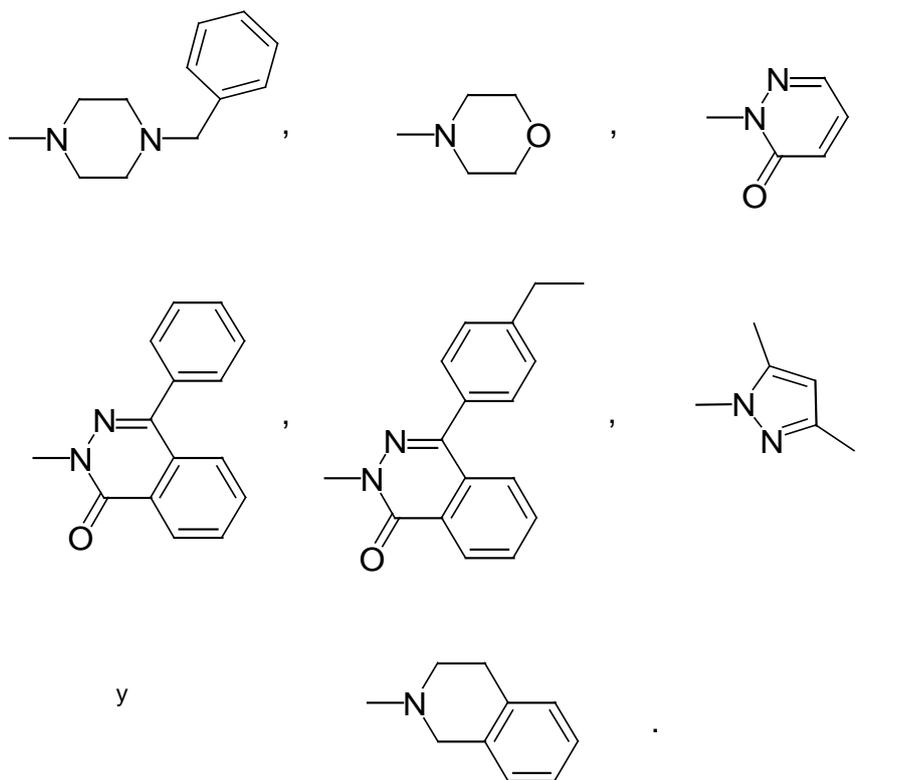
en los que cada uno de esos restos cíclicos antes mencionados pueden estar sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en oxo (=O), tioxo (=S), metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo; en los que dicho(s) sustituyente(s) cíclico(s) fenilo, fenoxilo y bencilo puede(n) estar no sustituido(s) o sustituido(s) por 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, F, Cl, Br, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub> y NO<sub>2</sub>;

10

15

20

más preferiblemente, R<sup>1a</sup> y R<sup>2a</sup> junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en



21. Medicamento según una o más de las reivindicaciones 17 a 20, caracterizado porque

22.  $R^{3a}$  representa un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo),  
 5 tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo y piridinilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>,  
 10 -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

15 preferiblemente,  $R^{3a}$  representa un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

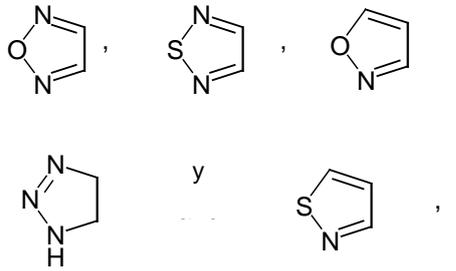
20 más preferiblemente,  $R^{3a}$  representa un radical fenilo no sustituido.

23. Medicamento según una o más de las reivindicaciones 17 a 21, caracterizado porque

25  $R^{4a}$ ,  $R^{5a}$  y  $R^{6a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un átomo halógeno seleccionado del grupo que consiste en F, Cl y Br;

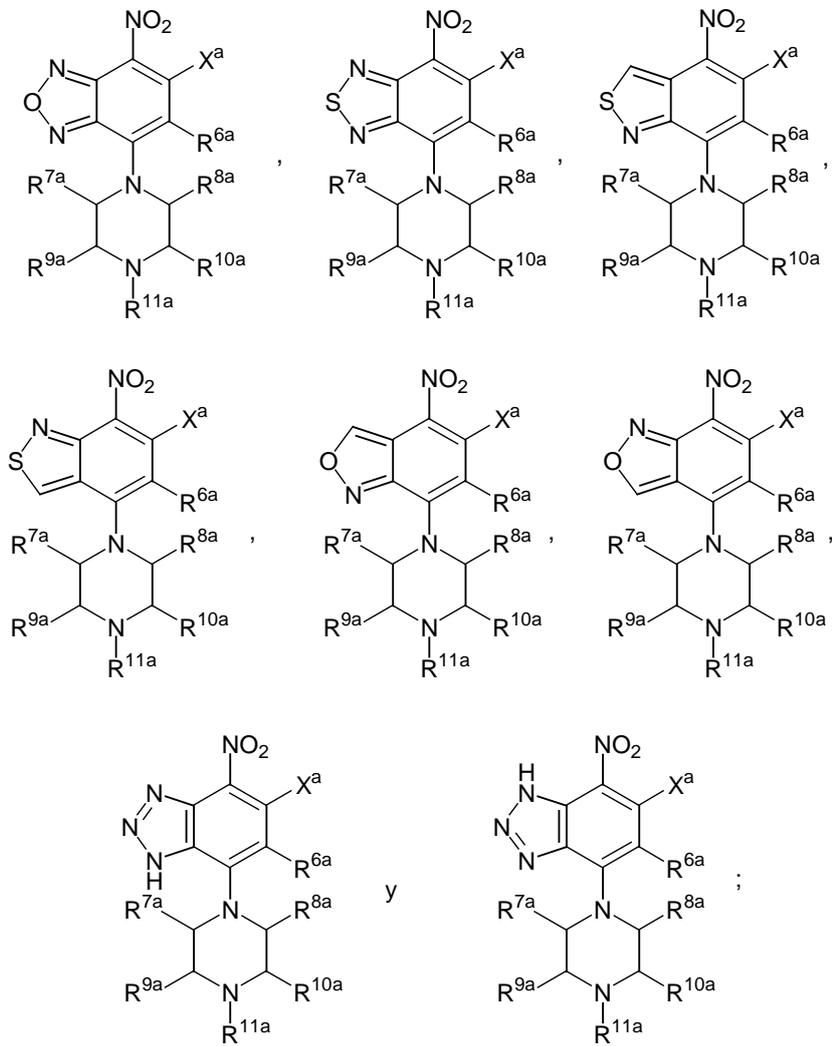
preferiblemente,  $R^{4a}$ ,  $R^{5a}$  y  $R^{6a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un átomo de flúor.

30 23. Medicamento según una o más de las reivindicaciones 17 a 22, caracterizado porque  $R^{4a}$  y  $R^{5a}$  junto con los átomos de carbono puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en

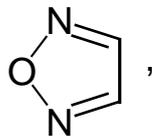


que junto con el anillo de fenilo al que se fusiona forma un sistema de anillo aromático bicíclico sustituido seleccionado del grupo que consiste en

5

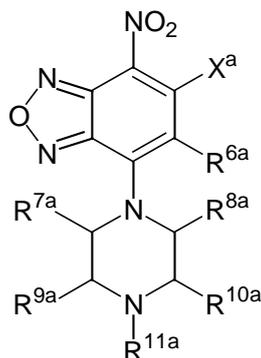


preferiblemente, R<sup>4a</sup> y R<sup>5a</sup> junto con los átomos de carbono puente forman el resto siguiente,



10

que junto con el anillo de fenilo al que se fusiona forma el sistema de anillo aromático bicíclico sustituido siguiente



24. Medicamento según una o más de las reivindicaciones 17 a 23, caracterizado porque  
 5  $R^{7a}$  y  $R^{8a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo  $C_{1-10}$  lineal o ramificado, no sustituido;

preferiblemente,  $R^{7a}$  y  $R^{8a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

más preferiblemente,  $R^{7a}$  y  $R^{8a}$  representa cada uno un átomo de hidrógeno.

25. Medicamento según una o más de las reivindicaciones 17 a 24, caracterizado porque  
 15  $R^{9a}$  y  $R^{10a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo  $C_{1-10}$  grupo lineal o ramificado, no sustituido;

preferiblemente,  $R^{9a}$  y  $R^{10a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

más preferiblemente,  $R^{9a}$  y  $R^{10a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical metilo.

26. Medicamento según una o más de las reivindicaciones 17 a 25, caracterizado porque  
 25  $R^{11a}$  representa un átomo de hidrógeno;

un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo, en los que dicho radical alquilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en  $-OH$ ,  $F$ ,  $Cl$ ,  $Br$  y  $-CN$ ;

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-C(=O)-OH$ ,  $-C(=O)-O$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-O-C(=O)$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $F$ ,  $Cl$ ,  $Br$ ,  $I$ ,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-NO_2$ ,  $-CHO$ ,  $-CF_2H$ ,  $-CFH_2$ ,  $-C(=O)-NH_2$ ,  $-C(=O)-NH$ (alquilo  $C_{1-5}$ ),  $-C(=O)-N$ (alquilo  $C_{1-5}$ )<sub>2</sub>,  $-S(=O)_2$ -alquilo  $C_{1-5}$ ,  $-S(=O)_2$ -fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y/o puede estar unido a través de grupo un  $-(CH_2)_{1,2 \text{ o } 3}$ ;

un resto  $-C(=O)-R^{13a}$  o un resto  $-S(=O)_2-R^{14a}$ ;

preferiblemente,  $R^{11a}$  representa un átomo de hidrógeno;

un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo, en los que dicho radical alquilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en  $-OH$ ,  $F$ ,  $Cl$ ,  $Br$  y  $-CN$ ;

un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo

(tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, piridinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>-;

un resto-C(=O)-R<sup>13a</sup> o un resto-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>14a</sup>;

más preferiblemente, R<sup>11a</sup> representa un átomo de hidrógeno;

un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, n-butilo y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH;

un radical fenilo o piridinilo no sustituido en los que dicho radical fenilo o piridinilo puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)-;

un resto-C(=O)-R<sup>12a</sup> o un resto-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>13a</sup>.

27. Medicamento según una o más de las reivindicaciones 17 a 26, caracterizado porque

R<sup>12a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1,2 o 3</sub>-;

preferiblemente, R<sup>12a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo e isopropilo,

o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo y piridinilo, en los que dicho radical arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)-;

más preferiblemente, R<sup>12a</sup> representa un radical fenilo o un tiofenilo, en los que dicho radical fenilo o tiofenilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) del grupo que consiste en metilo y cloro.

28. Medicamento según una o más de las reivindicaciones 17 a 27, caracterizado porque

R<sup>13a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo, en los que dicho radical alquilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en -OH, F, Cl, Br y -CN;

o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridazinilo, pirimidinilo, piridinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo,

benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1, 2 o 3</sub>;

preferiblemente, R<sup>13a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, y tienilo (tiofenilo), en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1, 2 o 3</sub>;

más preferiblemente, R<sup>13a</sup> representa un radical metilo o un radical fenilo o un tiofenilo, en los que dicho radical fenilo o tiofenilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado del grupo que consiste en metilo y cloro.

29. Medicamento según una o más de las reivindicaciones 17 a 28, caracterizado porque

R<sup>14a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo y terc-butilo;

o un radical arilo o heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzo[b]furanilo, benzo[b]tiofenilo, benzotiadiazolilo e imidazo[2,1-b]tiazolilo, en los que dicho arilo o heteroarilo puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S-alquilo C<sub>1-5</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-alquilo C<sub>1-5</sub>, -O-C(=O)-alquilo C<sub>1-5</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH(alquilo C<sub>1-5</sub>), -N(alquilo C<sub>1-5</sub>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</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>, -S(=O)<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1-5</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>-fenilo, fenilo, fenoxilo y bencilo y/o puede estar unido a través de un grupo -(CH<sub>2</sub>)<sub>1, 2 o 3</sub>;

preferiblemente, R<sup>14a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo e isopropilo,

o un radical fenilo, que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, terc-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, -O-CH<sub>3</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -S-CH<sub>3</sub>, -S-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -S-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-O-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -C(=O)-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, -CN, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NH-CH<sub>3</sub>, -NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -CHO, -CF<sub>2</sub>H, -CFH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH<sub>2</sub>, -C(=O)-NH-CH<sub>3</sub>, -C(=O)-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(=O)-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub> y -S(=O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;

más preferiblemente, R<sup>14a</sup> representa un radical metilo o un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 radical(es) metilo(s).

30. Medicamento según una o más de las reivindicaciones 17 a 29, caracterizado porque

X<sup>a</sup> representa un resto -NR<sup>1a</sup>R<sup>2a</sup> o un resto -OR<sup>3a</sup>;

R<sup>1a</sup> representa un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH y -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH;

un radical adamantilo no sustituido;

un radical fenilo o pirrolilo no sustituido;

5

un radical naftilo no sustituido que se une a través de un grupo alquileo seleccionado del grupo que consiste en  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$  y  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$ ;

10

un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, terc-butilo, metoxilo, F y Cl y dicho radical fenilo se une a través de un grupo alquileo seleccionado forman el grupo que consiste en  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ ,  $-\text{CH}(\text{fenilo})-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$  y  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$ ;

15

un radical heteroarilo seleccionado del grupo que consiste en piridinilo, furanilo y pirrolilo, en los que dicho radical piridinilo, furanilo o pirrolilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado(s) independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, terc-butilo, metoxilo, F y Cl y dicho radical piridinilo, furanilo o pirrolilo se une a través de un grupo alquileo seleccionado forman el grupo que consiste en  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$  y  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$ ;

20

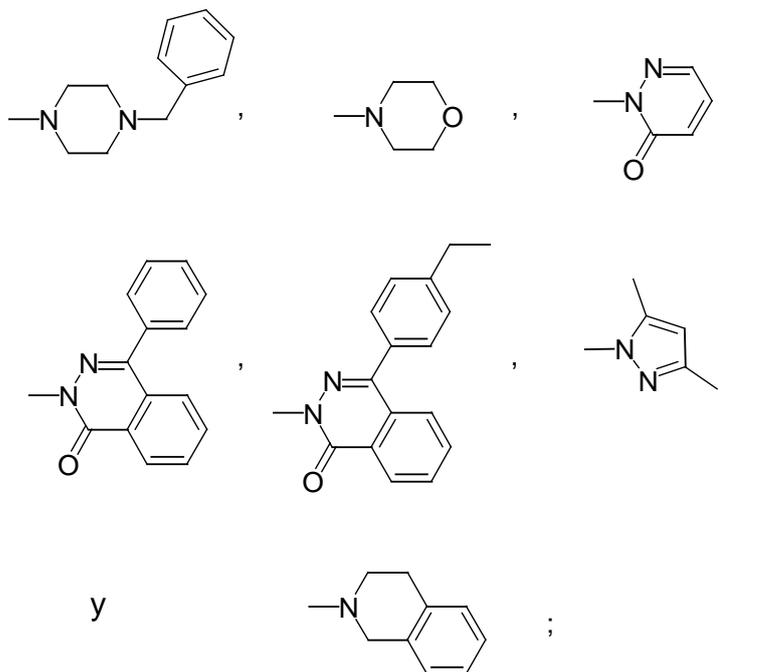
o un resto  $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{12a}$ ;

$\text{R}^{2a}$  representa un átomo de hidrógeno o un radical metilo;

o

25

$\text{R}^{1a}$  y  $\text{R}^{2a}$  junto con el átomo de nitrógeno puente forman un resto seleccionado del grupo que consiste en



30

$\text{R}^{3a}$  representa un radical fenilo no sustituido;

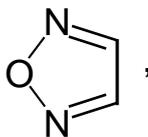
$\text{R}^{4a}$ ,  $\text{R}^{5a}$  y  $\text{R}^{6a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un átomo de flúor;

35

o

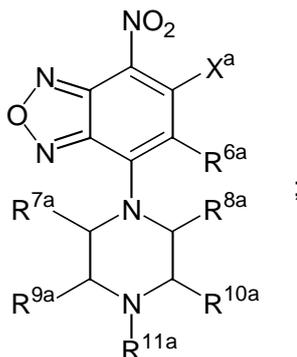
$\text{R}^{4a}$  y  $\text{R}^{5a}$  junto con los átomos de carbono puente forman el resto siguiente,

40



5

que junto con el anillo de fenilo al que se fusiona forma el siguiente sistema de anillo aromático bicíclico sustituido



$R^{7a}$  y  $R^{8a}$  representa cada uno un átomo de hidrógeno;

10

$R^{9a}$  y  $R^{10a}$ , iguales o diferentes, representa cada uno un átomo de hidrógeno o un radical metilo;

$R^{11a}$  representa un átomo de hidrógeno;

un radical alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, n-butilo y  $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-OH}$ ;

15

un radical fenilo o piridinilo no sustituido en los que dicho radical fenilo o piridinilo puede estar unido a través de un grupo  $-(\text{CH}_2)-$ ;

un resto  $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{12a}$  o un resto  $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{13a}$ ;

20

$R^{12a}$  representa un radical fenilo o un tiofenilo, en los que dicho radical fenilo o tiofenilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado del grupo que consiste en metilo y cloro;

25

$R^{13a}$  representa un radical metilo o un radical fenilo o un tiofenilo, en los que dicho radical fenilo o tiofenilo puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyente(s) seleccionado del grupo que consiste en metilo y cloro

y

30

$R^{14a}$  representa un radical metilo o un radical fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 radical(es) metilo;

35

opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

31. Medicamento según una o más de las reivindicaciones 17 a 30 que comprenden al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste en

40

[1] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-pirrol-1-il-etil)-amina,

[2] (4-Fluoro-bencil)-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,

[3] N-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-benzamida,

45

[4] N-Metil-N-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-benzamida,

- 5
- [5] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-pirrol-1-il-amina,
- [6] 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-2H-piridazin-3-ona,
- [7] 1-Metil-4-(4-nitro-3-fenoxi-fenil)-piperazina,
- [8] Bencil-[5-(4-butil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 10 [9] Bencil-[2-nitro-5-(4-piridin-2-il-piperazin-1-il)-fenil]-amina y
- [10] Bencil-[2-nitro-5-(4-fenil-2-il-piperazin-1-il)-fenil]-amina;
- [11] Furan-2-ilmetil-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 15 [12] 2-[4-(4-Nitro-3-fenetilamino-fenil)-piperazin-1-il]-etanol,
- [13] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-(2-o-toliloxi-etil)-amina
- [14] 2-[4-(3-bencilamino-4-nitro-fenil)-piperazin-1-il]-etanol,
- 20 [15] 4-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-morfolina,
- [16] 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-4-fenil-2H-ftalazin-1-ona,
- 25 [17] [2-(4-Cloro-fenoxi-etil)-[5-(3,5-dimetil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [18] 2-[4-[3-(Bencidril-amino)-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-etanol,
- 30 [19] 4-[4-Fluoro-5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-morfolina,
- [20] 2-[2-Nitro-5-[4-(tolueno-4-sulfonil)-piperazin-1-il]-fenil]-1,2,3,4-tetrahidro-isoquinolina,
- 35 [21] 1-[3-(3,5-Dimetil-pirazol-1-il)-4-nitro-fenil]-4-metil-piperazina,
- [22] Bencil-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,
- [23] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-fenetil-amina,
- 40 [24] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-piridin-3-ilmetil-amina,
- [25] (3-Cloro-fenil)-[4-[3-[(furanil-2-ilmetil)-amino]-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-metanona,
- 45 [26] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-piridin-3-ilmetil-amina,
- [27] 1-Bencil-4-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-piperazina,
- 50 [28] Furan-2-ilmetil-[5-(4-metanosulfonil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [29] Bencidril-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 55 [30] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-(2-fenoxi-etil)-amina,
- [31] 2-[5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-4-fenil-2H-ftalazin-1-ona,
- [32] 1-[3-(3,5-Dimetil-pirazol-1-il)-4-nitro-fenil]-piperazina,
- 60 [33] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-fenetil-amina,
- [34] [5-(4-Bencenosulfonil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-furan-2-ilmetil-amina,
- 65 [35] [2-(3,4-Dimetoxi-fenil)-etil]-[2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil]-

amina,

- 5
- [36] 4-[3-[(Furan-2-ilmetil)-amino]-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-m-tolil-metanona,
- [37] 4-[3-[(Furan-2-ilmetil)-amino]-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-fenil-metanona,
- 10
- [38] 4-[3-(3,5-Dimetil-pirazol-1-il)-4-nitro-fenil]-piperazin-1-il]-tiofen-2-il-metanona,
- [39] 4-(4-Etil-fenil)-2-[5-[4-metil-piperazin-1-il]-2-nitro-fenil]-2H-ftalalazin-1-ona,
- 15
- [40] 3-[7-(4-Metil-piperazin-1-il)-4-nitro-benzo[1,2,5]oxadiazol-5-ilamino]-propan-1-ol,
- [41] 3-[4-Nitro-7-(4-fenil-piperazin-1-il)-benzo[1,2,5]oxadiazol-5-ilamino]-etan-1-ol,
- 20
- [42] 3-[4-Nitro-7-(4-piridin-piperazin-1-il)-benzo[1,2,5]oxadiazol-5-ilamino]-propan-1-ol,
- [43] [2-(3,4-Dimetoxi-fenil)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 25
- [44] [2-(3,4-Dimetil-fenil)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [45] [2-(4-terc-butil-fenoksi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 30
- [46] [2-(4-Metoxi-fenoksi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 35
- [47] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-m-toliloksi-etil)-amina,
- [48] [2-(4-Cloro-fenoksi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 40
- [49] (2-Nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-(1-fenil-etil)-amina,
- [50] [2-(3-Metoxi-fenoksi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 45
- [51] [2-(2-Metoxi-fenoksi)-etil]-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [52] (4-Cloro-bencil)-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,
- 50
- [53] Bencil-[5-(4-bencil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [54] Bencil-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- 55
- [55] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(2-o-toliloksi-etil)-amina,
- [56] (4-Cloro-bencil)-[5-(4-metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-amina,
- [57] Furan-2-ilmetil-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,
- 60
- [58] [2-(4-Cloro-fenoksi)-etil]-(2-nitro-5-piperazin-1-il-fenil)-amina,
- [59] [5-(4-Metil-piperazin-1-il)-2-nitro-fenil]-(1-fenil-etil)-amina
- 65
- [60] 1-[4-(3-bencilamino-4-nitro-fenil)-piperazin-1-il]-etanona,

- [61] 2-[4-[3-(4-Methylpiperazin-1-yl)-4-nitrophenyl]piperazin-1-yl]ethanol,
- [62] 2-[4-[3[2-(Naphthalen-2-yloxy)ethylamino]-4-nitrophenyl]piperazin-1-yl]ethanol,
- [63] 2-[4-(3-[[1-(1-Adamantyl)ethyl]amino]-4-nitrophenyl)piperazin-1-yl]ethanol y
- [64] 2-[4-[3-(3,4-Dimethoxyphenethylamino)-4-nitrophenyl]piperazin-1-yl]ethanol

opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros o diastereómeros, un racemato o en forma de una mezcla de al menos dos de sus estereoisómeros, preferiblemente enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier razón de mezcla, o una sal fisiológicamente aceptable del mismo, o un solvato correspondiente del mismo.

- 5 32. Medicamento según una o más de las reivindicaciones 17 a 31, para la profilaxis y/o tratamiento de un trastorno o enfermedad relacionado con la ingestión de alimentos, preferiblemente, para la regulación del apetito, para el mantenimiento, incremento o reducción del peso corporal, para la profilaxis y/o tratamiento de la obesidad, bulimia, anorexia, caquexia, diabetes tipo II (diabetes mellitus no insulino dependiente), preferiblemente diabetes de tipo II que está producida por obesidad; para la profilaxis y/o el tratamiento del accidente cerebrovascular; migraña; traumatismo craneal; epilepsia; síndrome del colon irritable; síndrome del intestino irritable; trastornos del sistema nervioso central; ansiedad; ataques de pánico; depresión; trastornos bipolares; trastorno obsesivo-compulsivo; trastornos cognitivos; disfunción cognitiva asociada con enfermedades psiquiátricas; trastornos de la memoria; demencia senil; trastornos del estado de ánimo; trastornos del sueño; psicosis; trastornos neurodegenerativos, preferiblemente seleccionados del grupo que consiste en enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Huntington y esclerosis múltiple; esquizofrenia; hipoxia intermitente crónica; convulsiones; trastorno de hiperactividad (ADHD, trastorno por déficit de atención / hiperactividad); para la mejora de la cognición (potenciamiento cognitivo) o la memoria cognitiva (potenciamiento de la memoria cognitiva); para la profilaxis y/o el tratamiento de la adicción y/o abstinencia de las drogas; para la profilaxis y/o el tratamiento de la adicción y/o abstinencia del alcohol, para la profilaxis y/o el tratamiento de la adicción y/o abstinencia de la nicotina.
- 10
- 15
- 20 33. Uso de al menos un compuesto de fórmula general la según una o más de las reivindicaciones 17 a 31, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento de un trastorno o enfermedad relacionado con la ingestión de alimentos, preferiblemente para la regulación del apetito; para el mantenimiento, incremento o reducción del peso corporal; o para la profilaxis y/o tratamiento de la obesidad, bulimia, anorexia, caquexia, diabetes tipo II (diabetes mellitus no insulino dependiente), más preferiblemente para la profilaxis y/o tratamiento de la obesidad.
- 25
- 30 34. Uso de al menos un compuesto de fórmula general la según una o más de las reivindicaciones 17 a 31, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o tratamiento del accidente cerebrovascular; migraña; traumatismo craneal; epilepsia; síndrome del colon irritable; síndrome del intestino irritable; trastornos del sistema nervioso central; ansiedad; ataques de pánico; depresión; trastornos bipolares; trastorno obsesivo-compulsivo; trastornos cognitivos; disfunción cognitiva asociada con enfermedades psiquiátricas; trastornos de la memoria; demencia senil; trastornos del estado de ánimo; trastornos del sueño; psicosis; trastornos neurodegenerativos, preferiblemente seleccionados del grupo que consiste en enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Huntington y esclerosis múltiple; esquizofrenia; hipoxia intermitente crónica; convulsiones; o trastorno de hiperactividad (ADHD, trastorno por déficit de atención / hiperactividad).
- 35
- 40 35. Uso de al menos un compuesto de fórmula general la según una o más de las reivindicaciones 17 a 31, para la fabricación de un medicamento para la mejora de la cognición (potenciamiento cognitivo) y/o para la mejora de la memoria cognitiva (potenciamiento de la memoria cognitiva).
- 45 36. Uso de al menos un compuesto de fórmula general la según una o más de las reivindicaciones 17 a 31, para la fabricación de un medicamento para la profilaxis y/o el tratamiento de la adicción y/o abstinencia de las drogas, preferiblemente para la profilaxis y/o tratamiento de la adicción y/o abstinencia relacionada con una o más de las drogas seleccionadas del grupo constituido por benzodiazepinas, opioides naturales, semisintéticos o sintéticos como la cocaína, etanol y/o nicotina.