

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 382 445**

51 Int. Cl.:
C07D 409/12 (2006.01)
C07D 333/54 (2006.01)
C07D 407/12 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
A61K 31/559 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **10188688 .5**
96 Fecha de presentación: **31.08.2006**
97 Número de publicación de la solicitud: **2284169**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **16.02.2011**

54 Título: **Derivados de 4-piperazin-1-il-4-benzo[b]tiofeno adecuados para el tratamiento de trastornos del SNC**

30 Prioridad:
31.08.2005 JP 2005251055

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
08.06.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
08.06.2012

73 Titular/es:
**Otsuka Pharmaceutical Co., Limited
2-9, Kanda-Tsukasamachi Chiyoda-Ku
Tokyo 101-8535, JP**

72 Inventor/es:
**Yamashita, Hiroshi;
Kuroda, Hideaki;
Ito, Nobuaki;
Matsubara, Jun;
Oshima, Kunio;
Kondo, Kazumi;
Shimizu, Satoshi;
Itotani, Motohiro y
Fukushima, Tae**

74 Agente/Representante:
Ungría López, Javier

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

ES 2 382 445 T3

DESCRIPCIÓN

Derivados de 4-piperazin-1-il-4-benzo[b]tiofeno adecuados para el tratamiento de trastornos del SNC

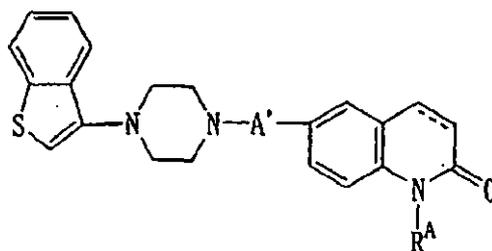
5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a un nuevo compuesto heterocíclico.

10 **Antecedentes de la técnica**

Debido a la heterogeneidad del factor causal de la esquizofrenia, del trastorno bipolar, de los trastornos del humor y de los trastornos emocionales, sería deseable que un fármaco tuviera múltiples efectos farmacológicos con el fin de desarrollar un tratamiento de amplio espectro.

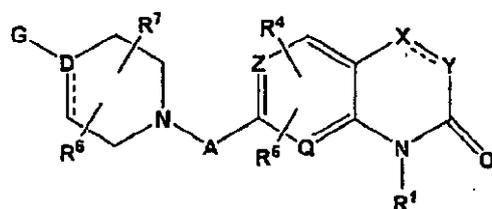
15 El documento WO2004/026864A1 describe un derivado de carbostirilo representado por la fórmula general:



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

25 Sin embargo, no hay nada en el documento WO2004/026864A1 que describa que los derivados de carbostirilo descritos en el mismo tengan tanto actividad agonista parcial hacia el receptor D_2 , como actividad antagonista contra el receptor $5-HT_{2A}$, actividad antagonista contra el receptor α_1 y actividad inhibidora de la absorción de la serotonina, ni que proporcionen un tratamiento de amplio espectro.

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



35 (en la que A es $-(CH_2)_mCH_2-$, $-(CH_2)_mO-$ o similar; m es un número entero de 2 a 5; D es N, C o similar; Z y Q son independientemente N, C o CH, con la condición de que al menos uno entre Z y Q sea N; X e Y son independientemente C, N o similar, y el enlace entre X e Y es un enlace simple o doble; R^1 es hidrógeno, grupo alquilo (C_1-C_3) o similar; R^4 , R^5 , R^6 y R^7 representa cada uno hidrógeno, grupo alquilo o similar; y G representa un grupo de compuesto monocíclico o bicíclico), que se unen a los receptores de dopamina D_2 . El documento WO 2005/019215 A1 enseña que algunos compuestos revelados en dicha memoria tienen una actividad como agonistas parciales hacia los receptores D_2 o una actividad como antagonistas de los receptores D_2 , y que pueden ser eficaces para el tratamiento de la esquizofrenia u otro trastorno del sistema nervioso central.

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

45 **Revelación de la invención**

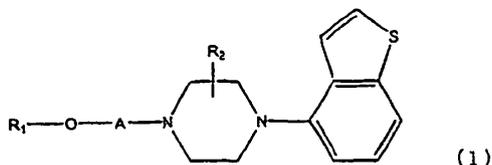
Es un objeto de la presente invención proporcionar un fármaco antipsicótico que tenga un mayor espectro de tratamiento, menos efectos secundarios, y tolerabilidad y seguridad excelentes en comparación con los fármacos antipsicóticos tópicos o atípicos ampliamente conocidos.

50 Los presentes inventores han realizado estudios exhaustivos sobre el problema anteriormente descrito y, como resultado de los mismos, sintetizaron satisfactoriamente un nuevo compuesto que tiene tanto actividad agonista parcial hacia el receptor de dopamina D_2 (actividad agonista parcial hacia el receptor D_2), como actividad antagonista

contra el receptor de serotonina 5-HT_{2A} (actividad antagonista contra el receptor 5-HT_{2A}) y actividad antagonista contra el receptor de adrenalina α_1 (actividad antagonista contra el receptor α_1) y, además de estos efectos, tiene un efecto inhibitor de la absorción de la serotonina (o efecto inhibitor de la reabsorción de la serotonina). La presente invención se ha realizado en base a este descubrimiento.

5

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



10 en la que R² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior;

A representa un grupo alquilenilo inferior o un grupo alquenilenilo inferior; y

R¹ representa un grupo heterocíclico seleccionado entre:

un grupo heterocíclico fusionado a benceno que tiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre, y que se selecciona del grupo que consiste en (1)

15 un grupo tetrahydroquinoxalinilo, (2) un grupo tetrahydroquinazolinilo, (3) un grupo dihydroquinazolinilo, (4) un grupo indolinilo, (5) un grupo indolilo, (6) un grupo isoindolinilo, (7) un grupo bencimidazolilo, (8) un grupo dihydrobencimidazolilo, (9) un grupo tetrahydrobenzazepinilo, (10) un grupo tetrahydrobenzodiazepinilo, (11) un grupo hexahydrobenzazocinilo, (12) un grupo dihydrobenzoxazinilo, (13) un grupo dihydrobenzoxazolilo, (14) un grupo bencisoxazolilo, (15) un grupo benzoxadiazolilo, (16) un grupo tetrahydrobenzoxazepinilo, (17) un grupo dihydrobenzotiazinilo, (18) un grupo benzotiazolilo, (19) un grupo benzoxatiolilo, (20) un grupo cromenilo, (21) un grupo dihydrobenzofurilo, (22) un grupo carbazolilo, (23) un grupo dibenzofurilo y (24) un grupo quinoxalinilo, en el que al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en los siguientes grupos (1) a (66) puede estar presente como sustituyente en el grupo heterocíclico representado por R¹:

25 (1) un grupo alquilo inferior,

(2) un grupo alquenilo inferior,

(3) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,

(4) un grupo alcoxilo inferior,

(5) un grupo ariloxilo,

30 (6) un grupo alquiltio inferior,

(7) un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno,

(8) un grupo hidroxilo,

(9) un grupo hidroxilo protegido,

(10) un grupo hidroxialquilo inferior,

35 (11) un grupo hidroxialquilo inferior protegido,

(12) un átomo de halógeno,

(13) un grupo ciano,

(14) un grupo arilo,

(15) un grupo nitro,

40 (16) un grupo amino,

(17) un grupo amino que tiene uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcocarbonilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alquilcarbamoilo inferior, un grupo aminoalcanoilo inferior, un grupo alcanoilamin inferior-alcanoilo inferior y un grupo alcocarbonilamin inferior-alcanoilo inferior como sustituyente,

45 (18) un grupo alcanilo inferior,

(19) un grupo arilsulfonilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior en el grupo arilo,

(20) un grupo carboxilo,

(21) un grupo alcocarbonilo inferior,

(22) un grupo carboxialquilo inferior,

50 (23) un grupo alcocarbonil inferior-alquilo inferior,

(24) un grupo alcanoilamin inferior-alcanoilo inferior,

(25) un grupo carboxialquenilo inferior,

(26) un grupo alcocarbonil inferior-alquenilo inferior,

55 (27) un grupo carbamoilalquenilo inferior que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como sustituyente,

(28) un grupo carbamoilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en los siguientes grupos (i) a (lxxviii) como sustituyente:

(i) un grupo alquilo inferior,

- (ii) un grupo alcoxilo inferior,
 (iii) un grupo hidroxialquilo inferior,
 (iv) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior,
 (v) un grupo ariloxialquilo inferior,
 5 (vi) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
 (vii) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo aroilo y un grupo carbamoilo,
 (viii) un grupo cicloalquilo C3-C8 que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que
 10 consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxicarbonilo inferior y un grupo fenilalcoxilo inferior como sustituyente,
 (ix) un grupo alquilo inferior sustituido con cicloalquilo C3-C8,
 (x) un grupo alqueno inferior,
 (xi) un grupo carbamoilalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que
 15 consiste en un grupo alquilo inferior, grupo fenilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior y uno o varios grupos fenilo que pueden tener uno o varios grupos alcoxilo inferior como sustituyente,
 (xii) un grupo alcoxicarbonil inferior-alquilo inferior,
 (xiii) un grupo furilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyente) en el grupo furilo,
 (xiv) un grupo tetrahidrofurilalquilo inferior,
 20 (xv) un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior,
 (xvi) un grupo tetrahidropiranilalquilo inferior,
 (xvii) un grupo pirrolalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyente en el grupo pirrolilo),
 (xviii) un grupo alquilo inferior sustituido con un grupo dihidropirazolilo que puede tener uno o varios grupos
 25 oxo,
 (xix) un grupo pirazolilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyente en el grupo pirazolilo),
 (xx) un grupo imidazolilalquilo inferior,
 (xxi) un grupo piridilalquilo inferior,
 30 (xxii) un grupo pirazinilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyente en el grupo pirazinilo),
 (xxiii) un grupo pirrolidinilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en uno o varios grupos oxo y un grupo alquilo inferior como sustituyente en el grupo pirrolidinilo),
 (xxiv) un grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que
 35 consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanoilo inferior como sustituyente en el grupo piperidilo),
 (xxv) un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyente en el grupo piperazinilo),
 (xxvi) un grupo morfolinilalquilo inferior,
 (xxvii) un grupo tienilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyente
 40 en el grupo tienilo),
 (xxviii) un grupo tiazolilalquilo inferior,
 (xxix) un grupo dihidrobenzofurilalquilo inferior,
 (xxx) un grupo benzopiranilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos oxo como sustituyente en el grupo benzopiranilo),
 45 (xxxi) un grupo bencimidazolilalquilo inferior,
 (xxxii) un grupo indolilalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos alcoxicarbonilo inferior en el grupo alquilo inferior),
 (xxxiii) un grupo imidazolilalquilo inferior que tiene uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que
 50 consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxicarbonilo inferior en el grupo alquilo inferior,
 (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior y un grupo alquiltio inferior-alquilo inferior como sustituyente,
 (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanoilo inferior y un grupo aroilo como
 55 sustituyente,
 (xxxvi) un grupo piperidinilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanoilo inferior y un grupo aroilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un átomo de halógeno como sustituyente,
 (xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 60 (xxxviii) un grupo hexahidroazepinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo arilo y un grupo furilo como sustituyente,
 (xl) un grupo tiazolilo,
 (xli) un grupo tiadiazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
 65 (xli) un grupo isoxazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
 (xlili) un grupo indazolilo,

- (xlv) un grupo indolilo,
 (xlv) un grupo tetrahydrobenzotiazolilo,
 (xlvi) un grupo tetrahydroquinolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior, un átomo de halógeno y un grupo oxo como sustituyente,
- 5
- (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
 (xlviii) un grupo benzodioxolilalquilo inferior,
 (xlix) un grupo arilo que puede tener uno o varios grupos como sustituyente seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo inferior; un grupo alcoxilo inferior; un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno; un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno; un grupo alqueno inferior; un grupo amino que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanolilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo sulfamilo; un grupo alquiltio inferior; un grupo alcanolilo inferior; un grupo alcoxycarbonilo inferior; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo inferior; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo ariloxilo; un grupo arilalcoxilo inferior; un grupo hidroxilo; a un grupo hidroxialquilo inferior; un grupo carbamilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior; un grupo dihidrofurilo que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo tiazolidinilalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo imidazolilalcanolilo inferior y un grupo piperidinilcarbonilo,
- 10
- (l) un grupo cianoalquilo inferior,
 (li) un grupo dihydroquinolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo oxo,
 (lii) un grupo alquilamino inferior sustituido con halógeno,
 (liii) un grupo alquiltio inferior-alquilo inferior,
 (liv) un grupo amidino que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
 (lv) un grupo amidinalquilo inferior,
 (lvi) un grupo alquenoiloxialquilo inferior,
- 15
- (lvii) un grupo arilamino que, en el grupo arilo, puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno y un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno,
 (lviii) un grupo arilalqueno inferior,
 (liv) un grupo piridilamino que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
 (lx) un grupo arilalquilo inferior (que puede tener en el grupo arilo y/o el grupo alquilo inferior uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxilo inferior, un grupo carbamilo y un grupo alcoxycarbonilo inferior como sustituyente),
 (lxi) un grupo alquinilo inferior,
 (lxii) un grupo ariloxialquilo inferior (que puede tener como sustituyente en el grupo arilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo inferior; un grupo carbamilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo inferior y un grupo alquilo inferior; y un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo),
 (lxiii) un grupo isoxazolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (lxiv) un grupo dihidroindenilo,
- 20
- (lxv) un grupo arilalcoxi inferior-alquilo inferior,
 (lxvi) un grupo tetrahidropiranilo,
 (lxvii) un grupo azetidino que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanolilo inferior y un grupo aroilo,
 (lxvii) un grupo azetidinalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanolilo inferior y un grupo aroilo,
 (lxix) un grupo tetrazolilo,
 (lxx) un grupo indolinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (lxxi) un grupo triazolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquiltio inferior,
- 25
- (lxxii) un grupo imidazolilo que puede tener uno o varios grupos carbamilo,
 (lxxiii) un grupo oxazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
 (lxxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
 (lxxv) un grupo bencimidazolilo,
 (lxxvi) un grupo dihydrobenzotiazolilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener uno o varios grupos alcoxycarbonilo inferior, y
 (lxxviii) un grupo oxazolilalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
- 30
- (29) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener, en el grupo amino, uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo alcanolilo inferior, un grupo arilo, un grupo arilalquilo inferior, un grupo aroilo y un grupo aminoalquilo sustituido (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo amino),
- 35
- 40
- 45
- 50
- 55
- 60
- 65

- (30) un grupo alquilo inferior sustituido con un grupo carbamoilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- 5 (31) un grupo tiocarbamoilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
 (32) un grupo sulfamoilo,
 (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior,
- 10 (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (36) un grupo imidazolilo,
 (37) un grupo triazolilo,
 (38) un grupo isoxazolilo,
 (39) un grupo piperidinilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo arilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo y un grupo amino que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior y un grupo alcanilamino inferior-alcanilo inferior,
- 15 (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo carboxialquilo inferior, un grupo alquilcarbamoil inferior-alquilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxilo inferior, un grupo carboxilo, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo amino (en el que pueden estar presentes 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior y un grupo aroilo), un grupo piperidinilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior y un grupo aroilo), grupo piperazinilo (en el que pueden estar presente uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyente), un grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decilo, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que pueden estar presente uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyente), un grupo piridilo, un grupo piridiloxilo, un grupo piridilalcoxilo inferior, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo arilalcoxilo inferior (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior y un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno en el grupo arilo), un grupo arilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxilo inferior, un grupo hidroxilo), un grupo ariloxilo (que puede tener, en el grupo arilo, uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), un grupo arilalquilo inferior (que puede tener, en el grupo arilo, uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno) y un grupo aroilo (que puede tener, en el grupo arilo, uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxilo inferior),
- 20 (41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener, como sustituyente, un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo hidroxilo, un grupo amino (que puede tener, en el grupo amino, uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior y un grupo aroilo), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo piperidilalquilo inferior, un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo piperazinilo), un grupo aminoalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo amino), un grupo ariloxilo (que puede tener uno o varios grupos alcoxilo inferior sustituidos con halógeno en el grupo arilo), un grupo ariloxialquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alcoxilo inferior sustituidos con halógeno en el grupo arilo) y un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos oxo),
- 25 (42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener, como sustituyente, uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo cicloalquilo C3-C8, un grupo alcanilo inferior, un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo alcoxil inferior-alquilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo aminoalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo amino), un grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo piperidilo), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior, un grupo tetrahydrofuralalquilo inferior, un grupo piridilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos fenilo como sustituyentes en el grupo alquilo inferior), un grupo imidazolilalquilo inferior, un grupo furilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilcarbonilalquilo inferior, un grupo piperidinilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes, un grupo piridilo (que puede tener, en el grupo piridilo, uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciano y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como sustituyentes), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo arilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo aroilo, un grupo furilcarbonilo, un grupo arilalcoxycarbonilo inferior y un grupo oxo,
- 30 (43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,
 (44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo piridilo,
- 35 (45) un grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
- 40
- 45
- 50
- 55
- 60
- 65

- (46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo,
 (47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo piperidilalquilo inferior y un grupo arilo,
 (48) un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos arilo que pueden tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo inferior y un grupo ciano,
 (49) un grupo azabicyclo[3.2.2]nonilcarbonilo,
 (50) un grupo 8-azabicyclo[3.2.1]octilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos ariloxilo sustituidos o no sustituidos con halógeno,
 (51) un grupo indolinilcarbonilo,
 (52) un grupo tetrahydroquinolilcarbonilo,
 (53) un grupo tetrahidropirido[3,4-b]indolilcarbonilo,
 (54) un grupo morfolinilalquilo inferior,
 (55) un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior en el grupo piperazinilo),
 (56) un grupo morfolinilcarbonilalquilo inferior,
 (57) un grupo piperazinilcarbonilalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior en el grupo piperazinilo,
 (58) un grupo oxo,
 (59) un grupo aminoalcoxilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior en el grupo amino),
 (60) un grupo alcoxi inferior-alcoxilo inferior,
 (61) un grupo piperazinilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior y un grupo alcoxycarbonilo inferior,
 (62) un grupo morfolinilo,
 (63) un grupo 1,3,8-triazaspiro[4.5]decanilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo arilo,
 (64) un grupo tetrahidropiridilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos piridilo,
 (65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos tioxo y
 (66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decanilo.

- 30 La presente invención proporciona un compuesto representado por la fórmula general (1), en la que R^1 representa un grupo heterocíclico seleccionado entre:
 un grupo heterocíclico fusionado a benceno que tiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno y átomo de azufre y que se selecciona del grupo que consiste en (1) un grupo tetrahydroquinoxalinilo, (2) un grupo tetrahydroquinazolinilo, (3) un grupo dihydroquinazolinilo, (4) un grupo indolinilo, (5) un grupo indolilo, (6) un grupo isoindolinilo, (7) un grupo bencimidazolinilo, (8) un grupo dihydrobencimidazolilo, (9) un grupo tetrahydrobenzazepinilo, (10) un grupo tetrahydrobenzodiazepinilo, (11) un grupo hexahydrobenzazozinilo, (12) un grupo dihydrobenzoxazinilo, (13) un grupo dihydrobenzoxazolilo, (14) un grupo bencisoxazolilo, (15) un grupo benzoxadiazolilo, (16) un grupo tetrahydrobenzoxazepinilo, (17) un grupo dihydrobenzotiazinilo, (18) un grupo benzotiazolilo, (19) un grupo benzoxatiolilo, (20) un grupo cromenilo, (21) un grupo dihydrobenzofurilo, (22) un grupo carbazolilo, (23) un grupo dibenzofurilo y (24) un grupo quinoxalinilo, en la que en el grupo heterocíclico representado por R^1 , pueden estar presentes de 1 a 5 grupos seleccionados del grupo que consiste en los siguientes grupos (1) a (66) como sustituyente/s:

- (1) un grupo alquilo inferior,
 (2) un grupo alquenilo inferior,
 (3) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
 (4) un grupo alcoxilo inferior,
 (5) un grupo fenoxilo,
 (6) un grupo alquiltio inferior,
 (7) un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno,
 (8) un grupo hidroxilo,
 (9) un grupo fenilalcoxilo inferior,
 (10) a un grupo hidroxialquilo inferior,
 (11) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior,
 (12) un átomo de halógeno,
 (13) un grupo ciano,
 (14) un grupo fenilo,
 (15) un grupo nitro,
 (16) un grupo amino,
 (17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alquilcarbamoilo inferior, un grupo aminoalcanilo inferior, un grupo alcanilamin inferior-alcanilo inferior y un grupo alcoxycarbonilamin inferior-alcanilo inferior como sustituyente/s,
 (18) un grupo alcanilo inferior,
 (19) un grupo fenilsulfonilo que puede tener un solo grupo alquilo inferior en el grupo fenilo,
 (20) un grupo carboxilo,

- (21) un grupo alcoxycarbonilo inferior,
 (22) un grupo carboxialquilo inferior,
 (23) un grupo alcoxycarbonil inferior-alquilo inferior,
 (24) un grupo alcanoilamino inferior-alcanoilo inferior,
 5 (25) un grupo carboxialqueno inferior,
 (26) un grupo alcoxycarbonil inferior-alqueno inferior,
 (27) un grupo carbamoilalqueno inferior que puede tener 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyente/s,
 (28) un grupo carbamoilo que puede tener 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en los siguientes grupos (i) a (lxxviii) como sustituyente/s:
- (i) un grupo alquilo inferior,
 (ii) un grupo alcoxilo inferior,
 (iii) a un grupo hidroxialquilo inferior,
 15 (iv) un grupo alcoxil inferior-alquilo inferior,
 (v) un grupo fenoxialquilo inferior,
 (vi) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
 (vii) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo carbamoilo,
 20 (viii) un grupo cicloalquilo C3-C8 que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxycarbonilo inferior y un grupo fenilalcoxilo inferior como sustituyente/s,
 (ix) un grupo alquilo inferior sustituido con cicloalquilo C3-C8,
 (x) un grupo alqueno inferior,
 25 (xi) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos carbamoilo que puede tener 1 a 2 grupos como sustituyente/s seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo que puede tener un solo grupo alquilo inferior y un grupo fenilo que puede tener un solo grupo alcoxilo inferior,
 (xii) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos alcoxycarbonilo inferior,
 (xiii) un grupo furilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente/s en el grupo furilo),
 30 (xiv) un grupo tetrahidrofurilalquilo inferior,
 (xv) un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior,
 (xvi) un grupo tetrahidropiranilalquilo inferior,
 (xvii) un grupo pirrolilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior en el grupo pirrolilo como sustituyente/s),
 35 (xviii) un grupo alquilo inferior sustituido con un grupo dihidropirazolilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (xix) un grupo pirazolilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como sustituyente/s en el grupo pirazolilo),
 (xx) un grupo imidazolilalquilo inferior,
 40 (xxi) un grupo piridilalquilo inferior,
 (xxii) un grupo pirazinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferentemente 1) grupos alquilo inferior como sustituyente/s en el grupo pirazinilo),
 (xxiii) un grupo pirrolidinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior como sustituyente/s en el grupo pirrolidinilo),
 45 (xxiv) un grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanoilo inferior como sustituyente/s en el grupo piperidilo),
 (xxv) un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como sustituyente/s en el grupo piperazinilo),
 (xxvi) un grupo morfolinilalquilo inferior,
 50 (xxvii) un grupo tienilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como sustituyente/s en el grupo tienilo),
 (xxviii) un grupo tiazolilalquilo inferior,
 (xxix) un grupo dihidrobenzofurilalquilo inferior,
 (xxx) un grupo benzopiranilalquilo inferior (que puede tener un solo grupo oxo como sustituyente en el grupo benzopiranilo),
 55 (xxxi) un grupo bencimidazolilalquilo inferior,
 (xxxii) un grupo indolilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxycarbonilo inferior en el grupo alquilo inferior),
 (xxxiii) un grupo imidazolilalquilo inferior que tiene de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxycarbonilo inferior en el grupo alquilo inferior,
 60 (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior y un grupo alquiltio inferior-alquilo inferior como sustituyente/s,
 (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo alcanoilo inferior y un grupo benzoilo como sustituyente/s,
 65 (xxxvi) un grupo piperidinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un

- grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo benzoílo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un átomo de halógeno como sustituyente/s en el grupo fenilo),
- 5 (xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (xxxviii) un grupo hexahidroazepinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo y un grupo furilo como sustituyente/s,
 (xl) un grupo tiazolilo,
 (xli) un grupo tiadiazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,
 10 (xlii) un grupo isoxazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,
 (xliii) un grupo indazolilo,
 (xliv) un grupo indolilo,
 (xlv) un grupo tetrahydrobenzotiazolilo,
 (xlvi) un grupo tetrahydroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior, un átomo de halógeno y un grupo oxo como sustituyente/s, (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,
 (xlviii) un grupo benzodioxolilalquilo inferior,
 (xlix) un grupo fenilo o grupo naftilo que puede tener de 1 a 3 grupos como sustituyente/s, seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo inferior; un grupo alcoxilo inferior; un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno; un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno; un grupo alquenilo inferior; un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo sulfamoílo; un grupo alquiltio inferior; un grupo alcanóilo inferior; un grupo alcoxicarbonilo inferior; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo inferior; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo feniloxilo; un grupo fenilalcoxilo inferior; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxialquilo inferior; un grupo carbamoílo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo fenilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior; un grupo dihidrofurilo que puede tener un solo grupo oxo; grupo tiazolidinilalquilo inferior que puede tener dos grupos oxo; grupo imidazolilalcanoílo inferior y grupo piperidinilcarbonilo,
 20 (l) un grupo cianoalquilo inferior,
 (li) un grupo dihydroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y grupo oxo,
 (lii) un grupo alquilamino inferior sustituido con halógeno,
 35 (liii) un grupo alquiltio inferior-alquilo inferior,
 (liv) un grupo amidino que puede tener un grupo alquilo inferior,
 (lv) un grupo amidinoalquilo inferior,
 (lvi) un grupo alqueniloxialquilo inferior,
 (lvii) un grupo fenilamino que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno y un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno en el grupo fenilo,
 40 (lviii) un grupo fenilalquenilo inferior,
 (lix) un grupo piridilamino que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,
 (lx) un grupo fenilalquilo inferior (que puede tener como sustituyente/s en el grupo fenilo y/o el grupo alquilo inferior de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxilo inferior, grupo carbamoílo y un grupo alcoxicarbonilo inferior),
 45 (lxi) un grupo alquinilo inferior,
 (lxii) un grupo feniloxialquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo inferior, grupo *N*-alcoxi inferior-*N*-alquilo inferior, grupo carbamoílo y grupo oxopirrolidinilo como sustituyente/s en el grupo fenilo),
 50 (lxiii) un grupo isoxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (lxiv) un grupo dihydroindenilo,
 (lxv) un grupo fenilalcoxi inferior-alquilo inferior,
 55 (lxvi) un grupo tetrahidropiranilo,
 (lxvii) un grupo azetidínilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior y grupo benzoílo,
 (lxviii) un grupo azetidínilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior y grupo benzoílo,
 60 (lxix) un grupo tetrazolilo,
 (lxx) un grupo indolinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (lxxi) un grupo triazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquiltio inferior,
 (lxxii) un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos carbamoílo,
 65 (lxxiii) un grupo oxazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,
 (lxxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,

- (lxxv) un grupo bencimidazolilo,
 (lxxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxicarbonilo inferior y
 (lxxviii) un grupo oxazolilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,

- 5
 (29) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener, en el grupo amino, de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo fenilo, un grupo fenilalquilo inferior, un grupo benzoílo y un grupo aminoalquilo sustituido (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente/s en el grupo amino),
 10
 (30) un grupo alquilo inferior sustituido con un solo grupo carbamoílo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
 (31) un grupo tiocarbamoílo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior,
 15
 (32) un grupo sulfamoílo,
 (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior,
 20
 (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (36) un grupo imidazolilo,
 (37) un grupo triazolilo,
 (38) un grupo isoxazolilo,
 (39) un grupo piperidinilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alquilfenilsulfonilo inferior, un grupo oxo, un grupo hidroxilo y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior y un grupo alcanóilamino inferior-alcanóilo inferior,
 25
 (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo carboxialquilo inferior, un grupo alquilcarbamoíl inferior-alquilo inferior, un grupo carbamoílo, un grupo alcoxilo inferior, un grupo carboxilo, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior y un grupo benzoílo), un grupo piperidinilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior y un grupo benzoílo), un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos alquilo inferior como sustituyentes), un grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decilo, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que puede estar presentes un solo grupo alquilo inferior como sustituyente), un grupo piridilo, un grupo piridiloxilo, un grupo piridilalcoxilo inferior, un grupo tetrahidroquinolilo (en el que puede estar presentes un solo grupo oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo fenilalcoxilo inferior (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior y un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno), un grupo fenilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxilo inferior y un grupo hidroxilo), grupo feniloxilo (que puede tener, en el grupo fenilo, de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), un grupo fenilalquilo inferior (en el grupo fenilo, pueden estar presentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno) y un grupo benzoílo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxilo inferior en el grupo fenilo),
 30
 (41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener, como sustituyentes, de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo hidroxialquilo inferior, grupo carbamoílo, un grupo hidroxilo, un grupo amino (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo benzoílo en el grupo amino), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo piperidilalquilo inferior, un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener un solo grupo alquilo inferior como sustituyente en el grupo piperazinilo), un grupo aminoalquilo inferior (que puede tener presentes de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo amino), grupo feniloxilo (que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxilo inferior sustituidos con halógeno en el grupo fenilo), un grupo feniloxialquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxilo inferior sustituidos con halógeno en el grupo fenilo) y un grupo tetrahidroquinolilo (en el que puede estar presente un grupo oxo),
 35
 (42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener, como sustituyentes, de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo cicloalquilo C3-C8, un grupo alcanóilo inferior, un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo aminoalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo amino), un grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo piperidilo), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo 1,3-dioxoranilalquilo inferior, un grupo tetrahidrofuralalquilo inferior, un grupo piridilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos

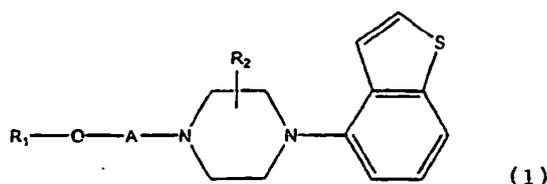
- fenilo como sustituyentes en el grupo alquilo inferior), un grupo imidazolilalquilo inferior, un grupo furilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilcarbonilalquilo inferior, un grupo piperidinilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyentes), un grupo piridilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciano y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como sustituyente/s en el grupo piridilo), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo fenilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo benzoílo, un grupo furilcarbonilo, un grupo alcoxycarbonilfenilo inferior y un grupo oxo,
- (43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,
 (44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo piridilo,
 (45) un grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,
 (46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo,
 (47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo piperidilalquilo inferior y un grupo fenilo,
 (48) un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos fenilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo inferior y un grupo ciano,
 (49) un grupo azabiciclo[3.2.2]nonilcarbonilo,
 (50) un grupo 8-azabiciclo[3.2.1]octilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos feniloxilo sustituidos o no sustituidos con halógeno,
 (51) un grupo indolinilcarbonilo,
 (52) un grupo tetrahydroquinolilcarbonilo,
 (53) un grupo tetrahidropirido[3,4-b]indolilcarbonilo,
 (54) un grupo morfolinilalquilo inferior,
 (55) un grupo piperazinilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior en el grupo piperazinilo,
 (56) un grupo morfolinilcarbonilalquilo inferior,
 (57) un grupo piperazinilcarbonilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior en el grupo piperazinilo,
 (58) un grupo oxo,
 (59) un grupo aminoalcoxilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior en el grupo amino),
 (60) un grupo alcoxi inferior-alcoxilo inferior,
 (61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo alcoxycarbonilo inferior,
 (62) un grupo morfolinilo,
 (63) un grupo 1,3,8-triazaspiro[4.5]decanilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo fenilo,
 (64) un grupo tetrahidropiridilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos piridilo,
 (65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener un solo grupo tioxo y
 (66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decanilo.
- 40 La presente invención proporciona un compuesto representado por la fórmula general (1), en la que A es un grupo alquilenilo inferior.
- La presente invención proporciona una composición farmacéutica que comprende un compuesto heterocíclico o la fórmula general (1) o una de sus sales según la presente invención como ingrediente activo y un vehículo farmacéuticamente aceptable.
- La composición farmacéutica según la presente invención se puede usar como composición farmacéutica para tratar o prevenir trastornos del sistema nervioso central.
- 50 La presente invención proporciona una composición farmacéutica según la presente invención que se puede usar como composición farmacéutica para tratar o prevenir trastornos del sistema nervioso central seleccionados del grupo que consiste en esquizofrenia, esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; trastorno emocional; trastorno psicótico; trastorno del estado de ánimo; trastorno bipolar de tipo I; trastorno bipolar de tipo II; depresión; depresión endógena; depresión principal; melancolía y depresión refractaria; trastorno distímico; trastorno ciclotímico; ataque de pánico; trastorno de pánico; agorafobia; fobia social; trastorno obsesivo-compulsivo; trastorno de estrés post-traumático, trastorno de ansiedad generalizada; trastorno de estrés agudo; histeria; trastorno de somatización; trastorno de conversión; trastorno de dolor; hipocondriasis; trastorno facticio; trastorno disociativo; disfunción sexual; trastorno del deseo sexual; trastorno de excitación sexual; disfunción eréctil; anorexia nerviosa; bulimia nerviosa; trastorno del sueño; trastorno de ajuste; alcoholismo; intoxicación por alcohol; toxicomanía; intoxicación por estimulantes; narcotismo; anhedonia; anhedonia iatrogénica; anhedonia por causa psíquica o mental; anhedonia asociada con depresión; anhedonia asociada con esquizofrenia; delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo asociado con la enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y otras enfermedades neurodegenerativas; deterioro cognitivo causado por la enfermedad de Alzheimer; enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; vómitos; mareo por movimiento; obesidad; migraña; dolor; retraso mental; trastorno de autismo (autismo); trastorno de Tourette; trastorno de tic; trastorno de déficit de atención/hiperactividad; trastorno de la conducta; y síndrome de Down.

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

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

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

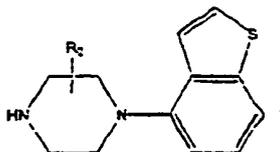
15 La presente invención proporciona un procedimiento de producción de un compuesto heterocíclico representado por la fórmula (1):



20 [en la que R₁, R₂ y A son como se definen en la reivindicación 1), o una de sus sales, caracterizado porque comprende una reacción de un compuesto representado por la fórmula:



25 [en la que R₂ y A son como se definen anteriormente, y X₁ representa un átomo de halógeno o un grupo que produce una reacción de sustitución igual a la producida en un átomo de halógeno) o una de sus sales con un compuesto representado por la fórmula:



30 en la que R₂ es como se define anteriormente] o una de sus sales.

Mejor modo de llevar a cabo la invención

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

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

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

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

50 El grupo alquenileno inferior es un grupo alquenileno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo vinileno, grupo 1-propenileno, grupo 1-metil-1-propenileno, grupo 2-metil-1-propenileno, grupo 2-propenileno, grupo 2-butenileno, grupo 1-butenileno, grupo 3-butenileno, grupo 2-pentenileno, grupo 1-pentenileno, grupo 3-pentenileno, grupo 4-pentenileno, grupo

1,3-butadienileno, grupo 1,3- pentadienileno, grupo 2-penten-4-inileno, grupo 2-hexenileno, grupo 1-hexenileno, grupo 5-hexanileno, grupo 3-hexenileno, grupo 4-hexenileno, grupo 3,3-dimetil-1-propenileno, grupo 2-etil-1-propenileno, grupo 1,3,5-hexatrienileno, grupo 1,3-hexadienileno y grupo 1,4-hexadienileno.

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

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

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

- 25 El grupo alcoxilo inferior es un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metoxilo, grupo etoxilo, grupo *n*-propoxilo, grupo isopropoxilo, grupo *n*-butoxilo, grupo isobutoxilo, grupo *terc*-butoxilo, grupo *sec*-butoxilo, grupo *n*-pentiloxilo, grupo isopentiloxilo, grupo neopentiloxilo, grupo *n*-hexiloxilo, grupo isohexiloxilo y grupo 3-metilpentiloxilo.

- 30 Los ejemplos del grupo arilo incluyen un grupo fenilo, grupo fenilo sustituido, grupo bifenilo, grupo bifenilo sustituido, grupo naftilo y grupo naftilo sustituido. Los ejemplos del sustituyente de un grupo arilo incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo inferior lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un átomo de halógeno según lo ilustrado anteriormente y un grupo amino. En el grupo arilo, pueden estar presentes de 1 a 7, preferentemente, de 1 a 5, más preferentemente, de 1 a 2 sustituyentes de al menos uno de estos tipos. Los ejemplos específicos del grupo arilo pueden incluir un grupo fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)bifenilo, grupo (2- ó 2-)naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metilfenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)etilfenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)-*n*-propilfenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)-*n*-butilfenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)-*n*-pentilfenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)-*n*-hexilfenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)isobutilfenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)-*terc*-butilfenilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')metil-2-bifenilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')metil-3-bifenilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')metil-4-bifenilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')etil-2-bifenilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')etil-3-bifenilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')etil-4-bifenilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*n*-propil-2-bifenilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*n*-propil-3-bifenilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*n*-propil-4-bifenilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*n*-butil-2-bifenilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*n*-butil-3-bifenilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*n*-butil-4-bifenilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*n*-pentil-2-bifenilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*n*-pentil-3-bifenilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*n*-pentil-4-bifenilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*n*-hexil-2-bifenilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*n*-hexil-3-bifenilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*n*-hexil-4-bifenilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')isobutil-2-bifenilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')isobutil-3-bifenilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')isobutil-4-bifenilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*terc*-butil-2-bifenilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*terc*-butil-3-bifenilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6')-*terc*-butil-4-bifenilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)etil-1-naftilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)etil-2-naftilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)-*n*-propil-1-naftilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)-*n*-propil-2-naftilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)-*n*-butil-1-naftilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)-*n*-butil-2-naftilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)-*n*-pentil-1-naftilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)-*n*-pentil-2-naftilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)-*n*-hexil-1-naftilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)-*n*-hexil-2-naftilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)isobutil-1-naftilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)isobutil-2-naftilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)-*terc*-butil-1-naftilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)-*terc*-butil-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)clorofenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)fluorofenilo, grupo (2-, 3- ó 4-) bromofenilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)cloro-1-naftilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)cloro-2-naftilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)fluoro-1-naftilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)fluoro-2-naftilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)bromo-1-naftilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)bromo-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)aminofenilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)amino-1-naftilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)amino-2-naftilo, grupo 2,3- dimetilfenilo, grupo 3,4-dimetilfenilo, grupo 2,4-dimetilfenilo, grupo 2,5-dimetilfenilo, grupo 2,6-dimetilfenilo, grupo 2,4,6-trimetilfenilo, grupo 3,4,5-trimetilfenilo, grupo 2,3,4,5-tetraetilfenilo, grupo pentametilfenilo, grupo 2,4-dimetil-1-naftilo, grupo 2,3-dimetil-1-naftilo, grupo 3,4-dimetil-1-naftilo, grupo 3,5,7-trietilnaftilo, grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftilo, grupo 2,3,4,5,7-pentametil-1-naftilo, grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftilo, grupo heptametil-1-naftilo, grupo 2,3-diaminofenilo, grupo 2,4,6-triaminofenilo y grupo 2-metil-5-cloro-1-naftilo.

- Los ejemplos del grupo ariloxilo incluyen un grupo feniloxilo, grupo feniloxilo sustituido, grupo bifeniloxilo, grupo bifeniloxilo sustituido, grupo naftiloxilo y grupo naftiloxilo sustituido. Los ejemplos del sustituyente de un grupo ariloxilo incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo inferior lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un átomo de halógeno según lo ilustrado anteriormente y un grupo amino. En el grupo arilo, pueden estar presentes de 1 a 7, preferentemente, de 1 a 5, más preferentemente, de 1 a 2 sustituyentes de al menos uno de estos tipos. Los ejemplos específicos de los grupos ariloxilo incluyen un grupo feniloxilo, grupo (2-, 3- ó 4-)bifeniloxilo, grupo (1 - ó 2-)naftiloxilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metilfeniloxilo, grupo (2-, 3- ó 4-)etilfeniloxilo, grupo (2-, 3- ó 4-)n-propilfeniloxilo, grupo (2-, 3- ó 4-)n-butilfeniloxilo, grupo (2-, 3- ó 4-)n-pentilfeniloxilo, grupo (2-, 3- ó 4-)n-hexilfeniloxilo, grupo (2-, 3- ó 4-)isbutilfeniloxilo, grupo (2-,3- ó 4-)terc-butilfeniloxilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)metil-2-bifeniloxilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó a')metil-3-bifeniloxilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)metil-4-bifeniloxilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-2-bifeniloxilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-3-bifeniloxilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-4-bifeniloxilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-propil-2-bifeniloxilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-propil-3-bifeniloxilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-propil-4- bifeniloxilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-butil-2-bifeniloxilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-butil-3-bifeniloxilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-butil-4-bifeniloxilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-pentil-2-bifeniloxilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-pentil-3-bifeniloxilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-pentil-4-bifeniloxilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-hexil-2-bifeniloxilo, grupo (2-,4-,5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-hexil-3-bifeniloxilo, (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-hexil-4-bifeniloxilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-2-bifeniloxilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-3-bifeniloxilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-4-bifeniloxilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)terc-butil-2-bifeniloxilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)terc-butil-3-bifeniloxilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)terc-butil-4-bifeniloxilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-1-naftiloxilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-2-naftiloxilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-propil-1-naftiloxilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-propil-2-naftiloxilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-butil-1-naftiloxilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-butil-2-naftiloxilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-pentil-1-naftiloxilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-pentil-2-naftiloxilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexil-1-naftiloxilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexil-2-naftiloxilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-1-naftiloxilo, grupo (1 -, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-2-naftiloxilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-1-naftiloxilo, grupo (1 -, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-2-naftiloxilo, grupo (2-, 3- ó 4-)clorofeniloxilo, grupo (2-, 3- ó 4-)fluorofeniloxilo, grupo (2-, 3- ó 4-)bromofeniloxilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-1-naftiloxilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-2-naftiloxilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-,o 8-)fluoro-1-naftiloxilo, grupo (1 -, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-2-naftiloxilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)bromo-1-naftiloxilo, grupo (1 -, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)bromo-2-naftiloxilo, grupo (2-, 3- ó 4-)aminofeniloxilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)amino-1-naftiloxilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)amino-2-naftiloxilo, grupo 2,3-dimetilfeniloxilo, grupo 3,4-dimetilfeniloxilo, grupo 2,4-dimetilfeniloxilo, grupo 2,5-dimetilfeniloxilo, grupo 2,6-dimetilfeniloxilo, grupo 2,4,6-trimetilfeniloxilo, grupo 3,4,5-trimetilfeniloxilo, grupo 2,3,4,5-tetraetilfeniloxilo, grupo pentametilfeniloxilo, grupo 2,4-dimetil-1-naftiloxilo, grupo 2,3-dimetil-1-naftiloxilo, grupo 3,4-dimehil-1-naftiloxilo, grupo 2,5,7-trietil-1-naftiloxilo, grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftiloxilo, grupo 2,3,4,5,7-pentametil-1-naftiloxilo, grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetil-naftiloxilo, grupo heptametil-1-naftiloxilo, grupo 2,2-diaminofeniloxilo, grupo 2,4,6-triaminofeniloxilo y grupo 2-metil-5-cloro-1-naftiloxilo.
- El grupo alquiltio inferior es un grupo alquiltio lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metiltio, grupo etiltio, grupo n-propiltio, grupo isopropiltio, grupo n-butiltio, grupo terc-butiltio, grupo n-pentiltio y grupo n-hexiltio.
- Los ejemplos del grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno incluyen un grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente sustituido con de 1 a 7, preferentemente, de 1 a 3 átomos de halógeno. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo fluorometoxilo, grupo difluorometoxilo, grupo trifluorometoxilo, grupo clorometoxilo, grupo diclorometoxilo, grupo triclorometoxilo, grupo bromometoxilo, grupo dibromometoxilo, grupo diclorofluorometoxilo, grupo 2,2,2-trifluoroetoxilo, grupo pentafluoroetoxilo, grupo 2-cloroetoxilo, grupo 3,3,3-trifluoropropoxilo, grupo heptafluoropropoxilo, grupo heptafluoroisopropoxilo, grupo 3-cloropropoxilo, grupo 2-cloropropoxilo, grupo 3-bromopropoxilo, grupo 4,4,4-trifluorobutoxilo, grupo 4,4,4,3-pentafluorobutoxilo, grupo 4-clorobutoxilo, grupo 4-bromobutoxilo, grupo 2-clorobutoxilo, grupo 5,5,5-trifluoropentoxilo, grupo 5-cloropentoxilo, grupo 6,6,6-trifluorohexiloxilo y grupo 6-clorohexiloxilo.
- Los ejemplos del grupo protector de un grupo hidroxilo incluyen un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo alcanoil inferior (un grupo alcanoil lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) y un grupo fenilalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono.
- Los ejemplos del grupo hidroxilo protegido incluyen un grupo metoxilo, grupo etoxilo, grupo n-propoxilo, grupo isopropoxilo, grupo n-butoxilo, grupo i-sobutaxilo, grupo terc-butoxilo, grupo sec-butoxilo, grupo n-pentiloxilo, grupo isopentiloxilo, grupo neopentiloxilo, grupo n-hexiloxilo, grupo isohexiloxilo, grupo 3-metilpentiloxilo, grupo alcanoiloxilo inferior y grupo fenilalcoxilo inferior. Los ejemplos específicos incluyen un grupo formiloxilo, grupo acetiloxilo, grupo propioniloxilo, grupo butiriloxilo, grupo isobutiriloxilo, grupo pentanoiloxilo, grupo terc-butilcarboniloxilo, grupo hexanoiloxilo, grupo benciloxilo, grupo 2-feniletaxilo, grupo 1-feniletaxilo, grupo 3-fenilpropoxilo, grupo 4-fenilbutoxilo, grupo 5-fenilpentiloxilo, grupo 6- fenilhexiloxilo, grupo 1,1-dimetil-2-feniletaxilo y grupo 2-metil-3-fenilpropoxilo.

Los ejemplos del grupo hidroxialquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente que tiene de 1 a 5, preferentemente, de 1 a 3 grupos hidroxilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo hidroximetilo, grupos 2-hidroxietilo, grupo
 5 1-hidroxietilo, grupo 3-hidroxiopropilo, grupo 2,5-dihidroxiopropilo, grupo 4-hidroxi-butilo, grupo 3,4-dihidroxi-butilo, grupo 1,1-dimetil-2-hidroxietilo, grupo 5-hidroxipentilo, grupo 6-hidroxihexilo, grupo 3,3-dimetil-3-hidroxiopropilo, grupo 2-metil-3-hidroxiopropilo, grupo 2,3,4-trihidroxi-butilo y grupo perhidroxihexilo.

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

Los ejemplos del grupo hidroxialquilo inferior protegido incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado
 15 anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 5, preferentemente, de 1 a 3 grupos hidroxilo protegidos según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo alcoxilo inferior, un grupo alcanóloxilo inferior o un grupo fenilalcoxilo inferior). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metoximetilo, grupo 2-metoxietilo, grupo 2-etoxietilo, grupo 2-*n*-propoxietilo, grupo 2-isopropoxietilo, grupo 2-*n*-butoxietilo, grupo 2-isobutoxietilo, grupo 2-*terc*-butoxietilo, grupo 2-*sec*-butoxietilo, grupo 2-*n*-pentiloxietilo, grupo
 20 2-isopentiloxietilo, grupo 2-neopentiloxietilo, grupo 2-*n*-hexiloxietilo, grupo 2-isohexiloxietilo, grupo 2-(3-metilpentiloxi)etilo, grupo 2-formiloxietilo, grupo 2-acetiloxietilo, grupo 2-propioniloxietilo, grupo 2-butililoxietilo, grupo 2-isobutililoxietilo, grupo 2-pentanoiloxietilo, grupo 2-*terc*-butilcarbonyloxietilo, grupo 2-hexanoiloxietilo, grupo 2-benciloxietilo, grupo 2-(2-feniletoksi)etilo, grupo 2-(1-feniletoksi)etilo, grupo 2-(5-fenilpropoxi)etilo, grupo 2-(4-fenilbutoxi)etilo, grupo 2-(5-fenilpentiloxi)etilo, grupo 3-(6-fenilhexiloxi)etilo, grupo 2-(1,1-dimetil-2-feniletoksi)etilo,
 25 grupo 2-(2-metil-3-fenilpropoxi)etilo, grupo 3-etoxipropilo, grupo 2,3-dietoxipropilo, grupo 4-etoxibutilo, grupo 3,4-dietoxibutilo, grupo 1,1-dimetil-2-etoxietilo, 5-etoxipentilo, grupo 6-etoxihexilo, grupo 3,3-dimetil-3-etoxipropilo, grupo 2-metil-3-etoxipropilo y grupo 2,3,4-trietoxibutilo.

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

El grupo alcoxicarbonilo inferior es un grupo alcoxicarbonilo lineal o ramificado cuyo resto alcoxilo inferior es como se
 35 ilustra anteriormente y tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metoxicarbonilo, grupo etoxicarbonilo, grupo *n*-proxicarbonilo, grupo isopropoxicarbonilo, grupo *n*-butoxicarbonilo, grupo isobutoxicarbonilo, grupo *terc*-butoxicarbonilo, grupo *sec*-butoxicarbonilo, grupo *n*-pentiloxicarbonilo, grupo neopentiloxilo, grupo *n*-hexiloxicarbonilo, grupo isohexiloxicarbonilo y grupo 3-metilpentiloxicarbonilo.

El grupo alquilsulfonilo inferior es un grupo alquilsulfonilo lineal o ramificado cuyo resto alquilo inferior es como se
 40 ilustra anteriormente y tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metilsulfonilo, grupo etilsulfonilo, grupo *n*-propilsulfonilo, grupo isopropilsulfonilo, grupo *n*-butil sulfonilo, grupo isobutil sulfonilo, grupo *terc*-butil sulfonilo, grupo *sec*-butil sulfonilo, grupo *n*-pentilsulfonilo, grupo isopentilsulfonilo, grupo neopentilsulfonilo, grupo *n*-hexilsulfonilo, grupo isohexilsulfonilo y grupo 3-metilpentilsulfonilo.

El grupo alquilcarbamoilo inferior es un grupo carbamoilo que tiene de 1 a 2 grupos alquilo inferior según lo ilustrado
 45 anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen 1 a 6 átomos de carbono) como sustituyente/s. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo *N*-metilcarbamoilo, grupo *N,N*-dimetilcarbamoilo, grupo *N*-etilcarbamoilo, grupo *N,N*-dietilcarbamoilo, grupo *N*-*n*-propilcarbamoilo, grupo *N*-*n*-butilcarbamoilo, grupo *N*-*n*-pentilcarbamoilo, grupo *N*-*n*-hexilcarbamoilo, grupo *N*-isobutilcarbamoilo, grupo *N*-*terc*-butil carbamoilo y grupo
 50 *N,N*-di-*n*-propilcarbamoilo.

Los ejemplos del grupo aminoalcanoilo inferior incluyen un grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo
 55 alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 (preferentemente 1) grupos amino. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo aminoacetilo, grupo 3-aminopropionilo, grupo 4-aminobutirilo, grupo 3,4-diaminobutirilo, grupo 3,3-dimetil-3-amino-propionilo, grupo 4-aminobutirilo y grupo 5-aminovalerilo.

Los ejemplos del grupo alcanóilamino inferior-alcanoilo inferior incluyen un grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado
 60 anteriormente (un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 5 átomos de carbono) cuyo resto alcanóilo inferior tiene de 1 a 3 (preferentemente 1) grupos alcanóilamino inferior según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo *N*-formilaminoacetilo, grupo *N*-acetilaminoacetilo, grupo *N*-propionilaminoacetilo, grupo 3-(*N*-acetilamino)propionilo, grupo 4-(*N*-acetilamino)butirilo, grupo 3,4-di(*N*-acetilamino)butirilo, grupo 3,3-demetil-3-(*N*-propinilamino)propionilo, grupo 4-(*N*-formilamino)butirilo y grupo 5-(*N*-acetilamino)valerilo.

Los ejemplos del grupo alcoxicarbonilamino inferior-alcanoilo inferior incluyen un grupo alcanóilo inferior según lo
 65 ilustrado anteriormente (un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) cuyo resto alcoxicarbonilo inferior tiene de 1 a 3 (preferentemente 1) grupos alcoxicarbonilamino inferior según lo ilustrado

anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo *N*--metoxicarbonilaminoaceto, grupo *N*--etoxicarbonilaminoaceto, grupo *N*--*terc*-butoxicarbonilaminoaceto, grupo 3-(*N*-metoxicarbonilamino)propionilo, grupo 4-(*N*-acetilamino)butirilo, grupo 3,4-di(*N*-acetilamino)butirilo, grupo 3,3-dimetil-3-(*N*-propinilamino)propionilo, grupo 4-(*N*-formilamino)butirilo y 5-(*N*-acetilamino)valerilo. Los ejemplos del grupo amino que tiene como sustituyente un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, grupo alcanoilo inferior, grupo alcocicarbonilo inferior, grupo alquilsulfonilo inferior, grupo carbamoilo, grupo alquilcarbamoilo inferior, aminoalcanoilo inferior, grupo alcanoilamin inferior-alcanoilo y el grupo alcocicarbonilamin inferior-alcanoilo incluyen un grupo amino que tiene como sustituyente de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo alcanoilo inferior según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo alcocicarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente; un grupo alquilsulfonilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilsulfonilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo carbamoilo; un grupo alquilcarbamoilo inferior según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo carbamoilo que tiene como sustituyente de 1 a 2 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo aminoalcanoilo inferior según lo ilustrado anteriormente; un grupo alcanoilamino inferior-alcanoilo inferior según lo ilustrado anteriormente; y un grupo alcocicarbonilamin inferior-alcanoilo inferior según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo amino, grupo *N*--metilamino, grupo *N,N*-dimetilamino, grupo *N*--etilamino, grupo *N*--*n*-propilamino, grupo *N*--isopropilamino, grupo *N*--formilamino, grupo *N*--acetilamino, grupo *N*--*terc*-butoxicarbonilamino, grupo *N*--metoxicarbonilamino, grupo *N*--metilsulfonilamino, grupo *N*--etilsulfonilamino, grupo *N*--metil-*N*-acetilamino, grupo 5-metil-*N*-metoxicarbonilamino, grupo *N*--[*N,N*-dimetilcarbamoil]amino, grupo *N*--carbamoilamino, grupo *N*--[*N*-metilcarbamoil]amino, *N*--[*N,N*-diethylcarbamoil]amino, grupo *N*--[aminoacetil]amino, grupo *N*--[[*N*-formilamino]acetil]amino, grupo *N*--[[*N*-acetilamino]acetil]amino, grupo *N*--[[*N*-metoxicarbonilamino]acetil]amino y grupo *N*--[[*N*-*terc*-butoxicarbonilamino]acetil]amino.

Los ejemplos del grupo arilsulfonilo que puede tener un grupo alquilo inferior en un grupo arilo incluyen un grupo arilsulfonilo cuyo resto arilo es fenilo, bifenilo, naftilo o similar, y en el que pueden estar presentes de 1 a 7, preferentemente, de 1 a 5, más preferentemente, de 1 a 2 grupos alquilo lineales o ramificados que tengan de 1 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos específicos del grupo arilsulfonilo que puede tener un grupo alquilo inferior en un grupo arilo incluyen un grupo fenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)bifenilsulfonilo, grupo (1 - ó 2-)naftilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metilfenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)etilfenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-propilfenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-butilfenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-pentilfenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-hexilfenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)isobutilfenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*terc*-butilfenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)metil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)metil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)metil-4-bifenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-4-bifenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-propil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-propil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-propil-4-bifenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-butil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-butil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-butil-4-bifenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-pentil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-pentil-3-bifenil-sulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-pentil-4-bifenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-hexil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-hexil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-hexil-4-bifenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-4-bifenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*terc*-butil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*terc*-butil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*terc*-butil-4-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-propil-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-propil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-butil-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-butil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-pentil-1-naftilsulfonilo, grupo (1 -, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-pentil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-hexil-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-hexil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-1-naftilsulfonilo, grupo (1 -, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*terc*-butil-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*terc*-butil-2-naftilsulfonilo, grupo 2,3-dimetilfenilsulfonilo, grupo 3,4-dimetilfenilsulfonilo, grupo 2,4-dimetilfenilsulfonilo, grupo 2,5-dimetilfenilsulfonilo, grupo 2,6-dimetilfenilsulfonilo, grupo 2,4,6-trimetilfenilsulfonilo, grupo 3,4,5-trimetilfenilsulfonilo, grupo 2,3,4,5-tetraetilfenilsulfonilo, grupo pentametilfenilsulfonilo, grupo 2,4-dimetil-1-naftilsulfonilo, grupo 2,3-dimetil-naftilsulfonilo, grupo 3,4-dimetil-1-naftilsulfonilo, grupo 3,5,7-trietil-1-naftilsulfonilo, grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftilsulfonilo, grupo 2,3,4,5,7-pentametil-1-naftilsulfonilo, grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftilsulfonilo y grupo heptametil-1-naftilsulfonilo.

Los ejemplos de un grupo carboxilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 (preferentemente 1) grupos carboxilo. Sus ejemplos específicos incluyen grupo carboximetilo, grupo 2-carboxietilo, grupo 1-carboxietilo, grupo 1-carboxi-1-metiletilo, grupo 3-carboxipropilo, grupo 2,3-dicarboxipropilo, grupo 4-carboxibutilo, grupo 3,4-dicarboxibutilo, grupo 1,1-dimetil-2-carboxietilo,5-carboxipentilo, grupo 6-carboxihexilo, grupo

3,3-dimetil-3-carboxipropilo, grupo 2-metil-3-carboxipropilo y grupo 2,3,4-tricarboxibutilo.

Los ejemplos de un grupo alcoxicarbonil inferior-alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 5 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) grupos alcoxicarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metoxicarbonilmetilo, grupo etoxicarbonilmetilo, grupo 1-metoxicarboniletilo, grupo 2-metoxicarboniletilo, grupo 2-etoxicarboniletilo, grupo 1-etoxicarboniletilo, grupo 3-metoxicarbonilpropilo, grupo 3-etoxicarbonilpropilo, grupo 4-etoxicarbonilbutilo, grupo 5-isopropoxicarbonilpentilo, grupo 6-*n*-propoxicarbonilhexilo, grupo 1,1-dimetil-2-*n*-butoxicarboniletilo, grupo 1-metil-1-metoxicarboniletilo, grupo 2-metil-1-metoxicarbonilpropilo, grupo 2-metil-3-*terc*-butoxicarbonilpropilo, grupo 3-metil-1-metoxicarbonilbutilo, grupo dietoxicarbonilmetilo, grupo 1,2-dietoxicarboniletilo, grupo 2-*n*-pentiloxicarboniletilo y grupo *n*-hexiloxicarbonilmetilo.

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

Los ejemplos del grupo carboxilalqueno inferior incluyen un grupo alqueno inferior según lo ilustrado anteriormente que tiene de 1 a 2, preferentemente 1, grupos carboxilo y que incluye configuraciones tanto *trans* como *cis* (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-carboxietenilo, grupo 3-carboxi-2-propenilo, grupo 4-carboxi-2-butanilo, grupo 4-carboxi-3-butenilo, grupo 4-carboxi-1,3-butadienilo, grupo 5-carboxi-1,3,5-hexatrienilo, grupo 5-carboxi-2,4-hexadienilo, grupo 5-carboxi-3-pentenilo y grupo 3-carboxi-1-propenilo.

Los ejemplos del grupo alcoxicarbonil inferior-alqueno inferior incluyen un grupo alqueno inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 grupos alcoxicarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente y que incluye configuraciones tanto *trans* como *cis*. Los ejemplos específicos del grupo alcoxicarbonil inferior-alqueno inferior incluyen un grupo 2-metoxicarboniletlenilo, grupo 2-etoxicarboniletlenilo, grupo 1-etoxicarboniletlenilo, grupo 3-metoxicarbonil-2-propenilo, grupo 3-etoxicarbonil-2-propenilo, grupo 4-etoxicarbonil-2-butenilo, grupo 4-etoxicarbonil-1,3-butadienilo, grupo 5-isopropoxicarbonil-3-pentenilo, grupo 6-*n*-propoxicarbonil-1,3,5-hexatrienilo, grupo 1,1-dimetil-2-*n*-butoxicarboniletlenilo, grupo 2-metil-5-*terc*-butoxicarbonil-2-propenilo y grupo 2-*n*-pentiloxicarboniletlenilo.

Los ejemplos del grupo carbamoil inferior-alqueno inferior incluyen un grupo alqueno inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 3 enlaces dobles) que tiene de 1 a 3, preferentemente 1, grupos carbamoilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-carbamoiletlenilo, grupo 3-carbamoil-2-propenilo, grupo 4-carbamoil-2-butenilo, grupo 4-carbamoil-3-butenilo, grupo 4-carbamoil-1,2-butadienilo, grupo 5-carbamoil-1,3,5-hexatrienilo, grupo 5-carbamoil-2,4-hexadienilo, grupo 5-carbamoil-3-pentenilo y grupo 3-carbamoil-1-propenilo.

Los ejemplos de grupo carbamoil-alqueno inferior que puede tener como sustituyente un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno incluyen un grupo alqueno inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y 2 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferentemente 1, grupos carbamoilo, que puede tener, en el grupo carbamoilo, de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, preferentemente, que tiene de 1 a 7, preferentemente, de 1 a 3 sustituyentes de átomos de halógeno). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-carbamoiletlenilo, grupo 2-(*N*-metilcarbamoil)etenilo, grupo 2-(*N*-etilcarbamoil)etenilo, grupo 2-(*N,N*-dimetilcarbamoil)etenilo y grupo 2-[*N*-(2,2,2-trifluoroetil)carbamoil]etenilo.

Los ejemplos del grupo alcoxi inferior-alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferentemente 1, grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos

de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metoximetilo, grupo 2-metoxietilo, grupo 1-etoxietilo, grupo 2-etoxietilo, grupo 2-isobutoxietilo, grupo 2,2-dimetoxietilo, grupo 2-metoxi-1-metiletilo, grupo 2-metoxi-1-etiletilo, grupo 2-metoxipropilo, grupo 3-etoxipropilo, grupo 2-isopropoxietilo, grupo 3-isopropoxipropilo, grupo 3-*n*-butoxipropilo, grupo 4-*n*-propoxibutilo, grupo 1-metil-3-*iso*-butoxipropilo, grupo 1,1-dimetil-2-*nc*-pentiloxietilo, grupo 5-*n*-hexiloxipentilo, grupo 6-metoxihexilo, grupo 1-etoxiisopropilo y grupo 2-metil-3-metoxioropilo.

Los ejemplos del grupo ariloxialquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferentemente 1, grupos ariloxilo cuyo resto arilo es fenilo, bifenilo, naftilo o similar. Los ejemplos de sustituyente para un grupo arilo incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un átomo de halógeno según lo ilustrado anteriormente y un grupo amino. En un anillo arilo, pueden estar presentes de uno a siete sustituyentes de al menos uno de estos tipos. Los ejemplos específicos del ariloxialquilo inferior incluyen a grupo fenoximetilo, grupo 2-fenoxietilo, grupo 2-[(1- ó 2-)naftiloxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3-, ó 4-)metilfenoxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)etilfenoxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)*n*-propilfenoxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)*n*-butilfenoxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)pentilfenoxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3-, ó 4-)hexilfenoxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)isobutilfenoxi] etilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)*terc*-butilfenoxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-1-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-2-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-1-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-2-naftiloxietilo, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-propil-1-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-propil-2-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-butil-1-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-butil-2-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-pentil-1-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-pentil-2-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-hexil-1-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-hexil-2-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-1-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-2-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*terc*-butil-1-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*terc*-butil-2-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)clorofenoxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)fluorofenoxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)bromofenoxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-1-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-2-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-1-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-2-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-) bromo-1-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)bromo-2-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)aminofenoxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)amino-1-naftiloxi]etilo, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)amino-2-naftiloxi]etilo, grupo 2-(2,3-dimetilfenoxi)etilo, grupo 2-(3,4-dimetilfenoxi)etilo, grupo 2-(2,4-dimetilfenoxi)etilo, grupo 2-(2,5-dimetilfenoxi)etilo, grupo 2-(2,6-dimetilfenoxi)etilo, grupo 2-(2,4,6-trimetilfenoxi)etilo, grupo 2-(3,4,5-trimetilfenoxi)etilo, grupo 2-(2,3,4,5-tetraetilfenoxi)etilo, grupo 2-(pentametilfenoxi)etilo, grupo 2-(2,4-dimetil-1-naftiloxi)etilo, grupo 2-(2,3-dimetil-1-naftiloxi)etilo, grupo 2-(3,4-dimetil-1-naftiloxi)etilo, grupo 2-(3,5,7-trietil-1-naftiloxi)etilo, grupo 2-(3,4,5,7-tetrametil-1-naftiloxi)etilo, grupo 2-(2,3,4,5,7-pentametil-1-naftiloxi)etilo, grupo 2-(2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftiloxi)etilo, grupo 2-(heptametil-1-naftiloxi)etilo, grupo 2-(2,3-diaminofenoxi)etilo, grupo 2-(2,4,6-triaminofenoxi)etilo, grupo 2-(2-metil-5-cloro-1-naftil)etilo, grupo 3-fenoxipropilo, grupo 2,3-difenoxipropilo, grupo 4-fenoxibutilo, grupo 3,4-difenoxibutilo, grupo 1,1-dimetil-2-fenoxietilo, grupo 5-fenoxipentilo, grupo 6-fenoxihexilo, grupo 3,3-dimetil-3-fenoxipropilo, grupo 2-metil-3-fenoxipropilo y grupo 2,3,4-trifenoxibutilo, grupo 3-[(1- ó 2-)naftiloxipropilo, grupo 2,3-di[(1- ó 2-)naftiloxi]propilo, grupo 4-[(1- ó 2-)naftiloxi]butilo, grupo 3,4-di[(1- ó 2-)naftiloxi]butilo, grupo 1,1-dimetil-2-[(1- ó 2-)naftiloxi]etilo, 5-[(1- ó 2-)naftiloxi]pentilo, grupo 6-[(1- ó 2-)naftiloxi]hexilo, grupo 3,3-dimetil-3-[(1- ó 2-)naftiloxi]propilo, grupo 2-metil-3-[(1- ó 2-)naftiloxipropilo y grupo 2,3,4-tri[(1- ó 2-)naftiloxi]butilo.

Los ejemplos del grupo aminoalquilo inferior que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, grupo alcanóilo inferior, grupo aroílo y grupo carbamoílo incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 5 (preferentemente 1) grupos amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), grupo aroílo según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, grupo benzoílo) según lo ilustrado anteriormente y grupo carbamoílo. Los ejemplos específicos del grupo alquilamino inferior incluyen un grupo aminometilo, grupo 2-aminoetilo, grupo 1-aminoetilo, grupo 3-aminopropilo, grupo 4-aminobutilo, grupo 5-aminopentilo, grupo 6-aminohexilo, grupo 1,1-dimetil-2-aminoetilo, grupo 2-metil-3-aminopropilo, grupo *N,N*-dimetilaminometilo, grupo *N*-metil-*N*-etilaminometilo, grupo *N*-metilaminometilo, grupo 2-(*N*-metilamino)etilo, grupo 1-metil-2-(*N,N*-dimetilamino)etilo, grupo 1-metil-2-(*N,N*-dietilamino)etilo, grupo 2-(*N,N*-dimetilamino)etilo, grupo 2-(*N,N*-dietilamino)etilo, grupo 2-(*N,N*-diisopropilamino)etilo, grupo 3-(*N,N*-dimetilamino)propilo, grupo 3-(*N,N*-dietilamino)propilo, grupo 2-(*N*-acetilamino)etilo, grupo 2-(*N*-metil-*N*-acetilamino)etilo, grupo 2-(*N*-metil-*N*-butirilamino)etilo, grupo 2-(*N*-metil-*N*-benzoilamino)etilo y grupo 2-(*N*-carbamoilamino)etilo.

Los ejemplos del grupo cicloalquilo C3-C8 incluyen un grupo ciclopropilo, grupo ciclobutilo, grupo ciclopentilo, grupo ciclohexilo, grupo cicloheptilo y grupo ciclooctilo.

Los ejemplos de grupo cicloalquilo C3-C8 que puede tener, como sustituyente, un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, grupo hidroxilo, grupo alcoxicarbonilo inferior y grupo fenilalcoxilo inferior incluyen un grupo cicloalquilo C3-C8 que puede tener de 1 a 3 (preferentemente 1) grupos como sustituyente/s seleccionados del grupo que consiste en:

3-)pirrolil]propilo, grupo 4-[1-*n*-propil-(2- ó 3-)pirrolil]butilo, grupo 5-[1-*n*-butil-(2- ó 3-)pirrolil]pentilo, grupo 6-[1-*n*-pentil-(2- ó 3-)pirrolil]hexilo, grupo [1,5-dimetil-(2-, 3- ó 4-)pirrolil]metilo, grupo [1,3,5-trimetil-2-pirrolil]metilo y grupo [1,2,4-trimetil-3-pirrolil]metilo.

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

15 Los ejemplos del grupo pirazolilalquilo inferior (que puede tener un sustituyente de un grupo alquilo inferior en el grupo pirazolilo) incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos pirazolilo, en los que pueden estar presentes de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) como sustituyente/s. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 3-pirazolilmetilo, grupo 2-(4-pirazolil)etilo, grupo 2-(1-pirazolil)etilo, grupo 1-(5-pirazolil)etilo, grupo 5-(3-pirazolil)propilo, grupo 4-(4-pirazolil)butilo, grupo 5-(1-pirazolil)pentilo, grupo 6-(5-pirazolil)hexilo, grupo 2-metil-3-(1-pirazolil)propilo, grupo 1,1-dimetil-2-(3-pirazolil)etilo, grupo 1-metil-3-pirazolilmetilo, grupo 1-etil-3-pirazolilmetilo, grupo 1-*n*-propil-3-pirazolilmetilo, grupo 1-*n*-butil-3-pirazolilmetilo, grupo 1-*n*-pentil-3-pirazolilmetilo, grupo 1-metil-4-pirazolilmetilo, grupo 5-metil-3-pirazolilmetilo, grupo 1-etil-4-pirazolilmetilo, grupo 1-*n*-propil-4-pirazolilmetilo, grupo 1-*n*-butil-4-pirazolilmetilo, grupo 1-*n*-hexil-4-pirazolilmetilo, grupo 3-metil-1-pirazolilmetilo, grupo 3-etil-1-pirazolilmetilo, grupo 3-*n*-propil-1-pirazolilmetilo, grupo 3-*n*-butil-1-pirazolilmetilo, grupo 1,5-dimetil-3-pirazolilmetilo, grupo 3,5-dimetil-4-pirazolilmetilo, grupo 3,4-dimetil-1-pirazolilmetilo, grupo 1,3-dimetil-5-pirazolilmetilo, grupo 3,4-dietil-1-pirazolilmetilo, grupo 3,4-di-*n*-propil-1-pirazolilmetilo, grupo 3,4-di-*n*-butil-1-pirazolilmetilo, grupo 1,3,5-trimetil-4-pirazolilmetilo, grupo 3,4,5-trimetil-1-pirazolilmetilo, grupo 3,4,5-trietil-1-pirazolilmetilo, grupo 3,4,5-tri-*n*-propil-1-pirazolilmetilo, grupo 3,4,5-tri-*n*-butil-1-pirazolilmetilo, grupo 1-metil-5-pirazolilmetilo, grupo 1-etil-5-pirazolilmetilo, grupo 1-*n*-propil-5-pirazolilmetilo, grupo 1-*n*-butil-5-pirazolilmetilo, grupo 2-(3-pirazolil)etilo, grupo 3-(3-pirazolil)propilo, grupo 4-(3-pirazolil)butilo, grupo 5-(3-pirazolil)pentilo, grupo 6-(3-pirazolil)hexilo, grupo 2-(1-(4-clorofenil)-3-pirazolil)etilo, grupo 3-(1-metil-3-pirazolil)propilo, grupo 3-(3-metil-4-pirazolil)propilo, grupo 3-(5-metil-4-pirazolil)propilo, grupo 3-(1,5-dimetil-3-pirazolil)propilo, grupo 3-(1-etil-3-pirazolil)propilo, grupo 3-(1-*n*-propil-3-pirazolil)propilo, grupo 3-(1-*n*-butil-3-pirazolil)propilo, grupo 4-(1-metil-3-pirazolil)butilo, grupo 4-(1-etil-3-pirazolil)butilo, grupo 4-(1-*n*-propil-3-pirazolil)butilo, grupo 4-(1-*n*-butil-3-pirazolil)butilo, grupo 5-(1-metil-3-pirazolil)pentilo, grupo 5-(1-etil-3-pirazolil)pentilo, grupo 5-(1-*n*-propil-3-pirazolil)pentilo, grupo 5-(1-*n*-butil-3-pirazolil)pentilo, grupo 6-(1-metil-3-pirazolil)hexilo, grupo 6-(1-etil-3-pirazolil)hexilo, grupo 6-(1-*n*-propil-3-pirazolil)hexilo y grupo 6-[1-(3-butil)-3-pirazolil]hexilo.

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

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

Los ejemplos del grupo pirazinilalquilo inferior (puede haber un grupo alquilo inferior como sustituyente en el grupo pirazinilo) incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos pirazinilo, en los que pueden estar presentes de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) como sustituyente/s. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-pirazinilmetilo, grupo 2-(2-pirazinil)etilo, grupo 1-(2-pirazinil)etilo, grupo 3-(2-pirazinil)propilo, grupo 4-(2-pirazinil)butilo, grupo 5-(2-pirazinil)pentilo, grupo 6-(2-pirazinil)hexilo, grupo 3-metil-3-(2-pirazinil)propilo, grupo 1,2-dimetil-2-(2-pirazinil)etilo, grupo 3-metil-2-pirazinilmetilo, grupo 3-etil-2-pirazinilmetilo, grupo 3-*n*-propil-2-pirazinilmetilo, grupo 3-*n*-butil-2-pirazinilmetilo, grupo 3-*n*-pentil-2-pirazinilmetilo, grupo 5-metil-2-pirazinilmetilo, grupo 5-etil-2-pirazinilmetilo, grupo 5-*n*-propil-2-pirazinilmetilo, grupo

	5- <i>n</i> -butil-2-pirazinilmetilo, grupo	6-metil-2-pirazinilmetilo, grupo	6-etil-2-pirazinilmetilo, grupo
	6- <i>n</i> -propil-2-pirazinilmetilo, grupo	6- <i>n</i> -butil-1-pirazinilmetilo, grupo	3,5-dimetil-2-pirazinilmetilo, grupo
	3,5-dietil-2-pirazinilmetilo, grupo	3,5- <i>n</i> -propil-2-pirazinilmetilo, grupo	3,5-di- <i>n</i> -butil-2-pirazinilmetilo, grupo
	2-(5-metil-2-pirazinil)etilo, grupo	2-(5-etil-2-pirazinil)etilo, grupo	2-(5- <i>n</i> -propil-2-pirazinil)etilo, grupo
5	2-(5- <i>n</i> -butil-2-pirazinil)etilo, grupo	3-(5-metil-2-pirazinil)propilo, grupo	3-(5-etil-2-pirazinil)propilo, grupo
	3-(5- <i>n</i> -propil-2-pirazinil)propilo, grupo	3-(5- <i>n</i> -butil-2-pirazinil)propilo, grupo	4-(5-metil-2-pirazinil)butilo, grupo
	4-(5-etil-2-pirazinil)butilo, grupo	4-(5- <i>n</i> -propil-2-pirazinil)butilo, grupo	4-(5- <i>n</i> -butil-2-pirazinil)butilo, grupo
	5-(5-metil-2-pirazinil)pentilo, grupo	5-(5-etil-2-pirazinil)pentilo, grupo	5-(5- <i>n</i> -propil-2-pirazinil)pentilo, grupo
	5-(5- <i>n</i> -butil-2-pirazinil)pentilo, grupo	6-(5-metil-2-pirazinil)hexilo, grupo	6-(5-etil-2-pirazinil)hexilo, grupo
10	6-(5- <i>n</i> -propil-2-pirazinil)hexilo y grupo	6-(5- <i>n</i> -butil-2-pirazinil)hexilo.	

Los ejemplos del grupo pirrolidinilalquilo inferior (puede estar presente un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior como sustituyente en el grupo pirrolidinilo) incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos pirrolidinilo, en los que pueden estar presentes de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) como sustituyente/s. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo [(1-, 2- ó 3-)pirrolidinil]metilo, grupo 2-[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinil]etilo, grupo 1-[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinil]etil, grupo 3-[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinil]propilo, grupo 4-[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinil]butilo, grupo 5-[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinil]pentilo, grupo 6-[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinil]hexilo, grupo 1-metil-2-[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinil]etilo, grupo 1,1-dimetil-2-[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinil]etilo, grupo 2-metil-3-[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinil]propilo, grupo 1-metil-(2- ó 3-)pirrolidinilmetilo, grupo 1-etil-(2- ó 3-)pirrolidinilmetilo, grupo 1-*n*-propil-(2- ó 3-)pirrolidinilmetilo, grupo 1-*n*-butil-(2- ó 2-)pirrolidinilmetilo, grupo 1-*n*-pentil-(2- ó 3-)pirrolidinilmetilo, grupo 1-*n*-hexil-(2- ó 3-)pirrolidinilmetilo, grupo 2-metil-1-pirrolidinilmetilo, grupo 2-etil-1-pirrolidinilmetilo, grupo 2-*n*-propil-1-pirrolidinilmetilo, grupo 2-*n*-butil-1-pirrolidinilmetilo, grupo 2-*n*-pentil-1-pirrolidinilmetilo, grupo 2-*n*-hexil-1-pirrolidinilmetilo, grupo 3-metil-2-pirrolidinilmetilo, grupo 3-etil-2-pirrolidinilmetilo, grupo 3-*n*-propil-2-pirrolidinilmetilo, grupo 3-*n*-butil-2-pirrolidinilmetilo, grupo 1,5-dimetil-(2- ó 3-)pirrolidinilmetilo, grupo 1,5-di-etil-(2- ó 3-)pirrolidinilmetilo, grupo 1,5-di-*n*-propil-(2- ó 3-)pirrolidinilmetilo, grupo 1,5-di-*n*-butil-(2- ó 3-)pirrolidinilmetilo, grupo 1,4,5-trietil-(2- ó 3-)pirrolidinilmetilo, grupo 1,4,5-tri-*n*-propil-(2- ó 3-)pirrolidinilmetilo, grupo 1,4,5-tri-*n*-butil-(2- ó 3-)pirrolidinilmetilo, grupo 3-[3-oxo-(1-pirrolidinil)propilo], grupo 3-[5-oxo-(2-, 3- ó 4-)pirrolidinil]propilo y grupo 3-[1-metil-5-oxo-(2-, 3- ó 4-)pirrolidinil]propilo.

Los ejemplos del grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener como sustituyente en el grupo piperidilo, un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanóilo inferior) incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos piperidilo que tienen de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos como sustituyente/s seleccionados del grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) en el/los grupo/s piperidilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)piperidilmetilo, grupo 2-[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]etilo, grupo 2-[1-benzoil-(2-, 3- ó 4-)piperidil]etilo, grupo 2-[1-acetil-(2-, 3- ó 4-)piperidil]etilo, grupo 2-[1-butil-(2-, 3- ó 4-)piperidil]etilo, grupo 1-[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]etilo, grupo 3-[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]propilo, grupo 4-[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]butilo, grupo 1,1-dimetil-2-[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]etilo, grupo 5-[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]pentilo, grupo 6-[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]hexilo, grupo 1-[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]isopropilo y grupo 2-metil-3-[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]propilo.

Los ejemplos del grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente en el grupo piperazinilo) incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos piperazinilo, en los que pueden estar presentes de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) como sustituyente/s. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1-piperazinilmetilo, grupo 2-piperazinilmetilo, grupo 2-(1-piperazinil)etilo, grupo 2-(2-piperazinil)etilo, grupo 1-(1-piperazinil)etilo, grupo 1-(2-piperazinil)etilo, grupo 2-(1-piperazinil)propilo, grupo 3-(2-piperazinil)propilo, grupo 4-(1-piperazinil)butilo, grupo 4-(2-piperazinil)butilo, grupo 2-(4-etil-2-piperazinil)etilo, grupo 1-(4-*n*-propil-2-piperazinil)etilo, grupo 2-(4-*n*-butil-2-piperazinil)etilo, grupo 2-[4-*n*-pentil-2-piperazinil]etilo, grupo 1-(4-*n*-hexil-2-piperazinil)etilo, grupo 2-(5-metil-2-piperazinil)etilo, grupo 1-(5-etil-2-piperazinil)etilo, grupo 2-(5-*n*-propil-2-piperazinil)etilo, grupo 1-(5-*n*-butil-2-piperazinil)etilo, grupo 2-(5-*n*-pentil-2-piperazinil)etilo, grupo 1-(5-*n*-hexil-2-piperazinil)etilo, grupo 2-(6-metil-2-piperazinil)etilo, grupo 1-(6-etil-2-piperazinil)etilo, grupo 2-(6-*n*-propil-2-piperazinil)etilo, grupo 1-(6-*n*-butil-2-piperazinil)etilo, grupo 2-(6-*n*-pentil-2-piperazinil)etilo, grupo 2-(6-*n*-hexil-2-piperazinil)etilo, grupo 3-(2-metil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(2-etil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(2-*n*-propil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(2-*n*-butil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(2-*n*-pentil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(2-*n*-hexil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(3-metil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(3-etil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(3-*n*-propil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(3-*n*-butil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(3-*n*-pentil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(3-*n*-hexil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(4-metil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(4-etil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(4-*n*-propil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(4-*n*-butil-1-piperazinil)propilo, grupo 3-(4-*n*-pentil-1-piperazinil)propilo, grupo 6-(5-*n*-butil-2-piperazinil)hexilo, grupo 6-(5-*n*-pentil-2-piperazinil)hexilo, grupo 6-(5-*n*-hexil-2-piperazinil)hexilo, grupo 6-(6-metil-2-piperazinil)hexilo, grupo 6-(6-etil-2-piperazinil)hexilo, grupo

E-(*E*-*n*-propil-2-piperazinil)hexilo, grupo 6-(6-*n*-butil-2-piperazinil)hexilo, grupo 6-(6-*n*-pentil-2-piperazinil)hexilo, grupo 6-(6-*n*-hexil-2-piperazinil)hexilo, grupo 2,3-dimetil-1-piperazinilmetilo, grupo 3,3-dimetil-1-piperazinilmetilo y grupo 2-(1,3,4-trimetil-2-piperazinil)etilo.

5 Los ejemplos del grupo morfolinilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos morfolinilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-morfolinilmetilo, grupo 3-morfolinilmetilo, grupo 4-morfolinilmetilo, grupo 2-(2-morfolinil)etilo, grupo 2-(3-morfolinil)etilo, grupo 2-(4-morfolinil)etilo, grupo 1-(2-morfolinil)etilo, grupo 1-(3-morfolinil)etilo, grupo 1-(4-morfolinil)etilo, grupo 3-(2-morfolinil)propilo, grupo 3-(3-morfolinil)propilo, grupo 5-(4-morfolinil)propilo, grupo 4-(2-morfolinil)butilo, grupo 4-(3-morfolinil)butilo, grupo 4-(4-morfolinil)butilo, grupo 5-(2-morfolinil)pentilo, grupo 5-(3-morfolinil)pentilo, grupo 5-(4-morfolinil)pentilo, grupo 2-(2-morfolinil)hexilo, grupo 6-(3-morfolinil)hexilo, grupo 6-(4-morfolinil)hexilo, grupo 3-metil-3-(2-morfolinil)propilo, grupo 3-metil-3-(3-morfolinil)propilo, grupo 3-metil-3-(4-morfolinil)propilo, grupo 1,1-dimetil-2-(2-morfolinil)etilo, 1,1-dimetil-2-(3-morfolinil)etilo y grupo 1,1-dimetil-2-(4-morfolinil)etilo.

15 Los ejemplos de grupo tienilalquilo inferior (que puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente en el grupo tienilo) incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos tienilo, en los que pueden estar presentes de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) como sustituyente/s. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-(2- ó 3-)tienilmetilo, grupo 2-[(2- ó 3-)tienil]etilo, grupo 1-[(2- ó 3-)tienil]etilo, grupo 3-[(2- ó 3-)tienil]propilo, grupo 4-[(2- ó 3-)tienil]butilo, grupo 5-[(2- ó 3-)tienil]pentilo, grupo 6-[(2- ó 3-)tienil]hexilo, grupo 1,1-dimetil-2-[(2- ó 3-)tienil]etilo, grupo 2-metil-3-[(2- ó 3-)tienil]propilo, grupo 3-metil-(2-, 4- ó 5-)tienilmetilo, grupo [5-metil-(2, 3- ó 4-)tienil]metilo, grupo [4-etil-(2- ó 3-)tienil]metilo, grupo [5-*n*-propil-(2, 3- ó 4-)tienil]metilo, grupo [3-*n*-butil-(2-, 4- ó 5-)tienil]metilo, grupo [4,5-dimetil-(2- ó 3-)tienil]metilo, grupo (3,4,5-trimetil-2-tienil)metilo, grupo 2-[3-metil-(2-, 4- ó 5-)tienil]etilo, grupo 1-14-*n*-pentil-(2- ó 3-)tienil]etilo, grupo 3-[3-hexil-2-tienil]propilo, grupo 4-[4,5-dimetil-(2- ó 3-)tienil]butilo, grupo 5-(2,4,5-trimetil-3-tienil)pentilo y grupo 6-[5-etil-(2-, 3- ó 4-)tienil]hexilo.

Los ejemplos de grupo tiazolilo incluyen un grupo (2-, 4- ó 5-)tiazolilo.

30 Los ejemplos del grupo tiazolilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos tiazolilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 4- ó 5-)tiazolilmetilo, grupo 2-[(2-, 4- ó 5-)tiazolil]etilo, grupo 1-[(2-, 4-, ó 5-)tiazolil]etilo, grupo 3-[(2-, 4- ó 3-)tiazolil]propilo, grupo 4-[(2-, 4- ó 5-)tiazolil]butilo, grupo 5-[(2-, 4- ó 5-)tiazolil]pentilo, grupo 6-[(2-, 4- ó 5-)tiazolil]hexilo, grupo 1,1-dimetil-2-[(2-, 4- ó 5-)tiazolil]etilo y grupo [2-metil-3-[(2-, 4- ó 5-)tiazolil]propilo.

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

40 Los ejemplos del grupo dihidrobenzofurilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos dihidrobenzofurilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2,3-dihidro-4-benzofurilmetilo, grupo 2-(2,3-dihidro-4-benzofuril)etilo, grupo 3-(2,3-dihidro-4-benzofuril)propilo, grupo 4-(2,3-dihidro-4-benzofuril)butilo, grupo 5-(2,3-dihidro-4-benzofuril)pentilo, grupo 6-(2,3-dihidro-4-benzofuril)hexilo, grupo 2,3-dihidro-5-benzofurilmetilo, grupo 2-(2,3-dihidro-5-benzofuril)etilo, grupo 3-(2,3-dihidro-5-benzofuril)propilo, grupo 4-(2,3-dihidro-5-benzofuril)butilo, grupo 2,3-dihidro-6-benzofurilmetilo, grupo 2-(2,3-dihidro-6-benzofuril)etilo, grupo 3-(2,3-dihidro-6-benzofuril)propilo, grupo 4-(2,3-dihidro-6-benzofuril)butilo, grupo 5-(2,3-dihidro-6-benzofuril)pentilo, grupo 2,3-dihidro-7-benzofurilmetilo, 2,3-dihidro-1-benzofurilmetilo, grupo 3-(2,3-dihidro-7-benzofuril)propilo, grupo 4-(2,3-dihidro-7-benzofuril)butilo y grupo 6-(2,3-dihidro-7-benzofuril)hexilo.

50 Los ejemplos del grupo benzopiranalalquilo inferior que puede tener un grupo oxo como sustituyente en el grupo benzopiranilo incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos benzopiranilo en los que puede estar presente un grupo oxo como sustituyente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (4*H*-1-benzopiran-2-il)metilo, 2-(4*H*-1-benzopiran-2-il)etilo, 3-(4*H*-1-benzopiran-2-il)propilo, grupo 4-(4*H*-1-benzopiran-2-il)butilo, grupo 5-(4*H*-1-benzopiran-2-il)pentilo, grupo 6-(4*H*-1-benzopiran-2-il)hexilo, grupo (4*H*-1-benzopiran-3-il)metilo, 2-(4*H*-1-benzopiran-3-il)etilo, 3-(4*H*-1-benzopiran-3-il)propilo, grupo 9-(4*H*-1-benzopiran-3-il)butilo, grupo 5-(4*H*-1-benzopiran-3-il)pentilo, grupo 6-(4*H*-1-benzopiran-3-il)hexilo, grupo (4*H*-1-benzopiran-4-il)metilo, 2-(4*H*-1-benzopiran-4-il)etilo, 3-(4*H*-1-benzopiran-4-il)propilo, grupo 4-(4*H*-1-benzopiran-4-il)butilo, grupo 5-(4*H*-1-benzopiran-4-il)pentilo, grupo 6-(4*H*-1-benzopiran-4-il)hexilo, grupo (2*H*-1-benzopiran-2-il)metilo, 2-(2*H*-1-benzopiran-2-il)etilo, 3-(2*H*-1-benzopiran-2-il)propilo, grupo 4-(2*H*-1-benzopiran-2-il)butilo, grupo 5-(2*H*-1-benzopiran-2-il)pentilo, grupo 6-(2*H*-1-benzopiran-2-il)hexilo, grupo (2*H*-1-benzopiran-3-il)metilo, 2-(2*H*-1-benzopiran-3-il)etilo, 3-(2*H*-1-benzopiran-3-il)propilo, grupo 4-(2*H*-1-benzopiran-3-il)butilo, grupo 5-(2*H*-1-benzopiran-3-il)pentilo, grupo 6-(2*H*-1-benzopiran-3-il)hexilo, grupo (2*H*-1-benzopiran-4-il)metilo, 2-(2*H*-1-benzopiran-4-il)etilo, 3-(2*H*-1-benzopiran-4-il)propilo, grupo 4-(2*H*-1-benzopiran-4-il)butilo, grupo 5-(2*H*-1-benzopiran-4-il)pentilo, grupo 6-(2*H*-1-benzopiran-4-il)hexilo, grupo

	(1 <i>H</i> -2-benzopiran-1-il)metilo, grupo 2-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-1-il)etilo, grupo 3-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-1-il)propilo, grupo 4-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-1-il)butilo, grupo 5-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-1-il)pentilo, grupo 6-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-1-il)hexilo, grupo (1 <i>H</i> -2-benzopiranil)metilo, grupo 2-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-3-il)etilo, grupo 3-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-3-il)propilo, grupo 4-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-3-il)butilo, grupo 5-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-3-il)pentilo, grupo 6-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-3-il)hexilo, grupo
5	(1 <i>H</i> -2-benzopiran-3-il)metilo, grupo 2-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-4-il)etilo, grupo 3-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-4-il)propilo, grupo 4-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-4-il)butilo, grupo 5-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-4-il)pentilo, grupo 6-(1 <i>H</i> -2-benzopiran-4-il)hexilo, grupo
	(4-oxo-4 <i>H</i> -1-benzopiran-2-il)metilo, grupo 2-(4-oxo-4 <i>H</i> -1-benzopiran-2-il)etilo, grupo 3-(4-oxo-4 <i>H</i> -1-benzopiran-2-il)propilo, grupo 4-(4-oxo-4 <i>H</i> -1-benzopiran-2-il)butilo, grupo 5-(4-oxo-4 <i>H</i> -1-benzopiran-2-il)pentilo, grupo 6-(4-oxo-4 <i>H</i> -1-benzopiran-2-il)hexilo, grupo
10	(4-oxo-4 <i>H</i> -1-benzopiran-3-il)metilo, grupo 2-(4-oxo-4 <i>H</i> -1-benzopiran-3-il)etilo, grupo 3-(4-oxo-4 <i>H</i> -1-benzopiran-3-il)propilo, grupo 4-(4-oxo-4 <i>H</i> -1-benzopiran-3-il)butilo, grupo 5-(4-oxo-4 <i>H</i> -1-benzopiran-3-il)pentilo, grupo 6-(4-oxo-4 <i>H</i> -1-benzopiran-3-il)hexilo, grupo
	(4-oxo-4 <i>H</i> -1-benzopiran-4-il)metilo, grupo 2-(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-3-il)etilo, grupo 3-(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-3-il)propilo, grupo 4-(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-3-il)butilo, grupo 5-(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-3-il)pentilo, grupo 6-(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-3-il)hexilo, grupo
15	(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-4-il)etilo, grupo 2-(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-4-il)propilo, grupo 3-(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-4-il)butilo, grupo 4-(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-4-il)pentilo, grupo 5-(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-4-il)hexilo, grupo
	(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-4-il)metilo, grupo 2-(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-4-il)propilo, grupo 3-(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-4-il)butilo, grupo 4-(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-4-il)pentilo, grupo 5-(2-oxo-2 <i>H</i> -1-benzopiran-4-il)hexilo, grupo
20	(1-oxo-1 <i>H</i> -2-benzopiran-3-il)etilo, grupo 3-(1-oxo-15-2-benzopiran-3-il)propilo, grupo 4-(1-oxo-1 <i>H</i> -2-benzopiran-3-il)butilo, grupo 5-(1-oxo-1 <i>H</i> -2-benzopiran-3-il)pentilo, grupo 6-(1-oxo-15-2-benzopiran-3-il)hexilo, grupo
	(1-oxo-1 <i>H</i> -2-benzopiran-4-il)etilo, grupo 3-(1-oxo-1 <i>H</i> -2-benzopiran-4-il)propilo, grupo 4-(1-oxo-15-2-benzopiran-4-il)butilo, grupo 5-(1-oxo-1 <i>H</i> -2-benzopiran-4-il)pentilo, grupo
25	6-(1-oxo-1 <i>H</i> -2-benzopiran-4-il)hexilo. y grupo

Los ejemplos del grupo bencimidazolilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos bencimidazolilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1-bencimidazolilmetilo, grupo 2-(1-bencimidazolil)etilo, grupo 3-(1-bencimidazolil)propilo, grupo 4-(1-bencimidazolil)butilo, grupo 5-(1-bencimidazolil)pentilo, grupo 6-(1-bencimidazolil)hexilo, grupo 2-bencimidazolilmetilo, grupo 2-(2-bencimidazolil)etilo, grupo 3-(2-bencimidazolil)propilo, grupo 4-(2-bencimidazolil)butilo, grupo 5-(2-bencimidazolil)pentilo y grupo 5-(2-bencimidazolil)hexilo.

Los ejemplos del grupo indolilalquilo inferior que puede tener un grupo alcoxicarbonilo inferior en el grupo alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) según lo ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos alcoxicarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente que pueden tener de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos indolilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)il-metilo, grupo 2-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)il-etilo, grupo 3-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)il-propilo, grupo 4-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)il-butilo, grupo 5-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)il-pentilo, grupo 6-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)il-hexilo, grupo 3-metil-3-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)il-propilo, grupo 1,1-dimetil-2-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)il-etilo y grupo 1-metoxicarbonil-2-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)il-etilo.

Los ejemplos del grupo imidazolilalquilo inferior que tiene un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxicarbonilo inferior en el grupo alquilo inferior incluyen un grupo imidazolilalquilo inferior que tiene de 1 a 3, preferentemente 1, sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxicarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente en el grupo alquilo cuyo resto alquilo inferior es igual al ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 5 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo carbamoil-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]metilo, grupo metoxicarbonil-[(1-2-, 4-, ó 5-)imidazolil]metilo, grupo etoxicarbonil-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]metilo, grupo *n*-butoxicarbonil-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]metilo, grupo isobutoxicarbonil-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]metilo, grupo *tert*-butoxicarbonil-[(1-, 2-, 4-, ó -5-)imidazolil]metilo, grupo *sec*-butoxicarbonil-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]metilo, grupo *n*-pentiloxicarbonil-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]metilo, grupo neopentiloxi-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]metilo, grupo *n*-hexiloxicarbonil-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]metilo, grupo isohexiloxicarbonil-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]metilo, grupo 3-metilpentiloxicarbonil-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]metilo, grupo 1-carbamoil-2-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]etilo, grupo 1-metoxicarbonil-2-[(1-, 2-, 4-, ó 5-)imidazolil]etilo, grupo 1,1-dimetoxicarbonil-2-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]etilo, grupo 1,1-dicarbamoil-2-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]etilo, grupo 2-carbamoil-1-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]etilo, grupo 2-metoxicarbonil-3-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]propilo, grupo 2-carbamoil-4-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]butilo, grupo 1-metil-1-carbamoilmetil-2-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]etilo, 2-metoxicarbonil-5-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]pentilo, grupo 3-carbamoil-6-[(1-, 2-, 4-, ó 5-)imidazolil]hexilo, grupo 2-metoxicarbonil-1-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]isopropilo y grupo 2-carbamoilmetil-3-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]propilo.

Los ejemplos de grupo piridilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, grupo alcoxilo inferior y grupo alquilio inferior-alquilo inferior como sustituyente incluyen un grupo piridilo que puede tener de 1 a 4 (preferentemente, 1) grupos como sustituyente/s que se seleccionan del grupo que consiste en un

- grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) y un grupo alquilitio inferior-alquilo inferior en el que dos restos alquilo inferior están compuestos por un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-piridilo, grupo 3-piridilo, grupo 4-piridilo, grupo 4-metil-2-piridilo, grupo 5-metil-2-piridilo, grupo 5-etil-3-piridilo, grupo 2-*n*-propil-3-piridilo, grupo 4-*n*-butil-2-piridilo, grupo 4-*terc*-butil-2-piridilo, grupo 5-*n*-pentil-5-piridilo, grupo 4-*n*-hexil-2-piridilo, grupo 4-metoxi-2-piridilo, grupo 5-metoxi-2-piridilo, grupo 2-metiltiometil-3-piridilo, grupo 5-etiltiometil-2-piridilo, grupo 4-*n*-propiltiometil-2-piridilo, grupo 3-*n*-butiltiometil-2-piridilo, grupo 5-*n*-pentiltiometil-3-piridilo, grupo 4-*n*-hexiltiometil-3-piridilo, grupo 2-(2-metiltioetil)-3-piridilo, grupo 2-(3-metiltiopropil)-4-piridilo, grupo 3-(4-metiltiobutil)-4-piridilo, grupo 3-(5-metiltiopentil)-2-piridilo, grupo 4-(6-metiltionexil)-2-piridilo, grupo 3,4-dimetil-2-piridilo, grupo 2,4,6-trietil-3-piridilo, grupo 2,3,5,6-tetrametil-4-piridilo y grupo 2-metil-3-metiltiometil-4-piridilo.
- 15 Los ejemplos de grupo pirrolidinilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, grupo alcoxicarbonilo inferior, grupo alcanóilo inferior y grupo aroílo como sustituyente incluyen un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 3, preferentemente 1, grupo como sustituyente/s que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un grupo alcoxicarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente, un grupo alcanóilo inferior según lo descrito anteriormente (un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) y un grupo aroílo (preferentemente, un grupo benzoílo). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo pirrolidin-1-ilo, grupo pirrolidin-2-ilo, grupo pirrolidin-3-ilo, grupo 1-metilpirrolidin-3-ilo, grupo 2-etilpirrolidin-3-ilo, grupo 3-*n*-propilpirrolidin-3-ilo, grupo 4-*n*-butilpirrolidin-3-ilo, grupo 1-*terc*-butilpirrolidin-3-ilo, grupo 5-*n*-pentilpirrolidin-3-ilo, grupo 1-*n*-hexilpirrolidin-2-ilo, grupo 2-metoxicarbonil-2-ilo, grupo 3-etoxicarbonilpirrolidin-2-ilo, grupo 1-*terc*-butoxicarbonilpirrolidin-3-ilo, grupo 4-propoxicarbonilpirrolidin-2-ilo, grupo 5-butoxicarbonilpirrolidin-2-ilo, grupo 1-pentoxicarbonil-2-ilo, grupo 2-hexiloxicarbonilpirrolidin-2-ilo, grupo 1,3-dimetoxicarbonilpirrolidin-2-ilo, grupo 3,4,5-trietilpirrolidin-2-ilo, grupo 2,3,4,5-tetrametilpirrolidin-1-ilo, grupo 2,4-dimetoxicarbonilpirrolidin-1-ilo, grupo 3,4,5-trietoxicarbonilpirrolidin-1-ilo, grupo 2-metil-4-metoxicarbonilpirrolidin-1-ilo, grupo 1-benzoilpirrolidin-3-ilo, grupo 1-acetilpirrolidin-3-ilo y grupo 1-butirilpirrolidin-3-ilo.
- 30 Los ejemplos del grupo piperidilo que puede tener, como sustituyente, un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo aroílo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un átomo de halógeno, incluyen un grupo piperidinilo que puede tener de 1 a 5 (preferentemente, de 1 a 4) grupos como sustituyente/s que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); y un grupo aroílo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente y un átomo de halógeno según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo benzoílo). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1-piperidilo, grupo 2-piperidilo, grupo 3-piperidilo, grupo 4-piperidilo, grupo 1-metil-4-piperidilo, grupo 2-etil-4-piperidilo, grupo 5-*n*-propil-4-piperidilo, grupo 4-*n*-butil-4-piperidilo, grupo 1-*n*-pentil-4-piperidilo, grupo 2-*n*-hexil-4-piperidilo, grupo 1-metoxicarbonil-4-piperidilo, grupo 1-etoxicarbonil-4-piperidilo, grupo 4-*n*-propoxicarbonil-4-piperidilo, grupo 5-*n*-butoxicarbonil-4-piperidilo, grupo 1-*terc*-butoxicarbonil-4-piperidilo, grupo 1-formil-4-piperidilo, grupo 1-acetil-4-piperidilo, grupo 1-butiril-4-piperidilo, grupo 2-butiril-3-piperidilo, grupo 2-propionil-4-piperidilo, grupo 3-butiril-4-piperidilo, grupo 4-isobutiril-4-piperidilo, grupo 1-*n*-pentanoil-4-piperidilo, grupo 2-*terc*-butilcarbonil-4-piperidilo, grupo 3-*n*-hexanoil-4-piperidilo, grupo 1-benzoil-4-piperidilo, grupo 1-benzoil-3-piperidilo, grupo 1-(2-, 3- ó 4-clorobenzoil)-4-piperidilo, grupo 1-(2-, 3- ó 4-fluorobenzoil)-4-piperidilo, grupo 1-(2-, 3- ó 4-metilbenzoil)-4-piperidilo, grupo 2,6-dimetil-4-piperidilo, grupo 2,4,6-trimetil-3-piperidilo, grupo 2,2,6,6-tetrametil-4-piperidilo y grupo 2,2,4,4,6-pentametil-3-piperidilo.
- 55 Los ejemplos del grupo tetrahidrofurilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo 2-tetrahidrofurilo, grupo 3-tetrahidrofurilo, grupo 3-oxo-2-tetrahidrofurilo, grupo 4-oxo-2-tetrahidrofurilo, grupo 5-oxo-2-tetrahidrofurilo, grupo 2-oxo-3-tetrahidrofurilo, grupo 4-oxo-3-tetrahidrofurilo y grupo 5-oxo-4-tetrahidrofurilo.
- 60 Los ejemplos del grupo hexahidroazepinilo que puede tener un grupo oxo incluyen grupo 2-hexahidroazepinilo, grupo 3-hexahidroazepinilo, grupo 4-hexahidroazepinilo, grupo 2-oxo-3-hexahidroazepinilo, grupo 3-oxo-2-hexahidroazepinilo, grupo 4-oxo-2-hexahidroazepinilo, grupo 5-oxo-2-hexahidroazepinilo y grupo 6-oxo-2-hexahidroazepinilo.
- 65 Los ejemplos del grupo pirazolilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, grupo arilo y grupo furilo como sustituyente incluyen un grupo pirazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) grupos como sustituyente/s que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo

inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo arilo según lo ilustrado anteriormente; y

un grupo furilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1-pirazolilo, grupo 3-pirazolilo, grupo 4-pirazolilo, grupo 1-metil-5-pirazolilo, grupo 1-etil-5-pirazolilo, grupo 3-*n*-propil-5-pirazolilo, grupo 4-*n*-butil-5-pirazolilo, grupo 1-*terc*-butil-4-pirazolilo, grupo 1-*n*-pentil-4-pirazolilo, grupo 3-*n*-hexil-4-pirazolilo, grupo 2-fenil-5-pirazolilo, grupo 1-(2-naftil)-3-pirazolilo, grupo 4-(2-metilfenil)-3-pirazolilo, grupo 5-(3-etilfenil)-3-pirazolilo, grupo 1-(4-*n*-propilfenil)-4-pirazolilo, grupo 3-(2-*n*-butilfenil)-4-pirazolilo, grupo 5-(3-*n*-pentilfenil)-4-pirazolilo, grupo 1-(4-*n*-hexilfenil)-5-pirazolilo, grupo 3-(2-isobutilfenil)-5-pirazolilo, grupo 4-(3-*terc*-butilfenil)-5-pirazolilo, grupo 3-(2-clorofenil)-1-pirazolilo, grupo 4-(3-fluorofenil)-1-pirazolilo, grupo 5-(4-bramofenil)-1-pirazolilo, grupo 1-(2-aminofenil)-3-pirazolilo, grupo 4-(2,3-dimetilfenil)-3-pirazolilo, grupo 5-(3,4,5-trimetilfenil)-3-pirazolilo, grupo 1-(2,3-diaminofenil)-4-pirazolilo, grupo 3-(2-furil)-5-pirazolilo, grupo 1,3-dimetil-5-pirazolilo, grupo 1,3,4-trietil-5-pirazolilo, grupo 1,5-trimetil-9-pirazolilo, grupo y grupo 1-metil-3-fenil-5-pirazolilo.

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

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

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

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

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

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

Los ejemplos de grupo tetrahydroquinolilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, grupo alcoxilo inferior, átomo de halógeno y grupo oxo como sustituyente incluyen un grupo tetrahydroquinolilo según lo ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) grupos como sustituyente/s que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un átomo de halógeno; y

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

Los ejemplos del grupo quinolilo incluyen un grupo 2-quinolilo, grupo 3-quinolilo, grupo 4-quinolilo, grupo 5-quinolilo, grupo 6-quinolilo, grupo 7-quinolilo y grupo 8-quinolilo. Los ejemplos del grupo quinolilo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo quinolilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-quinolilo, grupo 2-metil-6-quinolilo, grupo 4-etil-5-quinolilo, grupo 4-*n*-propil-3-quinolilo, grupo 5-metil-3-quinolilo, grupo 5-*n*-butil-3-quinolilo, grupo 3-*terc*-butil-4-quinolilo, grupo

5-*n*-pentil-4-quinolilo, grupo 3-*n*-hexil-5-quinolilo y grupo 3,4-dimetil-5-quinolilo.

Los ejemplos del grupo benzodioxolilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos benzodioxolilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-, 4- ó 5-(1,3-benzodioxolil)metilo, grupo 2-(2-, 4- ó 5-)(1,3-benzodioxolil)etilo y grupo 3-(2-, 4- ó 5-)(1,3-benzodioxolil)propilo.

Los ejemplos de grupo arilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo inferior; un grupo alcoxilo inferior; un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno; un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno; un grupo alqueno inferior; un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilsulfonilo inferior, grupo alquilo inferior y grupo arilo; un grupo sulfamoilo; un grupo alquiltio inferior; un grupo alcanóilo inferior; un grupo alcocarbonilo inferior; un grupo pirrolilo; grupo alquinilo inferior; grupo ciano, grupo nitro; grupo ariloxilo; grupo arilalcoxilo inferior; grupo hidroxilo; un grupo hidroxialquilo inferior; grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; grupo pirazolilo; grupo pirrolidinilo que puede tener un grupo oxo; un grupo oxazolilo; grupo imidazolilo que puede tener un grupo alquilo inferior; grupo dihidrofurilo que puede tener un grupo oxo; grupo tiazolidinilalquilo inferior que puede tener un grupo oxo; grupo imidazolilalcanoilo inferior; y grupo piperidinilcarbonilo incluyen un grupo arilo según lo ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 7, preferentemente, de 1 a 5, más preferentemente, de 1 a 2 grupos como sustituyente/s que se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno según lo ilustrado anteriormente;

un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con 1 a 7 átomos de halógeno);

un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con 1 a 7 átomos de halógeno);

un grupo alqueno inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y 2 a 6 átomos de carbono (incluyendo tanto la configuración *trans* como la *cis*));

un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente, grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente y grupos arilo según lo ilustrado anteriormente;

un grupo sulfamoilo;

un grupo alquiltio inferior cuyo resto alquilo inferior es un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alcocarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo como se ilustra más abajo; grupo ciano; grupo nitro; grupo ariloxilo cuyo resto arilo es como se ilustra anteriormente; grupo arilalcoxilo inferior cuyo resto arilo y resto alcoxilo inferior son como se ilustran anteriormente; grupo hidroxilo; un grupo hidroxialquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente; un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente y grupo arilo según lo ilustrado anteriormente; grupo pirazolilo; grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos oxo; un grupo oxazolilo; grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente; grupo dihidrofurilo que puede tener de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos oxo; grupo tiazolidinilo que puede tener de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos oxo y que tiene an resto alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente; grupo imidazolilalcanoilo inferior cuyo resto alcanóilo es como se ilustra anteriormente y grupo piperidinilcarbonilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo fenilo, grupo 1-naftilo, grupo 2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)bifenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)clorofenilo, grupo (2-, 3- ó 4-) fluorofenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)bromofenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metilfenilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-propilfenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-butilfenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-pentilfenilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-hexil-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)isobutilfenilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*terc*-butil-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metoxifenilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etoxi-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-propoxifenilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isopropoxi-1-naftilo; grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-butoxifenilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutoxi-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*terc*-butoxifenilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)sec-butoxi-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-pentiloxifenilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isopentiloxi-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)neopentiloxifenilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-hexiloxi-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)isohexiloxifenilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)(3-metilpentiloxi)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)clorometilfenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)trifluorometilfenilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoroetil-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(3-bromopropil)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(4-clorobutil)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(5-fluoropentil)fenilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)(6-bromohexil)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(1,1-dimetil-2-cloroetil)fenilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)(2-metil-3-fluoropropil)-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)clorometoxifenilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)(2-fluoroetoxi)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 9-)(3-bromopropoxi)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(4-clorobutoxi)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(5-fluoropentiloxi)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)trifluorometoxifenilo, grupo 4-(6-bromohexiloxi)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 9-)(1,1-dimetil-2-cloroetoxi)fenilo, grupo 7-(2-metil-3- fluoropropoxi)-2-naftilo, grupo 2-vinilfenilo, grupo 2-(1-metilvinil)fenilo, grupo 2-(1-propenil)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(1-metil-1-propenil)fenilo, grupo 3-(2-metil-1-propenil)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(1-propenil)fenilo,

grupo (2-, 3- ó 4-)(2-propenil)fenilo, grupo 4-(2-butenil)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(1-butenil)fenilo, grupo 5-(3-butenil)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(2'-pentenil)fenilo, grupo 6-(1-pentenil)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(3-pentenil)fenilo, grupo 7-(4-pentenil)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(1,3-butadienil)fenilo, grupo 8-(1,3-pentadienil)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(2-penten-4-inil)fenilo, grupo 1-(2-hexenil)-2-naftilo, grupo 4-(1-hexenil)fenilo, grupo 3-(5-hexenil)-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(3-hexenilo), grupo 4-(4-hexenil)-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(3,3-dimetil-1-propenil)fenilo, grupo 5-(2-etil-1-propenil)-2-naftilo, grupo 4-(1,3,5-hexatrienil)fenilo; grupo 6-(1,3-hexadienil)-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(1,4-hexadienil)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N*-formilamino)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N*-acetilamino)fenilo, grupo 7-(*N*-acetilamino)-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N*-propionilamino)fenilo, grupo 8-(*N*-butirilamino)-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N*-isobutilamino)fenilo, grupo 2-(*N*-pentanoilamino)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N*-*terc*-butilcarbonilamino)fenilo, grupo 3-(*N*-hexanoilamino)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N,N*-diformilamino)fenilo, grupo 4-(*N,N*-diacetilamino)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N,N*-dimetilamino)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N*-fenilamino)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)sulfamoilfenilo, grupo 5-sulfamoil-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metiltiofenilo, grupo 6-etiltio-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-propiltiofenilo, grupo 7-isopropiltio-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-butiltiofenilo, grupo 8-*terc*-butiltio-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-pentiltiofenilo, grupo 1-*n*-hexiltio-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N*-metil(sulfonilamino)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)formilfenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)acetilfenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)butirilfenilo, grupo 3-acetil-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)propionilfenilo, grupo 4-butiril-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)isobutililfenilo, grupo 5-pentanoil-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)cianofenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metoxicarbonilnaftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*terc*-butilcarbonilfenilo, grupo 6-hexanoil-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)etoxicarbonilfenilo, grupo 7-etoxicarbonil-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-propoxicarbonilfenilo, grupo 8-isopropoxicarbonil-2-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-butoxicarbonilfenilo, grupo 2-isobutoxicarbonil-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*terc*-butoxicarbonilfenilo, grupo 3-*sec*-butoxicarbonil-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-pentiloxicarbonilfenilo, grupo 4-neopentiloxi-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-hexiloxicarbonilfenilo, grupo 5-*isohexiloxicarbonil*-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(3-metil-pentiloxicarbonil)fenilo, grupo 6-(1-pirrolil)-1-naftilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(1-pirrolil)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)etinilfenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N*-metilcarbamoil)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N*-fenilcarbamoil)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(2-hidroxietyl)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)fenoxifenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)nitrofenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)benciloxifenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)hidroxifenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(2-oxo-2,5-dihidrofuran-4-il)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(1-imidazolilacetil)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(2,4-dioxotiazolidin-5-ilmetil)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidilcarbonil]fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(1-, 3-, 4- ó 5-)pirazolil]fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[2-oxo-(1- ó 3-)pirrolidinil]fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 4- ó 5-)oxazolil]fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(2-etil-4-metilimidazol-1-il)fenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)bifenilo, grupo 2,3-dimetoxifenilo, grupo 2,4-dimetoxifenilo, grupo 2,5-dimetoxifenilo, grupo 2,6-dimetoxifenilo, grupo 3,4-dimetoxifenilo, grupo 3,5-dimetoxifenilo, grupo 2,3-diclorofenilo, grupo 2,4-diclorofenilo, grupo 3,4-diclorofenilo, grupo 2-metoxi-5-clorofenilo, grupo 2-metoxi-5-metilfenilo, grupo 2-metoxi-5-acetilaminofenilo, grupo 2-vinil-4-metilfenilo, grupo 2-vinil-5-etilfenilo, grupo 2,6-disulfamoilfenilo, grupo 2,4,6-trimetoxifenilo, grupo 3,4,5-trietoxifenilo, grupo 2-vinil-3,4,5-trietilfenilo, grupo pentametoxifenilo, grupo 2-vinil-naftilo, grupo 2,3-dimetoxi-1-naftilo, grupo 3,4-dietoxifenilo, grupo 2-metoxi-5-metoxicarbonilfenilo, grupo 3,5-dimetoxicarbonilfenilo, grupo 3-cloro-4-hidroxifenilo, grupo 2-cloro-5-(*N*-acetilamino)fenilo, grupo 2-cloro-5-cianofenilo, grupo 2-cloro-5-carbamoilfenilo, grupo 2-metoxi-5-(*N*-acetilamino)fenilo, grupo 2-cloro-5-etoxicarbonilfenilo, grupo 3,5,7-trietoxi-1-naftilo, grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftilo, grupo 2,3,4,5-tetrametil-7-(*N*-pentaacetilamino)-1-naftilo, grupo 2,3,4,5,5,7-hexaetoxi-1-naftilo y grupo heptametoxi-1-naftilo.

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

Los ejemplos del grupo alcanoilamin inferior-alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferentemente 1, grupos amino que tienen de 1 a 2 grupos alcanoil inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcanoil lineal o ramificado que tiene a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-(*N*-formilamino)etilo, grupo 2-(*N*-acetilamino)etilo, grupo 2-(*N*-propionilamino)etilo, grupo 2-(*N*-butirilamino)etilo, grupo 2-(*N*-isobutilamino)etilo, grupo 2-(*N*-pentanoilamino)etilo, grupo 2-(*N*-*terc*-butilcarbonilamino)etilo, grupo 2-(*N*-hexanoilamino)etilo, grupo *N*-acetilaminometilo, grupo 1-(*N*-acetilamino)etilo, grupo 3-(*N*-acetilamino)propilo, grupo 4-(*N*-acetilamino)butilo, grupo 5-(*N*-acetilamino)pentilo, grupo 6-(*N*-acetilamino)hexilo, grupo 1,1-dimetil-2-(*N*-acetilamino)etilo, grupo 2-metil-3-(*N*-acetilamino)propilo y grupo 2-(*N,N*-diacetilamino)etilo.

Los ejemplos de grupo alquilamino inferior sustituido con halógeno incluyen un grupo amino que tiene de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos alquilo inferior sustituidos con halógeno según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo alquilo sustituido con halógeno lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono con de 1 a 7 (preferentemente, de 1 a 3) átomos de halógeno). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo *N*-fluorometilamino, grupo *N*-difluorometilamino, grupo *N*-trifluorometilamino, grupo *N*-clorometilamino, grupo *N*-diclorometilamino, grupo *N*-triclorometilamino, grupo *N*-bromometilamino, grupo *N*-dibromometilamino, grupo *N*-diclorofluorometilamino, grupo *N*-2,2,2-trifluoroetilamino, grupo *N*-pentafluoroetilamino, grupo *N*-2-cloroetilamino, grupo *N*-3,3,3-trifluoropropilamino, grupo *N*-heptafluoropropilamino, grupo *N*-heptafluoroisopropilamino, grupo *N*-3-cloropropilamino, grupo *N*-2-cloropropilamino, grupo *N*-3-bromopropilamino, grupo *N*-4,4,4-trifluorobutilamino, grupo *N*-4,4,4,3,3-pentafluorobutilamino, grupo *N*-4-clorobutilamino, grupo *N*-4-bromobutilamino, grupo

N--2-clorobutilamino, grupo *N*--5,5,5-trifluoropentilamino, grupo *N*--5-cloropentilamino, grupo *N*--6,6,6-trifluorohexilamino, grupo *N*--6-clorohexilamino, grupo *N*--(1,1-dimetil-2-cloroetil)amino, grupo *N*--(2-metil-3-fluoropropil)amino y grupo *N,N*-di(flourometil)amino.

- 5 Los ejemplos del grupo alquiltio inferior-alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 grupos alquiltio inferior, cuyo resto alquilo es un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-metiltioetilo, grupo 2-etiltioetilo, grupo 2-*n*-propiltioetilo, grupo 2-*n*-butiltioetilo, grupo 2-*terc*-butiltioetilo, grupo 2-*n*-pentiltioetilo, grupo 2-*n*-hexiltioetilo, grupo metiltiometil, grupo 1-metiltioetilo, grupo 3-metiltiopropilo, grupo 4-metiltiobutilo, grupo 5-metiltiopentilo, grupo 6-metiltiohexilo, grupo 1,1-dimetil-2-metiltioetilo, grupo 2-metil-3-metiltiopropilo, grupo 2,2-dietiltioetilo y grupo 2,2,2-trietiltioetilo.

- 15 Los ejemplos del grupo amidino que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo amidino, grupo 6-metilamidino, grupo *N*--etilamidino, grupo *N*--*n*-propilamidino, grupo 5-*n*-butil-amidino, grupo *N*--*n*-pentilamidino, grupo *K*-*n*-hexilamidino, grupo *N*--isopropilamidino, grupo *N*--*terc*-butilamidino, grupo *N,N*-dimetilamidino, grupo *N,N'*-dimetilamidino y grupo *N*--metil-*N'*-etil-amidino.

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

- 30 Los ejemplos del grupo alqueniloxilo inferior incluyen un grupo alqueniloxilo inferior cuyo resto alqueniilo inferior es como se ilustra anteriormente (un grupo alqueniloxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo viniloxilo, grupo 3-propeniloxilo, grupo 1-metil-1-propeniloxilo, grupo 2-metil-1-propeniloxilo, grupo 2-propeniloxilo, grupo 2-buteniloxilo, grupo 1-butaniloxilo, grupo 3-buteniloxilo, grupo 2-penteniloxilo, grupo 1-penteniloxilo, grupo 3-penteniloxilo, grupo 4-penteniloxilo, grupo 1,3-butadieniloxilo, grupo 1,3-pentadieniloxilo, grupo 2-penten-4-iniloxilo, grupo 2-hexeniloxilo, grupo 1-hexeniloxilo, grupo 5-hexeniloxilo, grupo 3-hexeniloxilo, grupo 4-hexeniloxilo, grupo 3,3-dimetil-1-propeniloxilo, grupo 2-etil-1-propeniloxilo, grupo 1,3,5-hexatrieniloxilo, grupo 1,3-hexadieniloxilo y grupo 1,4-hexadieniloxilo.

- 35 Los ejemplos del grupo alqueniloxi inferior-alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 grupos alqueniloxilo inferior cuyo resto alqueniloxilo inferior es un grupo alqueniloxilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alqueniilo lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 3 enlaces dobles). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo viniloximetilo, grupo 2-viniloxietilo, grupo 2-(1-propeniloxi)etilo, grupo 2-(1-metil-1-propeniloxi)etilo, grupo 2-(2-metil-1-propeniloxi)etilo, grupo 2-(2-propeniloxi)etilo, grupo 2-(2-buteniloxi)etilo, grupo 2-(1-buteniloxi)etilo, grupo 2-(3-buteniloxi)etilo, grupo 2-(2-penteniloxi)etilo, grupo 2-(1-penteniloxi)etilo, grupo 2-(3-penteniloxi)etilo, grupo 2-(4-penteniloxi)etilo, grupo 2-(1,3-butadieniloxi)etilo, grupo 2-(1,3-pentadieniloxi)etilo, grupo 2-(2-penten-4-iniloxi)etilo, grupo 2-(2-bexeniloxi)etilo, grupo 2-(1-hexeniloxi)etilo, grupo 2-(5-hexeniloxi)etilo, grupo 2-(3-hexeniloxi)etilo, grupo 2-(4-hexeniloxi)etilo, grupo 2-(3,3-dimetil-1-propeniloxi)etilo, grupo 2-(2-etil-1-propeniloxi)etilo, grupo 2-(1,3,5-hexatrieniloxi)etilo, grupo 2-(1,3-hexadieniloxi)etilo, grupo 2-(1,4-hexadieniloxi)etilo, grupo 3-viniloxipropilo, grupo 4-viniloxibutilo, grupo 5-viniloxipropilo, grupo 6-viniloxihexilo, grupo 1-viniloxietilo, grupo 1,1-dimetil-2-viniloxietilo, grupo 2-metil-3-viniloxipropilo, grupo 2,2-diviniloxi etilo y grupo 2,2,2-triviniloxietilo.

- 50 Los ejemplos del grupo arilamino que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, grupo alcoxilo inferior, grupo alquilo inferior sustituido con halógeno y grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno en el grupo arilo incluyen un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos arilo según lo ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 7, preferentemente, de 1 a 5, más preferentemente, de 1 a 2 sustituyentes en el grupo arilo, que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alquilo sustituido con halógeno según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono con 1 a 7, preferentemente, de 1 a 3 átomos de halógeno); y

un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, preferentemente, con de 1 a 7, más preferentemente, de 1 a 3 átomos de halógeno). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo *N*--fenilamino, grupo *N*--2-naftilamino, grupo *N*--(2-metilfenil)amino, grupo *N*--(3-etil-1-naftil)amino, grupo *N*--(4-*n*-propil-fenil)amino, grupo

- 65 *N*--(2-*n*-butil-1-fenil)amino, grupo *N*--(3-*n*-pentilfenil)amino, grupo *N*--(4-*n*-hexil-1-naftil)amino, grupo *N*--(2-isobutilfenil)amino, grupo *N*--(3-*terc*-butil-1-naftil)amino, grupo *N*--(2-metoxifenil)amino, grupo

- N*--(3-etoxi-1-naftil)amino, grupo *N*--(4-*n*-propoxifenil)amino, grupo *N*--(3-isopropoxi-1-naftil)amino, grupo
N--(*n*-butoxifenil)amino, grupo *N*--(1-isobutoxi-2-naftil)amino, grupo *N*--(*terc*-butoxifenil)amino, grupo
N--(5-*sec*-butoxi-1-naftil)amino, grupo *N*--(*n*-pentiloxifenil)amino, grupo *N*--(5-isopentiloxi-1-naftil)amino, grupo
5 *N*--(1-neopentiloxifenil)amino, grupo *N*--(6-*n*-hexiloxi-2-naftil)amino, grupo *N*--(isohexiloxifenil)amino, grupo
N--(3-metilpentiloxi-1-naftil)amino, grupo *N*--(2-trifluorometilfenil)amino, grupo *N*--(4-trifluorometilfenil)amino, grupo
N--(2-clorometilfenil)amino, grupo *N*--[3-(2-fluoroetil)-1-naftil]amino, grupo *N*--[4-(3-bromopropil)fenil]amino, grupo
N--[2-(4-clorobutil)-1-fenil]amino, grupo *N*--[3-(5-fluoropentil)fenil]amino, grupo *N*--[4-(6-bromohexil)-1-naftil]amino,
grupo *N*--[2-(1,1-dimetil-2-cloroetil)fenil]amino, grupo *N*--[7-(2-metil-3-fluoropropil)-2-naftil]amino, grupo
10 *N*--(2-clorometoxifenil)amino, grupo *N*--(4-trifluorometoxifenil)amino, grupo *N*--(3-(2-fluoroetoxi)-1-naftil)amino, grupo
N--[4-(3-bromopropoxi)fenil]amino, grupo *N*--[2-(4-clorobutoxi)-1-fenil]amino, grupo
N--[3-(5-fluoropentiloxi)fenil]amino, grupo *N*--[4-(6-bromohexiloxi)-1-naftil]amino, grupo
N--[2-(1,1-dimetil-2-cloroetoxi)fenil]amino, grupo *N*--[7-(2-metil-3-fluoropropoxi)-2-naftil]amino, grupo
N--(2-clorometoxifenil)amino, grupo *N*--[3-(2-fluoroetoxi)-1-naftil]amino, grupo *N*--[4-(3-bromopropoxi)fenil]amino,
grupo *N*--[2-(4-clorobutoxi)-1-fenil]amino, grupo *N*--[3-(5-fluoropentiloxi)fenil]amino, grupo
15 *N*--[4-(6-bromohexiloxi)-1-naftil]amino, grupo *N*--[2-(1,1-dimetil-2-cloroetoxi)fenil]amino, grupo
N--[7-(2-metil-3-fluoropropoxi)-2-naftil]amino y grupo *N,N*-difenilamino.

- Los ejemplos del grupo arilalqueno inferior incluyen un grupo alqueno inferior según lo ilustrado anteriormente que
tiene un grupo arilo según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene
20 de 1 a 3 grupos arilo y de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-feniletlenilo, grupo
3-fenil-2-propenilo, grupo 3-[(1- ó 2-)naftil]-2-propenilo, grupo 4-[(2-, 3- ó 4-)metilfenil]-2-butenilo, grupo 4-[(2-, 3- ó
4-)etilfenil]-3-butenilo, grupo 4-[(2-, 3- ó 4-)*n*-propilfenil]-1,3-butadienilo, grupo 5-[(2-, 3- ó
4-)*n*-butilfenil]-1,3,5-hexatrienilo, grupo 5-[(2-, 3- ó 4-)*n*-pentilfenil]-2,4-hexadienilo, grupo 5-[(2-, 3- ó
4-)*n*-hexilfenil]-3-pentenilo, grupo 3-[(2-, 3- ó 4-)isobutilfenil]-2-propenilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)*terc*-butilfenil]fenilo,
25 grupo 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-1-naftil]-2-propenilo, grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-2-naftil]-2-butenilo,
grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-1-naftil]-3-butenilo, grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-2-naftil]-1,3-butadienilo,
grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-propil-1-naftil]-1,3,5-hexatrienilo, grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó
8-)*n*-propil-2-naftil]-2,4-hexadienilo, grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-butil-1-naftil]-3-pentenilo, grupo 3-[(1-, 3-, 4-, 5-,
6-, 7- ó 8-)*n*-butil-2-naftil]-2-propenilo, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-pentil-1-naftil]etenilo, grupo 3-[(1-, 3-, 4-, 5-,
30 6-, 7- ó 8-)*n*-pentil-2-naftil]-2-propenil, grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-hexil-1-naftil]-2-butenilo, grupo 4-[(1-, 3-, 4-,
5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-hexil-2-naftil]-3-butenilo, grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-1-naftil]-1,3-butadienilo, grupo 5-[(1-,
3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-2-naftil]-1,3,5-hexatrienilo, grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*terc*-butil-1-naftil]-2,4-hexadienilo, grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*terc*-butil-2-naftil]-1,3,5-hexatrienilo, grupo
5-[(2-, 3- ó 4-)clorofenilo, grupo (2-, 3- ó 4-)fluorofenil]-2,4-hexadienilo, grupo 5-[(2-, 3- ó 4-)bromofenil]-3-pentenilo,
35 grupo 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-1-naftil]-2-propenilo, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-2-naftil]etenilo,
grupo 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-1-naftil]-2-propenilo, grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-2-naftil]-2-butenilo,
grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)bromo-1-naftil]-3-butenilo, grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)bromo-2-
naftil]-1,3-butadienilo, grupo 5-[(2-, 3- ó 4-)aminofenil]-1,3,5-hexatrienilo, grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)
amino-1-naftil]-2,4-hexadienilo, grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)amino-2-naftil]-3-pentenilo, grupo 3-(2,3-
40 dimetilfenil)-2-propenilo, grupo 2-(3,4-dimetilfenil)vinilo, grupo 3-(2,4-dimetilfenil)-2-propenilo, grupo 4-(2,5-
dimetilfenil)-2-butenilo, grupo 4-(2,6-dimetilfenil)-3-butenilo, grupo 4-(2,4,6-trimetilfenil)-1,3-butadienilo, grupo
5-(3,4,5-trimetilfenil)-1,3,5-hexatrienilo, grupo 5-(2,3,4,5-tetraetilfenil)-2,4-hexadienilo, grupo
5-(pentametilfenil)-3-pentenilo, grupo 3-[2-metilnaftil]-2-propenilo, grupo 2-(2,3-dimetilnaftil]etenilo, grupo
3-(3,4-dimetilfenil)-2-propenilo, grupo 4-(3,5,7-trietilnaftil)-2-butenilo, grupo 4-(3,4,5,7-tetrametilnaftil)-3-butenilo, grupo
45 4-(2,3,4,5,7-pentametilnaftil)-1,3-butadienilo, grupo 5-(2,3,4,5,6,7-bexaetilnaftil)-1,3,5-hexatrienilo, grupo
5-(heptametilnaftil)-2,4-hexadienilo, grupo 5-(2,3-diaminofenil)-3-pentenilo, grupo 3-(2,4,6-triaminofenil)-2-propenilo y
grupo 2-(2-metil-5-cloronaftil]etenilo.

- Los ejemplos del grupo piridilamino que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo piridilamino que puede
50 tener de 1 a 3, preferentemente, de 1 a 2 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo
lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo piridilo y/o grupo amino. Sus ejemplos
específicos incluyen un grupo *N*--(2-, 3- ó 4-)piridilamino, grupo *N*--3-metil-2-piridilamino, grupo
N--(4-metil-2-piridil)amino, grupo *N*--(5-metil-2-piridil)amino, grupo *N*--(6-metil-2-piridil)amino, grupo
N--(2-metil-3-piridil)amino, grupo *N*--(4-metil-3-piridil)amino, grupo *N*--(5-metil-3-piridil)amino, grupo
55 *N*--(6-metil-3-piridil)amino, grupo *N*--(2-metil-4-piridil)amino, grupo *N*--(3-metil-4-piridil)amino, grupo
N--(3-etil-2-piridil)amino, grupo *N*--(4-*n*-propil-2-piridil)amino, grupo *N*--(5-*n*-propil-2-piridil)amino, grupo
N--(2-*n*-butil-2-piridil)amino, grupo *N*--(4-*n*-pentil-3-piridil)amino, grupo *N*--(5-*n*-hexil-3-piridil)amino, grupo *N*--(2-
isopropil-4-piridil)amino, grupo *N*--(3-*terc*-butil-4-piridil)amino, grupo *N*--(3-metil-2-piridil)-*n*-metilamino y grupo
60 *N*--(2,4-dietil-3-piridil)-*n*-metilamino.

- Los ejemplos del grupo arilalquilo inferior (que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en átomo de
halógeno, alquilo inferior, grupo alquilo sustituido con halógeno, grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno, grupo
alcoxilo inferior, grupo carbamoilo y grupo alcoxicarbonilo inferior como sustituyente en el grupo arilo y/o el grupo
alquilo inferior) incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado
65 que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos arilo según lo ilustrado
anteriormente. Cabe señalar que, en el grupo arilo y/o el resto alquilo, puede haber de 1 a 7, preferentemente, de 1 a 5,

más preferentemente, de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en:

un átomo de halógeno según lo ilustrado anteriormente;

un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

5 un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono preferentemente sustituido con 1 a 7 átomos de halógeno);

un grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con 1 a 7 átomos de halógeno);

10 un grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo carbamoilo; y

un grupo alcocarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del grupo arilalquilo inferior (que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, alquilo inferior, grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno, grupo alcoxilo inferior, grupo carbamoilo y grupo alcocarbonilo inferior en el grupo arilo y/o el grupo alquilo inferior) incluyen un grupo bencilo,

15 grupo 1-feniletilo, grupo 2-feniletilo, grupo 1-netil-1-feniletilo, grupo 1,1-dimetil-2-feniletilo, grupo 1,1-dimetil-3-fenilpropilo, grupo (2-, 3- ó 4-)fluorobencilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)fluorofenil]etilo, grupo 1-[(2-, 3- ó 4-)fluorofenil]propilo, grupo 1-[(2-, 3- ó 4-)fluorofenil]propilo, grupo 2-[(2,6- ó 3,5-)difluorofenil]etilo, grupo 1-(3,5-difluorofenil)etilo, grupo 1-(3,5-difluorofenil)propilo, grupo (2-, 3- ó 4-)clorobencilo, grupo 2-[(2-, 3-, ó 4-)clorofenil]etilo, grupo 2-(3,4-diclorofenil)etilo, grupo 1-(3-clorofenil)butilo, grupo 1-(4-clorofenil)butilo, grupo (2-, 3- ó 4-)trifluorometilfenilbencilo, grupo 1-[(2-, 3- ó 4-)trifluorometilfenil]etilo, grupo 1-[(2-, 3- ó 4-)trifluorometilfenil]propilo,

20 grupo (2-, 3- ó 4-)metilbencilo, grupo 2-[(2- 3- ó 4-)metilfenil]etilo, grupo (2-, 3- ó 4-)trifluorometoxibencilo, grupo 1-[(2-, 3- ó 4-)trifluorometilfenil]etilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metoxibencilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)metilfenil]etilo, grupo 1-[(2-, 3- ó 4-)metoxifenil]propilo, grupo (2-, 3- ó 4-)etoxibencilo, grupo (3,4- ó 3,5-)dimetoxibencilo, grupo (3,4- ó 3,5-)di(*n*-butoxi)bencilo, grupo 2-[(3,5- ó 3,4-)dimetoxifenil]etilo, grupo 2-(2-etoxifenil)etilo, grupo 1-(4-metoxifenil)butilo, grupo 1-fenil-1-metoxicarbonilmetilo, grupo 1-carbamoil-2-feniletilo, grupo 1-metoxicarbonil-2-feniletilo, grupo 2-metoxicarbonil-2-feniletilo, grupo 2-fenil-2-hidroxietilo, grupo 2-(4-hidroxifenil)-1-metoxicarboniletilo, grupo 3-cloro-4-difluorometoxifenilmetilo y grupo naftilmetilo.

25 30 Los ejemplos del grupo alquinilo inferior incluyen grupo alquinilo lineal o ramificado que tiene 2 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo etinilo, grupo 2-propinilo, grupo 2-butinilo, grupo 3-butinilo, grupo 1-metil-2-propinilo, grupo 2-pentinilo y grupo 2-hexinilo.

Los ejemplos del grupo ariloxialquilo inferior que, en el grupo arilo, puede tener presente un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcoxilo inferior; un grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcoxilo inferior y grupo alquilo inferior; y un grupo pirrolidinilo que puede tener un grupo oxo, incluyen un grupo arilalquilo inferior cuyo resto arilo y grupo alquilo inferior son como se ilustran anteriormente. En el grupo arilo de la presente memoria, pueden estar presentes de 1 a 5 (preferentemente, de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente; un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente y un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente; y grupo oxo como sustituyente/s.

35 40 Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)metoxifenoxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)carbamoilfenoxi]etilo, grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)(*N*-metil-*N*-etoxicarbamoil)fenoxi]etilo y grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)(2-oxo-1-pirrolidinil)fenoxi]etilo.

Los ejemplos del grupo isoxazolidinilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo isoxazolidinilo que puede tener de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 3-oxoisooxazolidin-4- ó 5-ilo y grupo 3,3-dioxisooxazolidin-4-ilo.

45 50 Los ejemplos del grupo dihidroindenilo incluyen un grupo (1-, 2-, 4- ó 5-)-1,2-dihidroindenilo.

Los ejemplos del grupo arilalcoxi inferior-alquilo inferior incluyen un grupo arilalcoxi inferior-alquilo inferior cuyo resto arilo, resto alcoxilo inferior y resto de grupo alquilo inferior son como se ilustran anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo benciloximetilo, grupo 2-benciloxietilo y grupo 2-benciloxibutilo.

55 60 Los ejemplos del grupo azetidínilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior y un grupo aroílo incluyen un grupo azetidínilo que puede tener a 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos seleccionados de un grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente y un grupo aroílo según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2- ó 3-azetidínilo, grupo 1-acetil-(2- ó 3-)azetidínilo, grupo 1-butilil-(2- ó 3-)azetidínilo y grupo 1-benzoil-(2- ó 3-)azetidínilo.

Los ejemplos del grupo azetidínalquilo inferior que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior y un grupo aroílo incluyen un grupo azetidínalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente y un grupo aroílo según lo ilustrado anteriormente, y que tiene un resto alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2- ó 3-azetidínilmetilo, grupo 2-(2- ó 3-azetidínil)etilo, grupo 1-acetil-(2- ó 2-)azetidínilmetilo, grupo 1-butilil-(2- ó 3-)azetidínilmetilo, grupo 1-benzoil-(2- ó 3-)azetidínilmetilo, grupo

65 70 75 80 85 90 95

2-[1-acetil-(2- ó 3-)azetidini]etilo, grupo 2-[1-butil-(2- ó 3-)azetidini]etilo y grupo 2-[1-benzoil-(2- ó 3-)azetidini]etilo.

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

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

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

- 10 Los ejemplos del grupo triazolilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquiltio inferior incluyen un grupo triazolilo según lo ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente y un grupo alquiltio inferior según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 3- ó 5-)-1,2,4-triazolilo, grupo (1-, 2- ó 5-)-1,3,5-triazolilo, grupo 1-metil-5-metiltio-1,2,4-triazolil-3-ilo y grupo 1-metil-5-metiltio-1,2,3-triazol-2-ilo.

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

- 20 Los ejemplos del grupo oxazolilo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo oxazolilo que puede tener de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 3- ó 4-)oxazolilo y un grupo 4-metil-(2- ó 3-)oxazolilo.

- 25 Los ejemplos del grupo isotiazolilo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo isotiazolilo que puede tener de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (3-, 4- ó 5-)isotiazolilo y un grupo (3- ó 4-)metil-2-isotiazolilo.

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

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

Los ejemplos del grupo tienilo que puede tener un grupo alcoxicarbonilo inferior incluyen un grupo tienilo que puede tener de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos alcoxicarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2- ó 3-)tienilo y un grupo 3-metoxicarbonil-2-tienilo.

- 40 Los ejemplos del grupo oxazolilalquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo oxazolilalquilo inferior según lo ilustrado anteriormente, cuyo grupo alquilo es como se ilustra anteriormente, que tiene de 1 a 3 (más preferentemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente en el anillo de oxazol. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 4- ó 5-)oxazolilmetilo, grupo 2-(2-, 4- ó 5-)oxazolilmetilo, grupo [2-metil-(4- ó 5-)oxazolil]metilo y grupo (2,5-dimetil-4-oxazolil)metilo.

- 45 Los ejemplos del grupo aminoalquilo inferior que puede tener un grupo, en el grupo amino, que se selecciona del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, alquilo inferior sustituido con halógeno, grupo alcoxicarbonilo inferior, grupo alcanóilo inferior, grupo arilo, grupo arilalquilo inferior, grupo aroílo y grupo alquilo sustituido con amino (en el grupo alquilo sustituido con amino, puede estar presente un grupo alquilo inferior como sustituyente) incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 5, preferentemente, de 1 a 3, más preferentemente 1, grupos amino. Cabe señalar que, en el grupo amino, pueden estar presentes de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en:

- 50 un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

- 55 un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono con 1 a 13, preferentemente 1 a 7, más preferentemente 1 a 3 átomos de halógeno);

un grupo alcoxicarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente;

- 60 un grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo arilo según lo ilustrado anteriormente;

un grupo arilalquilo inferior según lo ilustrado anteriormente;

un grupo aroílo según lo ilustrado anteriormente; y

- 65 un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 5, preferentemente, de 1 a 3, más preferentemente 1, grupos amino (1 a 2 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono)

- puede estar presente en el grupo amino como sustituyente(s). Los ejemplos específicos del grupo aminoalquilo inferior que puede tener, en el grupo amino, un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, alquilo inferior sustituido con halógeno, grupo alcocarbonilo inferior, grupo alcanóilo inferior, grupo arilo, grupo arilalquilo inferior, grupo aroilo y grupo alquilo sustituido con amino (en el grupo amino del grupo alquilo sustituido con amino, puede estar presente un grupo alquilo inferior como sustituyente) incluyen un grupo *N*-metilaminometilo, grupo *N*-etilaminometilo, grupo *N*-*n*-propilaminometilo, grupo *N,N*-dimetilaminometilo, grupo *N,N*-dietilaminometilo, grupo *N*-metil-*N*-*n*-propilaminometilo, grupo *N*-metil-*n*-etilaminometilo, grupo *N*-(2,2,2-trifluoroetil)aminometilo, grupo *N*-metil-*N*-bencilaminometilo, grupo *N*-fenilaminometilo, grupo *N*-metil-*n*-fenilaminometilo, grupo *N*-formilaminometilo, grupo *N*-metil-*n*-acetilaminometilo, grupo *N*-metil-*n*-propionilaminometilo, grupo *N*-(2-(*N,N*-dietilamino)etil)aminometilo, grupo *N*-metil-*n*-benzoilaminometilo, grupo *N*-metilaminoetilo, grupo *N*-etilaminoetilo, grupo *N*-(2,2,2-trifluoroetil)aminoetilo, grupo *N,N*-dimetilaminoetilo, grupo *N,N*-dietilaminoetilo, grupo *N*-metil-*n*-acetilaminoetilo, grupo *N*-metil-*n*-benzoilaminoetilo, grupo *N*-metil-*n*-propionilaminoetilo, grupo *N*-metil-*n*-bencilaminoetilo y grupo *N*-metil-*n*-*terc*-butoxicarbonilaminoetilo.
- Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido con un grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno incluyen un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) y sustituido con 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en:
- un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); y
- un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y 1 a 13, preferentemente, 1 a 7, más preferentemente, 1 a 3 átomos de halógeno). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo carbamoilmetilo, grupo 2-carbamoiletilo, grupo 1-carbamoiletilo, grupo 3-carbamoilpropilo, grupo 4-carbamoilbutilo, grupo 5-carbamoilpentilo, grupo 6-carbamoilhexilo, grupo 1,1-dimetil-2-carbamoiletilo, grupo 2-metil-3-carbamoilpropilo, grupo 1,2-dicarbamoiletilo, grupo 2,2-dicarbamoiletilo, grupo 1,2,3-tricarbamoilpropilo, grupo *N*-metilcarbamoilmetilo, grupo *N*-etilcarbamoilmetilo, grupo 2-(*N*-*n*-propilcarbamoil)etilo, grupo 3-(*N*-*n*-butilcarbamoil)propilo, grupo 4-(*N*-isobutilcarbamoil)butilo, grupo 5-(*N*-*terc*-butilcarbamoil)pentilo, grupo 6-(*N*-pentilcarbamoil)hexilo, grupo *N,N*-dimetilcarbamoilmetilo, grupo *N,N*-dietilcarbamoilmetilo, grupo 2-(*N*-2-fluoroetilcarbamoil)etilo, grupo 3-(*N*-2-cloroetilcarbamoil)propilo, grupo 4-(*N*-2-bromoetilcarbamoil)butilo, grupo 2-(*N*-2,2-dicloroetilcarbamoil)etilo, *N*-2,2,2-trifluoroetilcarbamoilmetilo y *N*-heptafluoropropilcarbamoilmetilo.
- Los ejemplos del grupo tiocarbamoilo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo tiocarbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo tiocarbamoilo, grupo *N*-metil-tiocarbamoilo, grupo *N*-etil-tiocarbamoilo, grupo *N*-*n*-propiltiocarbamoilo, grupo *N*-*n*-butil-tiocarbamoilo, grupo *N*-*n*-pentil-tiocarbamoilo, grupo *N*-*n*-hexil-tiocarbamoilo, grupo *N*-isobutil-tiocarbamoilo, *N*-*terc*-butil-tiocarbamoilo, grupo *N,N*-dimetil-tiocarbamoilo y grupo *N*-metil-*n*-etil-tiocarbamoilo.
- Los ejemplos del grupo oxazolidinilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo oxazolidinilo que puede tener de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo oxazolidin-3-ilo, grupo oxazolidin-4-ilo, grupo oxazolidin-5-ilo, grupo 2-oxo-oxazolidin-4-ilo, grupo 2-oxo-oxazolidin-3-ilo y grupo 2-oxo-oxazolidin-5-ilo.
- Los ejemplos del grupo imidazolidinilo que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior incluyen un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 3, preferentemente, de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo imidazolidin-1-ilo, grupo imidazolidin-2-ilo, grupo imidazolidin-4-ilo, grupo 2-oxo-imidazolidin-1-ilo, grupo 4-oxo-imidazolidin-1-ilo, grupo 5-oxo-imidazolidin-1-ilo, grupo 4-oxo-imidazolidin-2-ilo, grupo 2-oxo-imidazolidin-4-ilo, grupo 2-metil-imidazolidin-1-ilo, grupo 4-etil-imidazolidin-1-ilo, grupo 5-*n*-propil-imidazolidin-1-ilo, grupo 4-*n*-butil-imidazolidin-2-ilo, grupo 2-*n*-pentil-imidazolidin-4-ilo, grupo 2-*n*-hexil-imidazolidin-1-ilo, grupo 4-isobutil-imidazolidin-2-ilo, grupo 2-*terc*-butil-imidazolidin-4-ilo, grupo 2-oxo-3-metil-imidazolidin-1-ilo y grupo 2-oxo-3,4-dimetil-imidazolidin-1-ilo.
- Los ejemplos del grupo pirrolidinilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 2- ó 3-)pirrolidinilo, grupo (2- ó 3-)oxo-1-pirrolidinilo, grupo (3-, 4- ó 5-)oxo-2-pirrolidinilo y grupo (2-, 4- ó 5-)oxo-3-pirrolidinilo.
- Los ejemplos del grupo imidazolilo incluyen un grupo (1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolilo.
- Los ejemplos del grupo isoxazolilo incluyen un grupo (3-, 4- ó 5-)isoxazolilo.
- Los ejemplos del grupo arilsulfonilo incluyen un grupo arilsulfonilo cuyo resto arilo es fenilo, bifenilo, bifenilo sustituido, fenilo sustituido, naftilo y naftilo sustituido, y que puede tener, en el resto arilo, de 1 a 7, preferentemente, de 1 a 5, más

preferentemente, de 1 a 2 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos del sustituyente tal como fenilo, bifenilo y naftilo incluyen un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un átomo de halógeno, un grupo amino y similares. En el anillo fenilo, bifenilo, naftilo y similares, pueden estar presentes de uno a siete, preferentemente, de 1 a 5, más preferentemente, de 1 a 2 sustituyentes de al menos uno de estos tipos. Los ejemplos específicos del grupo arilsulfonilo que puede tener un grupo alquilo inferior en el grupo arilo incluyen un grupo fenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)bifenilsulfonilo, grupo (1- ó 2-)naftilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metilfenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)etilfenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-propilfenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-butilfenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-pentilfenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-hexilfenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)isobutilfenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*tert*-butilfenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)metil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)metil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)metil-4-bifenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-4-bifenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-propil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-propil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-propil-4-bifenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-butil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-butil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-butil-4-bifenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-pentil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-pentil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-pentil-4-bifenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-hexil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-hexil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*n*-hexil-4-bifenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-4-bifenilsulfonilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*tert*-butil-2-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*tert*-butil-3-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)*tert*-butil-4-bifenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-propil-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-propil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-butil-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-butil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-pentil-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-pentil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-hexil-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*n*-hexil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*tert*-butil-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)*tert*-butil-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)clorofenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)fluorofenilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)bromofenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)bromo-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)bromo-2-naftilsulfonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)aminofenilsulfonilo, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)amino-1-naftilsulfonilo, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)amino-2-naftilsulfonilo, grupo 2,3-dimetilfenilsulfonilo, grupo 3,4-dimetilfenilsulfonilo, grupo 2,4-dimetilfenilsulfonilo, grupo 2,5-dimetilfenilsulfonilo, grupo 2,6-dimetilfenilsulfonilo, grupo 2,4,6-trimetilfenilsulfonilo, grupo 3,4,5-trimetilfenilsulfonilo, grupo 2,3,4,5-tetraetilfenilsulfonilo, grupo pentametilfenilsulfonilo, grupo 2-metilnaftilsulfonilo, grupo 2,3-dimetilnaftilsulfonilo, grupo 3,4-dimetilfenilsulfonilo, grupo 3,5,7-trietilnaftilsulfonilo, grupo 3,4,5,7-tetrametilnaftilsulfonilo, grupo 2,3,4,5,7-pentametilnaftilsulfonilo, grupo 2,3,4,5,6,7-hexametilnaftilsulfonilo, grupo heptametilnaftilsulfonilo, grupo 2,3-diaminofenilsulfonilo, grupo 2,4,6-triaminofenilsulfonilo y grupo 2-metil-5-cloronaftilsulfonilo.

Los ejemplos del grupo piperidilo que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior; grupo alcanóilo inferior; grupo arilsulfonilo; grupo oxo; grupo hidroxilo y grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, alcanóilo inferior, grupo alcoxicarbonilo inferior y grupo alcanóilamin inferior-alcanóilo inferior incluyen un grupo piperidinilo que puede tener de 1 a 5, preferentemente, de 1 a 3, más preferentemente 1, sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); y un grupo arilsulfonilo según lo ilustrado anteriormente; un grupo oxo; un grupo hidroxilo; y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente, grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente, grupo alcoxicarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente y grupo alcanóilamin inferior-alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)piperidilo, grupo 1-metil-4-piperidilo, grupo 2-etil-4-piperidilo, grupo 3-*n*-propil-4-piperidilo, grupo 4-isopropil-4-piperidilo, grupo 2-*n*-butil-1-piperidilo, grupo 3-isobutil-1-piperidilo, grupo 4-*tert*-butil-1-piperidilo, grupo 1-*sec*-butil-2-piperidilo, grupo 2-*n*-pentil-2-piperidilo, grupo 3-(1-etilpropil)-2-piperidilo, grupo 4-iso-pentil-2-piperidilo, grupo 5-neopentil-2-piperidilo, grupo 6-*n*-hexil-2-piperidilo, grupo 1-(1,2,2-trimetilpropil)-3-piperidilo, grupo 2-(3,3-dimetilbutil)-3-piperidilo, grupo 3-(2-etilbutil)-3-piperidilo, grupo 4-isohexil-3-piperidilo, grupo 5-(3-metilpentil)-3-piperidilo, grupo 6-formil-3-piperidilo, grupo 1-acetil-4-piperidilo, grupo 2-propionil-4-piperidilo, grupo 3-butilil-4-piperidilo, grupo 4-isobutilil-4-piperidilo, grupo 2-pentanoil-1-piperidilo, grupo 3-*tert*-butilcarbonil-1-piperidilo, grupo 4-hexanoil-1-piperidilo, grupo 1-fenilsulfonil-2-piperidilo, grupo 2-(2-bifenilsulfonil)-2-piperidilo, grupo 3-(1-naftilsulfonil)-2-piperidilo, grupo 1-tosil-4-piperidilo, grupo 4-(4-etilfenilsulfonil)-2-piperidilo, grupo 5-(2-*n*-propilfenilsulfonil)-2-piperidilo, grupo 6-(3-*n*-butilfenilsulfonil)-2-piperidilo, grupo 1-(4-*n*-pentilfenilsulfonil)-3-piperidilo, grupo

	2-(2- <i>n</i> -hexilfenilsulfonil)-3-piperidilo,	grupo	3-(3-isobutilfenilsulfonil)-3-piperidilo,	grupo
	4-(4- <i>terc</i> -butilfenilsulfonil)-3-piperidilo,	grupo	5-(2-clorofenilsulfonil)-3-piperidilo,	grupo
	6-(4-fluorofenilsulfonil)-3-piperidilo,	grupo	1-(3-bromofenilsulfonil)-4-piperidilo,	grupo
	2-(2-aminofenilsulfonil)-4-piperidilo,	grupo	3-(2,3-dimetilfenilsulfonil)-4-piperidilo,	grupo
5	4-(3,4,5-trimetilfenilsulfonil)-4-piperidilo,	grupo	2-(2,3-diaminofenilsulfonil)-1-piperidilo,	grupo
	2-oxo-3-piperidilo,	grupo	4-hidroxi-1-piperidilo,	grupo
	2-amino-4-piperidilo,	grupo	2-hidroxi-3-piperidilo,	grupo
	2-etilamino-4-piperidilo,	grupo	4-amino-1-piperidilo,	grupo
	2-dimetilamino-4-piperidilo,	grupo	2-metilamino-4-piperidilo,	grupo
	4-formilamino-1-piperidilo,	grupo	4-etilamino-1-piperidilo,	grupo
	4-acetilamino-1-piperidilo,	grupo	4-dietilamino-1-piperidilo,	grupo
10	4-(<i>N</i> -metil- <i>n</i> -metoxicarbonilamino)-1-piperidilo,	grupo	4-(<i>N</i> -metil- <i>n</i> -acetilamino)-1-piperidilo,	grupo
	4-(<i>N</i> -metil- <i>n</i> - <i>terc</i> -butoxicarbonilamino)-1-piperidilo,	grupo	4-(<i>N</i> -metil- <i>n</i> -(<i>N</i> -acetilamino)acetilamino)-1-piperidilo.	grupo

Los ejemplos del grupo piperidilcarbonilo que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, grupo hidroxilo, grupo hidroxialquilo inferior, grupo alcanóilo inferior, grupo carboxialquilo inferior, grupo alquilcarbamoilo inferior-alquilo inferior, grupo carbamoilo, alcoxilo inferior, grupo carboxilo, grupo alcoxicarbonilo inferior, grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, alcanóilo inferior, grupo alcoxicarbonilo inferior y grupo aroilo), grupo piperidilo (en el que puede estar presente un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior, alcoxicarbonilo inferior y grupo aroilo), grupo piperazinilo (en el que puede estar presente un grupo alquilo inferior como sustituyente), grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decilo, grupo morfolinilo, grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que puede estar presente un grupo alquilo inferior como sustituyente), grupo piridilo, grupo piridiloxilo, grupo piridilalcoxilo inferior, grupo tetrahidroquinolilo (en el que puede estar presente un grupo oxo), grupo benzodioxolilo, grupo arilalcoxilo inferior (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, alquilo inferior, grupo alcoxilo inferior y grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno), grupo arilo (en el que puede estar presente un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, grupo alcoxilo inferior y grupo hidroxilo), grupo ariloxilo (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo ciano, átomo de halógeno, alquilo inferior, grupo alcoxilo inferior y grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), grupo arilalquilo inferior (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, alquilo inferior, grupo alcoxilo inferior y grupo alquilo inferior sustituido con halógeno) y grupo aroilo (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxilo inferior) incluyen:

un grupo piperidilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, 1) sustituyentes en el grupo piperidilo seleccionados del grupo que consiste en:

un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo hidroxilo;

a un grupo hidroxialquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y que tiene de 1 a 3 grupos hidroxilo);

un grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente;

un grupo carboxialquilo inferior según lo ilustrado anteriormente que tiene un resto alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente;

un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y sustituido con un grupo carbamoilo que tiene de 1 a 2 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo carbamoilo;

un grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo carboxilo;

un grupo alcoxicarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente,

un grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente, un grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente, grupo alcoxicarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente y grupo aroilo según lo ilustrado anteriormente);

un grupo piperidinilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos (preferentemente, 1) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente, grupo alcoxicarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente y grupo aroilo según lo ilustrado anteriormente);

un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) como sustituyente(s);

un grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decilo;

un grupo morfolinilo;

un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) como sustituyente(s);

un grupo piridilo;

un grupo piridiloxilo;

un grupo piridilalcoxilo inferior que tiene un resto alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente;

un grupo tetrahidroquinolilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos oxo);

un grupo benzodioxolilo (preferentemente, grupo benzo[1.3]dioxolilo);

- un grupo arilalcoxilo inferior que tiene un resto arilo y resto alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno según lo ilustrado anteriormente, grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente, alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente y grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno según lo ilustrado anteriormente);
- 5 un grupo arilo según lo ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno según lo ilustrado anteriormente, alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente y grupo hidroxilo);
- un grupo ariloxilo que tiene un resto arilo según lo ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, átomo de halógeno, grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente, grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente y grupo alquilo inferior sustituido con halógeno según lo ilustrado anteriormente);
- 10 un grupo arilalquilo inferior que tiene un resto arilo y resto alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, alquilo inferior, grupo alcoxilo inferior y grupo alquilo inferior sustituido con halógeno); y
- 15 un grupo aroilo según lo ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno según lo ilustrado anteriormente y un grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)etil-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metil-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ó 6-)metil-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metil-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)metil-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)hidroxi-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)hidroxi-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)hidroxi-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)hidroxi-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)hidroximetil-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)hidroximetil-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)hidroximetil-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)hidroximetil-4-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)(2-hidroxietil)-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N*-etil-carbamoilmetil)-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(*N*-etil-carbamoil-metil)-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(*N*-etil-carbamoilmetil)-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)*N*-etil-carbamoilmetil-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)carbamoil-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)carbamoil-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)carbamoil-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)carbamoil-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)carboxi-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)carboximetil-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)etoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metoxi-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metoxi-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metoxi-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)metoxi-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metoxicarbonil-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metoxicarbonil-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)metoxicarbonil-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)etoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)etoxicarbonil-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)etoxicarbonil-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)etoxicarbonil-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)acetilamino-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)acetilamino-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)acetilamino-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)acetilamino-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*tert*-butoxicarbonilamino-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)*tert*-butoxicarbonilamino-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)*tert*-butoxicarbonilamino-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)*tert*-butoxicarbonilamino-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)butirilamino-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)benzoilamino-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N*-metil-*n*-acetilamino)-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N*-metil-*n*-butirilamino)-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N*-metil-*n*-*tert*-butoxicarbonilamino)-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(*N*-metil-*n*-benzoilamino)-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[1-acetil-(2-, 3- ó 4-)piperidil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[1-butiril-(2-, 3- ó 4-)piperidil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[1-*tert*-butoxicarbonil-(2-, 3- ó 4-)piperidil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[1-benzoil-(2-, 3- ó 4-)piperidil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(1-piperazinil)-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 9-)[1-(3,4-dimetilpiperazinil)]-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[1-(3,4-dimetilpiperazinil)]-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[1-(3,4-dimetilpiperazinil)]-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)[1-(3,4-dimetilpiperazinil)]-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[1-(4-metilpiperazinil)]-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 3- ó 4-)[1-(4-metilpiperazinil)]-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2- ó 4-)[1-(4-metilpiperazinil)]-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2- ó 3-)[1-(4-metilpiperazinil)]-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)morfolinil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)morfolinil]-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[(2-, 3- ó 4-)morfolinil]-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2- ó 3-)[(2-, 3- ó 4-)morfolinil]-4-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6- ó 7-)(4-metil-hexahidro-1,4-diazepinil)-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(4-metil-hexahidro-1,4-diazepinil)-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(4-metil-hexahidro-1,4-diazepinil)-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)(4-metil-hexahidro-1,4-diazepinil)-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(1,4-dioxo-8-azaspiro[4.5]dec-8-il)-1-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(1,4-dioxo-8-azaspiro[4.5]dec-8-il)-2-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(1,4-dioxo-8-azaspiro[4.5]dec-8-il)-3-piperidilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)(1,4-dioxo-8-azaspiro[4.5]dec-8-il)-4-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 4- ó 5-)benzo[1,3]dioxolil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[2-oxo-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)-1,2,3,4-tetrahydroquinolil]-1-piperidilcarbonilo, grupo 4-[2-oxo-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)-1,2,3,4-tetrahydroquinolil]-2-

5 ó 3-metil-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)piridil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)piridiloxi]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)piridilmetoxi]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)fluorobenciloxi]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)clorobenciloxi]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)bromobenciloxi]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)metilbenciloxi]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)trifluorometoxibenciloxi]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(3,4-diclorobenciloxi)-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(3,4-dimetoxibenciloxi)-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(3-cloro-4-metoxibenciloxi)-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)fluorofenoxi]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)clorofenoxi]-1-piperidilcarbonil; grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)cianofenoxi]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)metoxifenoxi]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)metilfenoxi]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)trifluorometoxifenoxi]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)fenil-1-piperidilcarbonilo, grupo 4-hidroxi-(2-, 3- ó 4-)fenil-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)clorofenil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)metoxifenil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)hidroxifenoxi]-1-piperidilcarbonilo, grupo 4-hidroxi-(2-, 3- ó 4-)fenil-1-piperidilcarbonilo, grupo 4-etoxicarbonil-(2-, 3- ó 4-)fenil-1-piperidilcarbonilo, grupo 4-hidroxi-(2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)clorofenil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)bencil-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)clorobencil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)metilbencil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)metoxibencil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)trifluorometoxibencil]-1-piperidilcarbonilo, grupo 4-hidroxi-(2-, 3- ó 4-)bencil-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)clorobenzoil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)metoxibenzoil]-1-piperidilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)fluorobenzoil]-1-piperidilcarbonilo y grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)trifluorometoxibencil]-1-piperidilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo hidroxialquilo inferior, grupo carbamoilo, grupo hidroxilo, grupo amino (que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, alcanóilo inferior y grupo aroilo en el mismo), grupo morfolinilalquilo inferior, grupo pirrolidinilalquilo inferior, grupo piperidilalquilo inferior, grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener un grupo alquilo inferior en el mismo como sustituyente), grupo aminoalquilo inferior (que puede tener un grupo alquilo inferior en el mismo como sustituyente) y grupo ariloxilo (que puede tener, en el grupo arilo, un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno), grupo ariloxialquilo inferior (en el grupo arilo, puede estar presente un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno) y un grupo tetrahidroquinolilo (en el que puede estar presente un grupo oxo) incluyen un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, 1) sustituyentes en el grupo pirrolidinilo que se seleccionan del grupo que consiste en:

un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente que tiene de 1 a 3 grupos hidroxilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo carbamoilo;

un grupo hidroxilo;

un grupo amino (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente, un grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente, y un grupo aroilo según lo ilustrado anteriormente);

un grupo morfolinilalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo pirrolidinilalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo piperidilalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo piperazinilalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) (puede tener presentes de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo piperazinilo como sustituyente/s);

un grupo aminoalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) (1 a 2 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) pueden estar presentes en el grupo amino como sustituyente/s), grupo ariloxilo que tiene un resto arilo según lo ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferentemente 1) grupos alcoxilo inferior sustituidos con halógeno), grupo ariloxialquilo inferior que tiene un resto arilo y resto alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos alcoxilo inferior sustituidos con halógeno) y un grupo tetrahidroquinolilo (en el que puede estar presente un solo grupo oxo). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 2- ó 3-)pirrolidinilcarbonilo, grupo (2- ó 3-)hidroximetil-1-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)hidroximetil-2-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)hidroximetil-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (2- ó 3-)carbamoil-1-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)carbamoil-2-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)carbamoil-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (2- ó 3-)hidroxi-1-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)hidroxi-2-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)hidroxi-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (2- ó 3-)amino-1-pirrolidinilcarbonilo, grupo (2- ó 3-)acetamido-1-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)acetamido-2-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)acetamido-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)butirilamino-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)(*N*-metil-*n*-acetilamino)-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)(*N*-metil-*n*-butirilamino)-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)benzoilamino-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)(*N*-metil-*n*-benzoilamino)-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (2- ó 3-)[(2-, 3- ó 4-)morfolinilmetil]-1-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)[(2-, 3- ó 4-)

4-)morfolinilmetil]-2-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)[(2-, 3- ó 4-)morfolinilmetil]-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (2- ó 3-)[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinilmetil]-1-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinilmetil]-2-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinilmetil]-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (2- ó 3-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidilmetil]-1-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidilmetil]-2-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidilmetil]-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (2- ó 3-)(4-etil-1-piperazinilmetil)-1-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ó 5-)(4-metil-1-piperazinilmetil)-2-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)(4-metil-1-piperazinilmetil)-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (2- ó 3-)*N,N*-dimetilaminometil-1-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)*N,N*-dimetilaminometil-2-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ó 5-)*N,N*-dimetilaminometil-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (2- ó 3-)*N,N*-dietilaminometil-1-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)*N,N*-dietilaminometil-2-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ó 5-)*N,N*-dietilaminometil-3-pirrolidinilcarbonil, grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)(4-trifluorometoxifenoximetil)-3-pirrolidinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ó 5-)(4-trifluorometoxifenoxi)-3-pirrolidinilcarbonilo y grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)(2-oxi-1,2,3,4-tetrahydroquinolil)-3-pirrolidinilcarbonilo.

Los ejemplos de un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, grupo cicloalquilo C3-C8, grupo alcanóilo inferior, grupo hidroxialquilo inferior, grupo alcoxi inferior-alquilo inferior, grupo alcocicarbonilo inferior, grupo aminoalquilo inferior (puede estar presente un grupo alquilo inferior en el grupo amino como sustituyente), grupo piperidilalquilo inferior (puede estar presente un grupo alquilo inferior en el grupo piperidilo como sustituyente), grupo morfolinilalquilo inferior, grupo pirrolidinilalquilo inferior, grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior, grupo tetrahidrofurilalquilo inferior, grupo piridilalquilo inferior (puede estar presente un grupo fenilo en el grupo alquilo inferior como sustituyente), grupo imidazolilalquilo inferior, grupo furilalquilo inferior, grupo pirrolidinilcarbonilalquilo inferior, grupo piperidilo que puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente, grupo piridilo (puede estar presente un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, grupo ciano y grupo alquilo inferior sustituido con halógeno en el grupo piridilo como sustituyente), grupo tieno[2,3-c]piridilo, grupo arilo (en el que puede estar presente un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), grupo aroilo, grupo furilalquilo inferior, grupo arilalcocicarbonilo inferior y grupo oxo incluyen un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, 1) sustituyentes en el grupo piperazinilo, que se selecciona del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo cicloalquilo C3-C8 según lo ilustrado anteriormente; un grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente; un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono; a un grupo hidroxialquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono con 1 a 3 grupos hidroxilo); un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y 1 a 3 grupos alcóxilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alcóxilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono)); un grupo alcocicarbonilo inferior según lo ilustrado; un grupo aminoalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente, preferentemente, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono (1 a 2 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) puede estar presente en el grupo amino como sustituyente/s); un grupo piperidilalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente, preferentemente, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono (1 a 3 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) puede estar presente en el grupo piperidilo como sustituyente/s); un grupo morfolinilalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo pirrolidinilalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo 1,3 dioxolanilalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo tetrahidrofurilalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo piridilalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) (pueden estar presentes 1 a 3 grupos fenilo en el grupo alquilo como sustituyente/s); un grupo imidazolilalquilo inferior, cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo furilalquilo inferior, cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo pirrolidinilcarbonilalquilo inferior, cuyo resto alquilo inferior es como se ilustra anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo piridilo (de 1 a 3 grupos (preferentemente, 1) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), grupo ciano y grupo alquilo inferior sustituido con halógeno según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con 1 un átomo de halógeno) puede estar presente en el grupo piridilo); un grupo tieno[2,3-c]piridilo; grupo arilo según lo ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), grupo aroilo según lo ilustrado anteriormente, grupo furilalquilo inferior que tiene un resto alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente, grupo arilalcoxicarbonilo inferior que tiene un resto arilo y un resto alcoxicarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente y un grupo oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1 - ó 2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)etil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)etil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-propil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)*n*-propil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-butil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)*n*-butil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(1-etil-*n*-propil)]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ó 6-)[(1-etil-*n*-propil)]-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)isopropil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)isopropil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*tert*-butil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)*tert*-butil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-hexil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)*n*-hexil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)ciclopentil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)ciclopentil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)cicloheptil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)cicloheptil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)acetil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)butiril-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)acetil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(2-hidroxi)etil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(2-hidroxi)etil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(2-metoxi)etil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(2-metoxi)etil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(3-metoxipropil)-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(3-metoxipropil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(4-metoxibutil)-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(4-metoxibutil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)etoxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)etoxicarbonil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*tert*-butoxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)*tert*-butoxicarbonil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metoxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metoxicarbonil-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[3-(*N,N*-dimetilamino)propil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[3-(*N,N*-dimetilamino)propil]-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(*N,N*-dimetilamino)etil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(2-(*N,N*-dimetilamino)etil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(2-(1-piperidil)etil)-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(2-(1-piperidil)etil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(1-metil-3-piperidil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[(1-metil-3-piperidil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(1-metil-4-piperidil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[(1-metil-4-piperidil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(4-morfolinil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[2-(4-morfolinil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(1-pirrolidinil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[2-(1-pirrolidinil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(1,3-dioxolanil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[2-(1,3-dioxolanil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(1,3-dioxolanil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[2-(1,3-dioxolanil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(2-tetrahidrofurilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(2-tetrahidrofurilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(2-piridilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(2-piridilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(3-piridilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(3-piridilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(4-piridilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(4-piridilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(9-piridil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[2-(4-piridil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(2-piridil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[2-(2-piridil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[2-fenil-2-(4-piridil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[2-fenil-2-(4-piridil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(1-imidazolil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[2-(1-imidazolil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(3-furilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(3-furilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(1-pirrolidinilcarbonilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(1-pirrolidinilcarbonilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(1-metil-4-piperidil)-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(1-metil-4-piperidil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)piridil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(2-, 3- ó 4-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(3-ciano-2-piridil)-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(3-ciano-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(4-metil-2-piridil)-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(4-metil-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(3-metil-2-piridil)-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(3-metil-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)(3-trifluorometil-2-piridil)-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(3-trifluorometil-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3-, 4-, 5-, ó 6-)tieno[2,3-c]piridil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[(2-, 3-, 4-, 5-, ó 6-)tieno[2,3-c]piridil]-2-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)fenil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)clorofenil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)metilfenil]-1-piperazinilcarbonilo, grupo 3-oxo-(2- ó 4-)fenil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)benzozil-1-piperazinilcarbonilo, grupo (2-, 3- ó 4-)[12- ó 3-)furilcarbonil]-1-piperazinilcarbonilo y grupo (2-, 3- ó 4-)bencilcoxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo.

Los ejemplos de grupo hexahidroazepinilcarbonilo incluyen un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)hexahidroazepinilcarbonilo.

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

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

15 Los ejemplos del dihidropirrolilcarbonilo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo dihidropirrolilcarbonilo según lo ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 4, preferentemente, de 1 a 2 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1 -, 2- ó 3-)(2,-5-dihidropirrolilcarbonilo), grupo 2,5-dimetil-1-(2,5-dihidropirrolilcarbonilo) y grupo 2,5-dimetil-1-(2,3-dihidropirrolilcarbonilo).

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

25 Los ejemplos del grupo morfolinilcarbonilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, y grupo piperidilalquilo inferior y grupo arilo incluyen un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener de 1 a 5 grupos, más preferentemente, de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos piperidilo como sustituyente/s), un grupo arilo según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 3- ó 4-)morfolinilcarbonilo, grupo 2,6-dimetil-4-morfolinilcarbonilo, grupo 2-(1-piperidilmetil)-4-morfolinilcarbonilo y grupo 2-fenil-4-morfolinilcarbonilo.

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

35 Los ejemplos del grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener un grupo arilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcoxilo inferior y un grupo ciano incluyen un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos arilo que pueden tener de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo inferior y un grupo ciano según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 3-, 4- ó 5-)tiazolidinil-carbonilo, grupo (2-, 4- ó 5-)[(2-, 3- ó 4-)metoxifenil]-3-tiazolidinilcarbonilo y grupo (2-, 4- ó 5-)[(2-, 3- ó 4-)cianofenil]-3-tiazolidinilcarbonilo.

40 Los ejemplos del grupo azabicyclo[3.2.2]nonilcarbonilo incluyen un grupo 1-azabicyclo[3.2.2]non-(2-, 3-, 5- ó 6-)ilcarbonilo, grupo 2-azabicyclo[3.2.2]non-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6- ó 7-)ilcarbonilo, grupo 3-azabicyclo[3.2.2]non-(1-, 2-, 3- ó 6-)ilcarbonilo y grupo 6-azabicyclo[3.2.2]non-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- ó 9-)ilcarbonilo.

45 Los ejemplos del grupo azabicyclo[3.2.1]octilcarbonilo que puede tener grupo ariloxilo sustituido o no sustituido con halógeno incluyen un grupo azabicyclo[3.2.1]octilcarbonilo que puede tener de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos arilo sustituidos con halógeno según lo ilustrado anteriormente (preferentemente, un grupo arilo que puede estar sustituido con 1 a 3, preferentemente, 1 átomo de halógeno) o un grupo azabicyclo[3.2.1]octilcarbonilo que puede tener de 1 a 2 (preferentemente, 1) grupos arilo sin sustituir según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1-azabicyclo[3.2.1]oct-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)ilcarbonilo, grupo 2-azabicyclo[3.2.1]oct-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)ilcarbonilo, grupo 3-azabicyclo[3.2.1]oct-(1-, 2-, 3-, 6- ó 8-)ilcarbonilo, grupo 6-azabicyclo[3.2.1]oct-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)ilcarbonilo, grupo 8-azabicyclo[3.2.1]oct-(1-, 2-, 3-, 6- ó 8-) ilcarbonilo, grupo 3-(feniloxi)-1-azabicyclo[3.2.1]oct-2-ilcarbonilo, grupo 3-(2-bifeniloxi)-1-azabicyclo[3.2.1]oct-3-ilcarbonilo, grupo 3-(1-naftiloxi)-1-azabicyclo[3.2.1]oct-4-ilcarbonilo, grupo 3-(3-metilfeniloxi)-1-azabicyclo[3.2.1]oct-5-ilcarbonilo, grupo 3-(4-etilfeniloxi)-1-azabicyclo[3.2.1]oct-6-ilcarbonilo, grupo 3-(2-*n*-propilfeniloxi)-1-azabicyclo[3.2.1]oct-7-ilcarbonilo, grupo 3-(3-*n*-butilfeniloxi)-1-azabicyclo[3.2.1]oct-8-ilcarbonilo, grupo 3-(4-*n*-pentilfeniloxi)-2-azabicyclo[3.2.1]oct-1-ilcarbonilo, grupo 3-(2-*n*-hexilfeniloxi)-2-azabicyclo[5,2,1]oct-2-ilcarbonilo, grupo 3-(3-isobutilfeniloxi)-2-azabicyclo(3,2,1)oct-3-ilcarbonilo, grupo 3-(4-*terc*-butilfeniloxi)-2-azabicyclo[3.2.1]oct-4-ilcarbonilo, grupo 3-(2-clorofeniloxi)-2-azabicyclo[3.2.1]oct-5-ilcarbonilo, grupo 3-(3-fluorofeniloxi)-8-aza-bicyclo[3.2.1]oct-8-ilcarbonilo, grupo 3-(3-bromofeniloxi)-2-azabicyclo[3.2.1]oct-6-ilcarbonilo, grupo 3-(2-aminofeniloxi)-2-azabicyclo[3.2.1]oct-7-ilcarbonilo, grupo 3-(2,3-dimetilfeniloxi)-2-azabicyclo[3.2.1]oct-8-ilcarbonilo, grupo 3-(3,4,5-trimetilfeniloxi)-8-azabicyclo[3.2.1]oct-1-ilcarbonilo y grupo 3-(2,3-diaminofeniloxi)-8-azabicyclo[3.2.1]oct-2-ilcarbonilo.

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

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

4-, 9-tetrahidropirido[3,4-b]indolilcarbonilo).

Los ejemplos del grupo piperazinalquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior en el grupo piperazinilo incluyen un grupo piperazinalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), pudiendo estar presentes de 1 a 7, preferentemente, de 1 a 5, más preferentemente 1, grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo piperazinilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1 - ó 2-)piperazinilmetilo, grupo 2-[(1 - ó 2-)piperazinil]etilo, grupo 1-(1 - ó 2-)piperazinil]etilo, grupo 3-[(1- ó 2-)piperazinil]propilo, grupo 4-[(1- ó 2-)piperazinil]butilo, grupo 5-[(1- ó 2-)piperazinil]pentilo, grupo 6-[(1- ó 2-)piperazinil]hexilo, grupo 1,1-dimetil-2-[(1- ó 2-)piperazinil]etilo, grupo 2-metil-3-[(1- ó 2-)piperazinil]propilo, grupo 4-metil-1-piperazinilmetilo, grupo 2-(4-metil-2-piperazinil]etilo, grupo 3-(2-etil-1-piperazinil]propilo, grupo 4-(3-*n*-propil-1-piperazinil]butilo, grupo 5-(4-*n*-butil-1-piperazinil]pentilo, grupo 6-(1-*n*-pentil-2-piperazinil]hexilo, grupo 2-*n*-hexil-2-piperazinilmetilo, grupo 2-(3-isobutil-2-piperazinil]etilo y 3-(4-*terc*-butil-2-piperazinil]propilo.

Los ejemplos del grupo morfolinilcarbonilalquilo inferior incluyen un grupo morfolinilcarbonilalquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es un grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-morfolinilcarbonilmetilo, grupo 3-morfolinilcarbonilmetilo, grupo 4-morfolinilcarbonilmetilo, grupo 2-(2-morfolinilcarbonil]etilo, grupo 2-(3-morfolinilcarbonil]etilo, grupo 2-(4-morfolinilcarbonil]etilo, grupo 1-(2-morfolinilcarbonil]etilo, grupo 1-(3-morfolinilcarbonil]etilo, grupo 1-(4-morfolinilcarbonil]etilo, grupo 3-(2-morfolinilcarbonil]propilo, grupo 3-(3-morfolinilcarbonil]propilo, grupo 3-(4-morfolinilcarbonil]propilo, grupo 4-(2-morfolinilcarbonil]butilo, grupo 4-(3-morfolinilcarbonil]butilo, grupo 4-(4-morfolinilcarbonil]butilo, grupo 5-(2-morfolinilcarbonil]pentilo, grupo 5-(3-morfolinilcarbonil]pentilo, grupo 5-(4-morfolinilcarbonil]pentilo, grupo 6-(2-morfolinilcarbonil]hexilo, grupo 6-(3-morfolinilcarbonil]hexilo, grupo 6-(4-morfolinilcarbonil]hexilo, grupo 3-metil-3-(2-morfolinilcarbonil]propilo, grupo 3-metil-3-(3-morfolinilcarbonil]propilo, grupo 3-metil-3-(4-morfolinilcarbonil]propilo, grupo 1,1-dimetil-2-(2-morfolinilcarbonil]etilo, grupo 1,1-dimetil-2-(3-morfolinilcarbonil]etilo y grupo 1,1-dimetil-2-(4-morfolinilcarbonil]etilo.

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

Los ejemplos del aminoalcoxilo inferior (en el grupo amino, puede estar presente un grupo alquilo inferior) incluyen un grupo alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente (un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 5 (preferentemente, 1) grupos amino que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo aminometoxilo, grupo 2-aminoetoxilo, grupo 1-aminoetoxilo, grupo 3-aminopropoxilo, grupo 4-aminobutoxilo, grupo 5-aminopentoxilo, grupo 6-aminohexiloxilo, grupo 1,1-dimetil-2-aminoetoxilo, grupo *N,N*-dimetilaminometoxilo, grupo *N*-metil-*n*-etilaminometoxilo, grupo *N*-metilaminometoxilo, grupo 2-(*N*-metilamino)etoxilo, grupo 2-(*N,N*-dimetilamino)etoxilo, grupo 2-(*N,N*-diisopropilamino)etoxilo y grupo 3-(*N,N*-dimetilamino)propoxilo.

Los ejemplos del alcoxi inferior-alcoxilo inferior incluyen un grupo alcoxi inferior-alcoxi inferior que tiene a resto alcoxilo inferior según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metoximetoxilo, grupo 2-metoxietoxilo, grupo 1-etoxietoxilo, grupo 2-etoxietoxilo, grupo 2-isobutoxietoxilo, grupo 2,2-dimetoxietoxilo y grupo 2-metoxi-1- metiletoxilo.

Los ejemplos del grupo piperazinilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo oxo, alquilo inferior, grupo alcanóilo inferior y grupo alcoxycarbonilo inferior incluyen un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 (1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, grupo alquilo inferior según lo ilustrado anteriormente, grupo alcanóilo inferior según lo ilustrado anteriormente y grupo alcoxycarbonilo inferior según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1 - ó 2-)piperazinilo, grupo (2-, 3- ó 4-)metil-1-piperazinilo, grupo (1 -, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metil-2-piperazinilo, grupo (2-, 3- ó 4-)etil-1-piperazinilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)etil-2-piperazinilo, grupo (2-, 3- ó 4-)*n*-propil-1-piperazinilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)

6-)-*n*-propil-2-piperazinilo, grupo (2-, 3- ó 4-)-formil-1-piperazinilo, grupo (2-, 3- ó 4-)-acetil-1-piperazinilo, grupo (2-, 3- ó 4-)-propionil-1-piperazinilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)-propionil-2-piperazinilo, grupo (2-, 3- ó 4-)-butiril-1-piperazinilo, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)-butiril-2-piperazinilo, grupo (2-, 3- ó 4-)-metoxicarbonil-1-piperazinilo, grupo (2-, 3- ó 4-)-etoxicarbonil-1-piperazinilo, (2-, 3- ó 4-)-*tert*-butoxicarbonil-1-piperazinilo, grupo (2- ó 3-)-oxo-1-piperazinilo, grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5- ó 6-)-acetil-1-piperazinilo, grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5- ó 6-)-butiril-1-piperazinilo, grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5- ó 6-)-metoxicarbonil-1-piperazinilo y grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5- ó 6-)-metoxicarbonil-1-piperazinilo.

Los ejemplos del grupo 1, 3, 8-triazaspiro[4.5]decanilcarbonilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo arilo incluyen un grupo 1,3,8-triazaspiro[4.5]decanilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo arilo según lo ilustrado anteriormente. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1,3,8-triazaspiro[9.5]decanil-(1, 2, 3, 4 ó 8-)-ilcarbonilo, grupo 1-fenil-1,3,8-triazaspiro[4.5]decanil-8-ilcarbonilo y grupo 1-fenil-4-oxo-1,3,8-triazaspiro[4.5]decanil-8-ilcarbonilo.

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

Los ejemplos del grupo tetrahidropiridilcarbonilo que puede tener un grupo piridilo incluyen un grupo tetrahidropiridilcarbonilo según lo ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 3 (preferentemente 1) grupos piridilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 3- ó 4-)piridil-1,2,3,6-tetrahidropiridil-1-ilcarbonilo.

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

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

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

(1) un grupo heteromonocíclico saturado de 3 a 8 (preferentemente, de 5 a 6) miembros que tiene de 1 a 4 (preferentemente, de 1 a 2) átomos de nitrógeno (por ejemplo, grupo pirrolidinilo, grupo imidazolidinilo, grupo piperidilo, grupo hexahidropirimidinilo, grupo piperazinilo, grupo azepanilo y grupo azocanilo);

(2) un grupo heteromonocíclico insaturado de 3 a 8 (preferentemente, de 5 a 6) miembros que tiene de 1 a 4 (preferentemente, de 1 a 3) átomos de nitrógeno, por ejemplo, un grupo pirrolilo, grupo dihidropirrolilo, tal como grupo 1*H*-2,5-dihidropirrolilo, grupo imidazolilo (tal como grupo 1*H*-imidazolilo), grupo dihidroimidazolilo (tal como grupo 1*H*-2,3-dihidroimidazolilo), grupo triazolilo (tal como grupo 4*H*-1,2,4-triazolilo, grupo 1*H*-1,2,3-triazolilo y grupo 2*H*-1,2,3-triazolilo), grupo dihidrotriazolilo (tal como grupo 1*H*-4,5-dihidro-1,2,4-triazolilo), grupo pirazolilo, grupo piridilo, grupo dihidropiridilo (tal como 1,2-dihidropiridilo), grupo pirimidinilo, grupo dihidropirimidinilo (tal como grupo 1,6-dihidropirimidinilo), grupo pirazinilo, grupo dihidropirazinilo (tal como grupo 1,2-dihidropirazinilo), grupo piridazinilo y grupo tetrazolilo (tal como grupo 1*H*-tetrazolilo y grupo 2*H*-tetrazolilo);

(3) un grupo heteromonocíclico insaturado de 3 a 8 (preferentemente, de 5 a 6) miembros que tiene de 1 a 2 (preferentemente 1) átomos de oxígenos y de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) átomos de nitrógeno, por ejemplo, un grupo oxazolilo, grupo isoxazolilo, grupo oxadiazolilo (tal como grupo 1,2,4-oxadiazolilo, grupo 1,3,4-oxadiazolilo y grupo 1,2,5-oxadiazolilo) y un grupo heteromonocíclico saturado de 3 a 8 (preferentemente, de 5 a 6) miembros que tiene de 1 a 2 (preferentemente 1) átomos de oxígenos y de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) átomos de nitrógeno, por ejemplo, un grupo oxazolidinilo, grupo isoxazolidinilo y grupo morfolinilo;

(4) un grupo heteromonocíclico insaturado de 3 a 8 (preferentemente, de 5) miembros que tiene de 1 a 2 átomos de azufre y de 1 a 3 átomos de nitrógeno, por ejemplo, un grupo tiazolilo, grupo dihidrotiazolilo (tal como grupo 2,3-dihidrotiazolilo), grupo isotiazolilo, grupo tiadiazolilo (tal como grupo 1,2,3-tiadiazolilo, grupo 1,2,4-tiadiazolilo, grupo 1,3,4-tiadiazolilo y grupo 1,2,5-tiadiazolilo) y grupo dihidrotiazinilo;

(5) un grupo heteromonocíclico saturado de 3 a 8 (preferentemente, de 5 a 6) miembros que tiene de 1 a 2 átomos de azufre y 1 a 3 átomos de nitrógeno, por ejemplo, un grupo tiazolidinilo;

(6) un grupo heteromonocíclico saturado de 3 a 8 (preferentemente, de 5 a 6) miembros que tiene de 1 a 2 átomos de oxígeno, por ejemplo, un grupo tetrahidrofurilo y un grupo tetrahidropiranilo;

(7) un grupo heteromonocíclico insaturado de 3 a 8 (preferentemente, de 5 a 6) miembros que tiene de 1 a 2 átomos de oxígeno, por ejemplo, un grupo piranilo (tal como grupo 2*H*-piranilo);

(8) un grupo heteromonocíclico saturado de 3 a 8 (preferentemente, de 5 a 6) miembros que tiene de 1 a 2 átomos de azufre, por ejemplo, un grupo tetrahidrotiofurilo y un grupo tetrahidrotiopiranilo; y

(9) un grupo heteromonocíclico insaturado de 3 a 8 (preferentemente, de 5 a 6) miembros que tiene de 1 a 2 átomos de azufre, por ejemplo, un grupo tienilo y un grupo tiopiranilo (tal como 2*H*-tiopiranilo).

Entre ellos, cabe mencionar preferentemente un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 2 heteroátomos seleccionados entre un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno y átomo de azufre, y seleccionados del grupo que consiste en un grupo pirrolidinilo, grupo piperidilo, grupo pirazolilo, grupo piridilo, grupo pirimidinilo, grupo pirazinilo, grupo isoxazolilo, grupo tiazolilo, grupo piranilo y grupo tienilo; y más preferentemente, cabe mencionar un

grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 2 átomos de nitrógeno y se selecciona del grupo que consiste en un grupo pirrolidinilo, grupo piperidilo, grupo pirazolilo, grupo piridilo, grupo pirimidinilo y grupo tiazolilo.

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

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

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

Los ejemplos del grupo dihydrobenzimidazolilo incluyen un grupo (1-, 2-, 4- ó 5-)-2,3-dihydro-1*H*-benzimidazolilo.

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

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

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

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

Los ejemplos del grupo dihydrobenzoxazolilo incluyen un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6- ó 7-)-2,3-dihydrobenzo-oxazolilo.

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

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

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

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

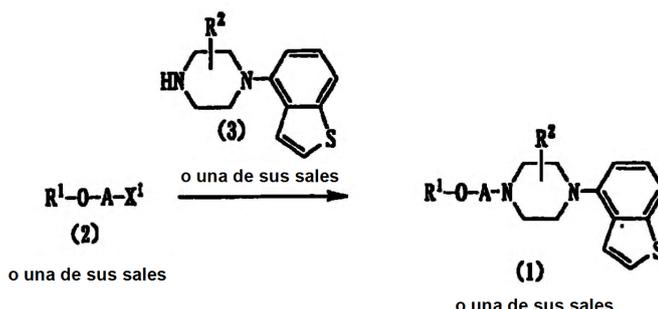
Los ejemplos del grupo benzoxatiolilo incluyen un grupo (2-, 4-, 5-, 6- ó 7-)-benzo[d][1,3]oxatiolilo, grupo (3-, 4-, 5-, 6- ó 7-)-3*H*-benzo[c][1,2]oxatiolilo y grupo (3-, 4-, 5-, 6- ó 7-)-3*H*-benzo[d][1,2]oxatiolilo.

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

50 Es posible producir un compuesto heterocíclico (en lo sucesivo, denominado compuesto (1)) representado por la fórmula general (1) mediante diversos tipos de procedimientos, por ejemplo, mediante un procedimiento mostrado en la siguiente fórmula de reacción 1 o fórmula de reacción 2,

[Fórmula 4]

Fórmula de reacción 1



5 en la que R^1 , R^2 y A son como se definen anteriormente; y X^1 es un átomo de halógeno o un grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno.

Los ejemplos del grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de hidrógeno incluyen alcanosulfoniloxilo inferior, grupo arilsulfoniloxilo y grupo aralquilsulfoniloxilo.

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

Los ejemplos específicos del grupo alcanosulfoniloxilo inferior representado por X^1 incluyen un grupo alcanosulfoniloxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, tal como un grupo metanosulfoniloxilo, grupo etanosulfoniloxilo, grupo isopropanosulfoniloxilo, grupo *n*-propanosulfoniloxilo, grupo *n*-butanosulfoniloxilo, grupo *tert*-butanosulfoniloxilo, grupo *n*-pentanosulfoniloxilo y grupo *n*-hexanosulfoniloxilo.

Los ejemplos específicos del grupo arilsulfoniloxilo representado por X^1 incluyen un grupo fenilsulfoniloxilo y grupo naftilsulfoniloxilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo nitro y un átomo de halógeno en el anillo fenilo. Los ejemplos específicos del grupo fenilsulfoniloxilo que puede tener un sustituyente incluyen un grupo fenilsulfoniloxilo, grupo 4-metilfenilsulfoniloxilo, grupo 2-metilfenilsulfoniloxilo, grupo 4-nitrofenilsulfoniloxilo, grupo 4-metoxifenilsulfoniloxilo, grupo 2-nitrofenilsulfoniloxilo y grupo 3-clorofenilsulfoniloxilo. Los ejemplos específicos del grupo naftilsulfoniloxilo incluyen grupo α -naftilsulfoniloxilo y β -naftilsulfoniloxilo.

Los ejemplos del grupo aralquilsulfoniloxilo representado por X^1 incluyen un grupo alquilsulfoniloxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y que está sustituido con un grupo fenilo; y un grupo alquilsulfoniloxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y que está sustituido con un grupo naftilo; pudiendo tener ambos de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo alcoxilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo nitro y un átomo de halógeno en el anillo de fenilo. Los ejemplos específicos del grupo alquilsulfoniloxilo sustituido con un grupo fenilo según lo mencionado anteriormente incluyen un grupo bencilsulfoniloxilo, grupo 2-feniletilsulfoniloxilo, grupo 4-fenilbutilsulfoniloxilo, grupo 2-metilbencilsulfoniloxilo, grupo 4-metoxibencilsulfoniloxilo, grupo 4-nitrobencilsulfoniloxilo y grupo 3-clorobencilsulfoniloxilo. Los ejemplos específicos del grupo alquilsulfoniloxilo sustituido con un grupo naftilo incluyen un grupo α -naftilmetilsulfoniloxilo y grupo β -naftilmetilsulfoniloxilo.

El compuesto (1) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto (denominado en lo sucesivo compuesto (2)) representado por la fórmula general (2) y un compuesto (denominado en lo sucesivo compuesto (3)) representado por la fórmula general (3).

En general, esta reacción se realiza en un disolvente convencional que no pueda afectar negativamente a la reacción, tal como agua; un disolvente basado en alcohol, tal como metanol, etanol, isopropanol, *n*-butanol, trifluoroetanol y etilenglicol; un disolvente basado en cetona tal como acetona y metiletilcetona; un disolvente basado en éter, tal como tetrahidrofurano, dioxano, dietiléter y diglima; un disolvente basado en éster tal como metilacetato y etilacetato; un disolvente polar no protónico, tal como acetonitrilo, *N,N*-dimetilformamida y dimetilsulfóxido; un disolvente basado en hidrocarburo halogenado, tal como cloruro de metileno, cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, la reacción se puede realizar en una mezcla en disolución de estos disolventes convencionales. En general, la reacción se realiza en presencia de una base inorgánica, tal como metal alcalino (p. ej., sodio y potasio), un carbonato ácido de metal alcalino (p. ej., carbonato ácido de litio, carbonato ácido de sodio y carbonato ácido de potasio), hidróxido de metal alcalino (p. ej., hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio), carbonato de metal alcalino (p. ej., carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio), alcóxido inferior de metal alcalino (p. ej., metóxido de sodio y etóxido de sodio) y un hidruro (p. ej., hidruro de sodio e hidruro de potasio);

o en presencia de una base orgánica, tal como trialkilamina (p. ej., trimetilamina, trietilamina, *N*-etil-diisopropilamina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilanelina, *N*-metilmorfolina, 1,5-diazabicyclo[4,3,0]non-5-eno (DBN), 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano (DABCO) y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undeceno-7 (DBU). Cuando estas bases adoptan forma líquida, se pueden usar como disolventes.

5 Estos compuestos básicos se pueden usar solos o en una mezcla de dos tipos o más.

Se puede usar un compuesto básico en una cantidad molar, que es generalmente de 0,5 a 10 veces, preferentemente, de 0,5 a 6 veces tan grande como el compuesto (2).

10 Si es necesario, la reacción mencionada anteriormente se puede realizar con la adición de un yoduro de metal alcalino que sirva como acelerador, tal como yoduro de potasio y yoduro de sodio.

15 La proporción del compuesto (2) con respecto al compuesto (3) usados en la fórmula de reacción 1 puede ser al menos aproximadamente 0,5 veces por mol, preferentemente, aproximadamente 0,5-5 veces por mol.

No se especifica particularmente la temperatura de la reacción, pudiéndose realizar en general en condiciones de frío o de calor y, preferentemente, a una temperatura de casi la temperatura ambiente a aproximadamente 150°C durante 1 a 30 horas.

20 El compuesto (2) que sirve como material inicial para un compuesto según la presente invención incluye un nuevo compuesto y se puede producir mediante diversos procedimientos, por ejemplo, un procedimiento representado por la siguiente fórmula de reacción 3,

25 El compuesto (3) que sirve como material inicial para un compuesto según la presente invención es un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

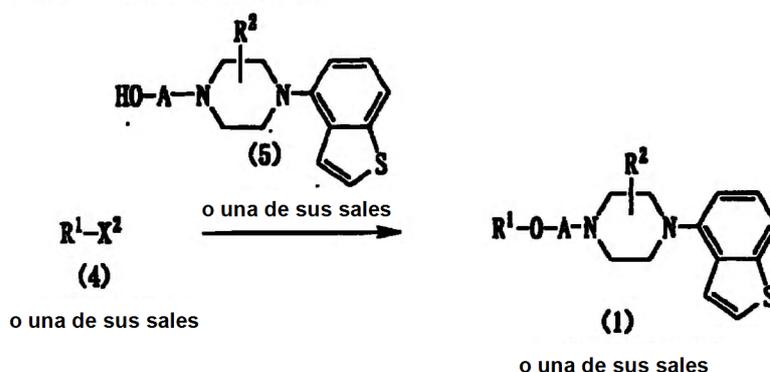
Se puede usar una sal de un compuesto (2) en lugar del compuesto (2) y una sal de un compuesto (3) en lugar del compuesto (3). Las sales de los compuestos (2) y (3) incluyen sales de adición de ácido. Estas sales de adición de ácido se pueden preparar haciendo reaccionar un ácido farmacéuticamente aceptable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

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

40

[Fórmula 5]

Fórmula de reacción 2



en la que R^1 , R^2 y A son como se definen anteriormente; y X^2 es un grupo hidroxilo, un átomo de halógeno o un grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno.

45 Los ejemplos del átomo de halógeno representado por X^2 y el grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno en relación con la fórmula general (4) son los mismos mencionados anteriormente.

El compuesto (1) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto (denominado en lo sucesivo compuesto (4)) representado por la fórmula general (4) y un compuesto (denominado en lo sucesivo compuesto (5)) representado por la fórmula general (5).

5

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

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

10

En general, esta reacción se realiza en un disolvente convencional que no pueda afectar negativamente a la reacción, tal como agua; un disolvente basado en alcohol, tal como metanol, etanol, isopropanol, *n*-butanol, trifluoroetanol y etilenglicol; un disolvente basado en cetona tal como acetona y metiletilcetona; un disolvente basado en éter, tal como tetrahidrofurano, dioxano, dietiléter y diglima; un disolvente basado en éster tal como metilacetato y etilacetato; un disolvente polar no protónico, tal como acetonitrilo, *N,N*-dimetilformamida y dimetilsulfóxido; un disolvente basado en hidrocarburo halogenado, tal como cloruro de metileno, cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, como disolvente usado en la presente memoria, cabe mencionar una mezcla en disolución de estos disolventes convencionales.

15

Como agente de condensación, cabe mencionar una mezcla de un azocarboxilato, tal como dietilazodicarboxilato y un compuesto de fosfina, tal como trifenilfosfina.

20

La cantidad del agente de condensación usado en la presente memoria es, en general, al menos equimolar, preferentemente, equimolar a dos veces la cantidad de un compuesto (4).

25

La proporción del compuesto (4) con respecto al compuesto (5) usada en la fórmula de reacción 2 puede ser, en general, al menos equimolar, preferentemente, aproximadamente 2 veces por mol.

30

No se especifica particularmente la temperatura de la reacción, pudiéndose realizar en general en condiciones de frío o de calor y, preferentemente, a una temperatura de 0°C a aproximadamente 150°C durante 1 a 10 horas.

El compuesto (4) que sirve como material inicial para un compuesto según la presente invención es un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

35

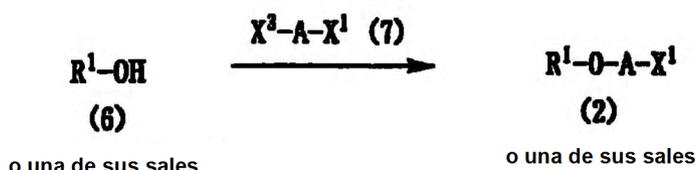
El compuesto (5) que sirve como material inicial para un compuesto según la presente invención incluye un nuevo compuesto y se puede producir mediante diversos procedimientos, por ejemplo, un procedimiento representado por la siguiente fórmula de reacción 4 ó 5,

40

Se puede usar una sal de un compuesto (4) en lugar del compuesto (4) y una sal de un compuesto (5) en lugar del compuesto (5). Como sal preferida de un compuesto (4), cabe mencionar la misma sal mostrada en un compuesto (2). Como sal preferida de un compuesto (5), cabe mencionar la misma sal mostrada en un compuesto (3).

[Fórmula 6]

Fórmula de reacción 3



en la que R^1 , X^1 y A son como se definen anteriormente; y X^3 es un átomo de halógeno o un grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno.

45

Los ejemplos del átomo de halógeno representado por X^3 y el grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno en relación con la fórmula general (7) son los mismos mencionados anteriormente.

50

El compuesto (2) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto (denominado en lo sucesivo compuesto (6)) representado por la fórmula general (6) y un compuesto (denominado en lo sucesivo compuesto (7)) representado por la fórmula general (7).

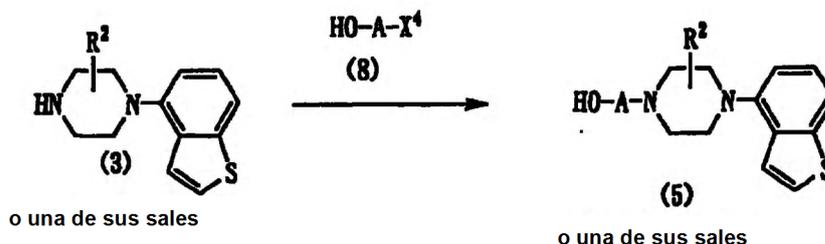
La reacción se puede realizar en condiciones similares a las de la fórmula de reacción 1,

Los compuestos (6) y (7) que sirven como materiales iniciales para un compuesto según la presente invención son compuestos conocidos o compuestos que se pueden producir fácilmente a partir de compuestos conocidos.

- 5 Se puede usar una sal de un compuesto (6) en lugar del compuesto (6). Como sal preferida de un compuesto (6), cabe mencionar la misma sal mostrada en un compuesto (2).

[Fórmula 7]

Fórmula de reacción 4



- 10 en la que R^2 y A son como se definen anteriormente; y X^4 es un átomo de halógeno o un grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno.

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

- 15 El compuesto (5) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto (3) y un compuesto (denominado en lo sucesivo compuesto (8)) representado por la fórmula general (8).

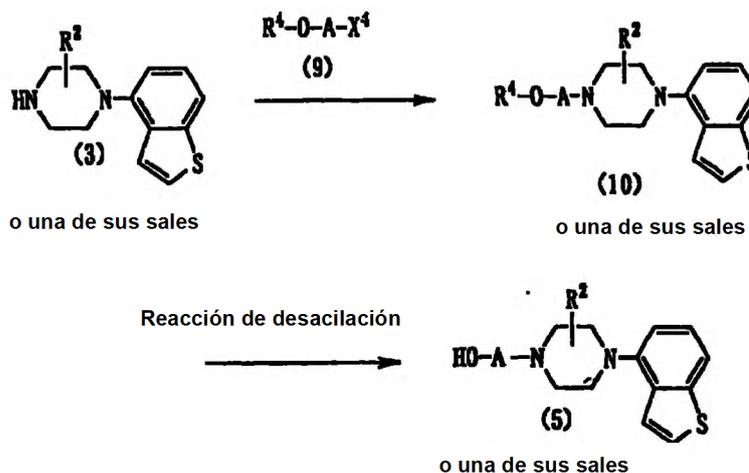
La reacción se puede realizar en condiciones similares a las de la fórmula de reacción 1,

- 20 El compuesto (8) que sirve como material inicial para un compuesto según la presente invención es un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

- 25 Se puede usar una sal de un compuesto (3) en lugar del compuesto (3). Como sal preferida de un compuesto (3), cabe mencionar sales como las anteriores.

[Fórmula 8]

Fórmula de reacción 5



en la que R^2 y A son como se definen anteriormente; R^4 es grupo alcanoilo inferior; y X^4 es un átomo de halógeno o un grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno.

Los ejemplos del grupo alcanoilo inferior representado por R^4 en las fórmulas generales (9) y (10) son iguales a los mencionados anteriormente.

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

10 El compuesto (denominado en lo sucesivo compuesto (10)) representado por la fórmula general (10) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto (3) y un compuesto (9).

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

15 El compuesto (9) que sirve como material inicial para un compuesto según la presente invención es un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

Se puede usar una sal de un compuesto (3) en lugar del compuesto (3). Como sal preferida de un compuesto (3), cabe mencionar sales como las anteriores.

20 Posteriormente, el compuesto (10) se somete a una reacción para retirar un grupo acilo, produciendo un compuesto (5).

25 Como procedimiento preferido de la reacción, cabe mencionar una reacción convencional tal como hidrólisis. La reacción de hidrólisis se puede realizar, preferentemente, en presencia de una base o de un ácido, incluyendo ácido de Lewis. Los ejemplos de base preferida incluyen sales inorgánicas, tales como un metal alcalino (p. ej., sodio y potasio), un carbonato ácido de metal alcalino (p. ej., carbonato ácido de litio, carbonato ácido de sodio y carbonato ácido de potasio), hidróxido de metal alcalino (p. ej., hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio e hidróxido de cesio), carbonato de metal alcalino (p. ej., carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio), un alcóxido inferior de metal alcalino (p. ej., metóxido de sodio y etóxido de sodio) e hidruros (p. ej., hidruro de sodio e hidruro de potasio); y bases orgánicas, tales como una trialkilamina (p. ej., trimetilamina, trietilamina, *N*-etil-diisopropilamina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilanelina, *N*-metilmorfolina, DBN, DABCO y DBU. Como ácido preferido, cabe mencionar ácidos orgánicos (tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido tricloroacético, ácido trifluoroacético) y ácidos inorgánicos (tales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, cloruro de hidrógeno y bromuro de hidrógeno). La reacción de eliminación usando un ácido de Lewis, tal como un ácido trihaloacético (p. ej., ácido tricloroacético y ácido trifluoroacético) se puede realizar preferentemente en presencia de un agente aprisionador de cationes (p. ej., anisol y fenol).

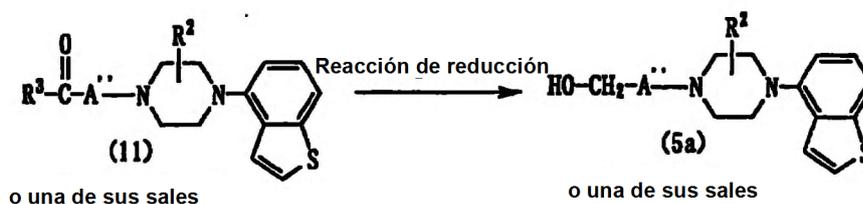
40 En general, esta reacción se realiza en un disolvente convencional que no pueda afectar negativamente a la reacción, tal como agua; un disolvente basado en alcohol, tal como metanol, etanol, isopropanol, *n*-butanol, trifluoroetanol y etilenglicol; un disolvente basado en cetona tal como acetona y metiletilcetona; un disolvente basado en éter, tal como tetrahidrofurano, dioxano, dietiléter y diglima; un disolvente basado en éster tal como metilacetato y etilacetato; un disolvente polar no protónico, tal como acetonitrilo, *N,N*-dimetilformamida y dimetilsulfóxido; un disolvente basado en hidrocarburo halogenado, tal como cloruro de metileno, cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, la reacción se puede realizar en una mezcla en disolución de estos disolventes convencionales. Entre ellos, se prefiere el etanol. No se especifica particularmente la temperatura de la reacción, pudiéndose realizar en general en condiciones de frío o de calor y, preferentemente, a una temperatura de casi la temperatura ambiente a casi el punto de ebullición del disolvente durante 0,5 a 75 horas.

50 Se puede usar una sal del compuesto (10) en lugar del compuesto (10). Como sal preferida de un compuesto (10), cabe mencionar la misma sal mostrada en un compuesto (3).

Además, mediante el procedimiento representado por la siguiente fórmula de reacción 6, se puede producir un compuesto (denominado en lo sucesivo compuesto (5a)) en el que A del compuesto (5) representa $-CH_2A^-$, en la que A" representa un grupo alquileo C1 a C5,

[Fórmula 9]

Fórmula de reacción 6



en la que R² es como se define anteriormente; y R³ es un grupo alcoxilo inferior. A'' representa un grupo alquileo de C1 a C5, El grupo alcoxilo inferior representado por R³ en la fórmula general (11) es igual al definido anteriormente.

5 Los ejemplos del grupo alquileo C1 a C5 representado por A'' en las fórmulas generales (11) y (5a) incluyen un grupo alquileo lineal o ramificado que tiene de 1 a 5 átomos de carbono, tales como metileno, etileno, metilmetileno, trimetileno, tetrametileno, 1-metiltrimetileno, 2-metiltrimetileno, 3-metiltetrametileno, pentametileno y 2,2-dimetiltrimetileno.

10 El compuesto (5a) se puede producir sometiendo un compuesto (denominado en lo sucesivo compuesto (11)) representado por la fórmula general (11) a una reacción de reducción.

15 La reacción se puede realizar mediante el procedimiento mostrado en el ejemplo de referencia 6 o un procedimiento similar. La reacción también se puede realizar mediante un procedimiento convencional usando un agente reductor.

Como agente reductor preferido, cabe mencionar un hidruro (tal como hidruro de litio y aluminio, borohidruro de sodio, borohidruro de litio, diborano y cianoborohidruro de sodio).

20 En general, esta reacción se realiza en un disolvente convencional que no pueda afectar negativamente a la reacción, tal como un disolvente basado en alcohol, tal como metanol, etanol, isopropanol, *n*-butanol, trifluoroetanol y etilenglicol; un disolvente basado en cetona tal como acetona y metiletilcetona; un disolvente basado en éter, tal como tetrahydrofurano, dioxano, dietiléter y diglima; un disolvente basado en éster tal como metilacetato y etilacetato; un disolvente polar no protónico, tal como acetonitrilo, *N,N*-dimetilformamida y dimetilsulfóxido; un disolvente basado en hidrocarburo halogenado, tal como cloruro de metileno, cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, la reacción se puede realizar en una mezcla en disolución de estos disolventes convencionales. No se especifica particularmente la temperatura de la reacción, pudiéndose realizar en general en condiciones de frío o de calor y, preferentemente, a una temperatura de casi la temperatura ambiente a casi el punto de ebullición del disolvente durante 0,5 a 75 horas.

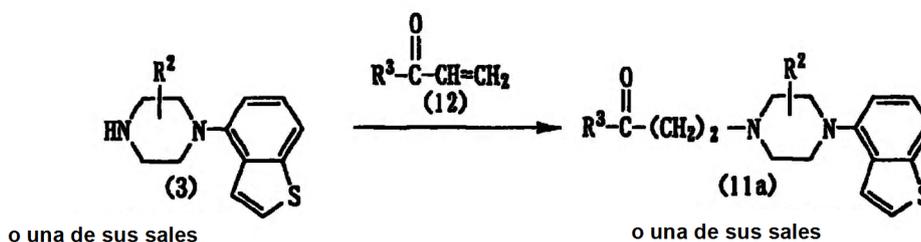
30 El compuesto (11) que sirve como material inicial para un compuesto según la presente invención es un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

35 Se puede usar una sal de un compuesto (11) en lugar del compuesto (11). Como sal preferida de un compuesto (11), cabe mencionar la misma sal mostrada en un compuesto (2).

Además, mediante un procedimiento representado por la siguiente fórmula de reacción 7, se puede producir un compuesto (denominado en lo sucesivo compuesto (11a)) en el que A'' del compuesto (11) representa "-(CH₂)₂-".

[Fórmula 10]

Fórmula de reacción 7



en la que R^2 y R^3 son como se definen anteriormente.

- 5 El compuesto (11a) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto (3) y un compuesto (denominado en lo sucesivo compuesto (12)) representado por la fórmula general (12).

La reacción se puede realizar mediante el procedimiento mostrado en el Ejemplo de referencia 5 o un procedimiento similar. En general, esta reacción se realiza en un disolvente convencional que no pueda afectar negativamente a la reacción, tal como agua; un disolvente basado en alcohol, tal como metanol, etanol, isopropanol, *n*-butanol, trifluoroetanol y etilenglicol; un disolvente basado en cetona tal como acetona y metiletilcetona; un disolvente basado en éter, tal como tetrahidrofurano, dioxano, dietiléter y diglima; un disolvente basado en éster tal como metilacetato y etilacetato; un disolvente polar no protónico, tal como acetonitrilo, *N,N*-dimetilformamida y dimetilsulfóxido; un disolvente basado en hidrocarburo halogenado, tal como cloruro de metileno y cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, la reacción se puede realizar en una mezcla en disolución de estos disolventes convencionales. No se especifica particularmente la temperatura de la reacción, pudiéndose realizar en general en condiciones de frío o de calor y, preferentemente, a una temperatura de casi la temperatura ambiente a casi el punto de ebullición del disolvente durante 0,5 a 75 horas.

- 20 El compuesto (12) que sirve como material inicial para un compuesto según la presente invención es un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

Se puede usar una sal de un compuesto (3) en lugar del compuesto (3) y una sal de un compuesto (12) en lugar del compuesto (12). Como sal preferida de un compuesto (3), cabe mencionar la misma sal mostrada anteriormente. Como sal preferida de un compuesto (12), cabe mencionar la misma sal mostrada en un compuesto (2).

El compuesto diana obtenido mediante cada una de las fórmulas de reacción anteriores puede formar una sal adecuada. Dichas sales adecuadas incluyen las sales preferidas del compuesto (1) ejemplificadas a continuación.

30 Las sales preferidas del compuesto (1) son sales farmacéuticamente aceptables, y los ejemplos incluyen sales metálicas, tales como sales de metales alcalinos (por ejemplo, sal sodio, sal potasio, etc.), sales de metales alcalinotérreos (por ejemplo, sal calcio, sal magnesio, etc.), sales de bases inorgánicas, tales como sal amonio, carbonatos de metales alcalinos (por ejemplo, carbonato de litio, carbonato de potasio, carbonato de sodio, carbonato de cesio, etc.), carbonatos ácidos de metales alcalinos (por ejemplo, carbonato ácido de litio, carbonato ácido de sodio, bicarbonato de potasio, etc.), hidróxidos de metales alcalinos (por ejemplo, hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio, etc.); por ejemplo, sales de bases orgánicas, tales como trialkilamina inferior (por ejemplo, trimetilamina, trietilamina, *N*-etil-diisopropilamina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilaminilina, *N*-alquil inferior-morfolina (por ejemplo, *N*-metilmorfolina), 1,5-diazabicyclo[4.3.0]noneno-5 (DBN), 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undeceno-7 (DBU), 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano (DABCO); sales de ácidos inorgánicos tales como clorhidrato, bromhidrato, yodhidrato, sulfato, nitrato, fosfato; sales de ácidos orgánicos, tales como formiato, acetato, propionato, oxalato, malonato, succinato, fumarato, maleato, lactato, malato, citrato, tartrato, carbonato, picrato, metanosulfonato, etanosulfonato, *p*-toluenosulfonato, glutamato.

Además, en cada una de las fórmulas generales, se incluyen los compuestos que están en la forma en la que se añadió el solvato (por ejemplo, hidrato, etanolato, etc.) a los compuestos iniciales y el compuesto diana mostrado en cada una de las fórmulas de reacción. Como solvato preferido, cabe mencionar hidrato.

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

El compuesto representado por la fórmula general (1) de la presente invención engloba de manera natural isómeros tales como isómero geométrico, estereoisómero y enantiómero.

5 Se puede usar un compuesto y una de sus sales representados por la fórmula general (1) en forma de la preparación farmacéutica general. La preparación se puede realizar usando un diluyente o un excipiente, tal como una carga, un agente de extensión, aglutinante, humectante, desintegrante, tensioactivo y lubricante. Como preparación farmacéutica, se pueden seleccionar diversas formas en función del propósito terapéutico. Sus formas más comunes incluyen comprimido, píldora, polvo, líquido, suspensión, emulsión, gránulo, cápsula, supositorio e inyección (líquida, suspensión).

15 En la formación de comprimidos, se puede usar una amplia variedad de tipos de vehículos convencionalmente conocidos en la técnica. Los ejemplos de vehículos que se pueden usar incluyen un excipiente, tal como lactosa, sacarosa, cloruro de sodio, glucosa, urea, almidón, carbonato de calcio, caolín, celulosa cristalina y silicato; un aglutinante, tal como agua, etanol, propanol, jarabe simple, solución de glucosa, solución de almidón, solución de gelatina, carboximetilcelulosa, laca, metilcelulosa, fosfato de potasio y polivinilpirrolidina; un desintegrante, tal como almidón seco, alginato de sodio, agar en polvo, laminarén en polvo, carbonato ácido de sodio, carbonato de calcio, éster de ácido graso de polioxietilensorbitán, laurilsulfato de sodio, monoglicérido de ácido esteárico, almidón y lactosa; un inhibidor de la desintegración, tal como sacarosa, estearina, mantequilla de cacao y aceite hidrogenado; un sorbefaciente, tal como base de amonio cuaternario y laurilsulfato de sodio; un humectante, tal como glicerina y almidón; un agente adsorbente, tal como almidón, lactosa, caolín, bentonita y sílice coloidal; y un lubricante, tal como talco refinado, estearato, ácido bórico en polvo y polietilenglicol. Además, si es necesario, se puede revestir un comprimido con una película general. Los ejemplos de dicho comprimido revestido incluyen un comprimido revestido de azúcar, comprimido encapsulado de gelatina, comprimido revestido con una cubierta entérica, comprimido revestido con una película o comprimido de doble capa y comprimido de múltiples capas.

20 En la formación de píldoras, se puede usar una amplia variedad de tipos de vehículos convencionalmente conocidos en la técnica. Los ejemplos de vehículos que se pueden usar incluyen un excipiente, tal como glucosa, lactosa, almidón, mantequilla de cacao, aceite vegetal endurecido, caolín y talco; un aglutinante, tal como una goma arábiga en polvo, tragacanto en polvo, gelatina y etanol; y un desintegrante, tal como laminarén y agar.

25 En la formación de supositorios, se puede usar una amplia variedad de tipos de vehículos convencionalmente conocidos en la técnica. Los ejemplos de vehículos que se pueden usar incluyen polietilenglicol, mantequilla de cacao, alcohol superior, ésteres de un alcohol superior, gelatina y glicérido semisintético.

35 Las cápsulas, habitualmente, se preparan mezclando un ingrediente activo con un vehículo según lo ilustrado anteriormente conforme a un procedimiento convencional y rellenando una cápsula de gelatina dura o una cápsula blanda con la mezcla.

40 En la preparación de inyecciones, el agente líquido, la emulsión y la suspensión están preferentemente esterilizados y son isotónicos con la sangre. Cuando se preparan en una inyección, se puede usar cualquier diluyente siempre y cuando sea un diluyente convencionalmente usado en la técnica. Los ejemplos de diluyente que se pueden usar incluyen agua, alcohol etílico, macrogol, propilenglicol, alcohol isostearílico etoxilado, alcohol isostearílico polioxilado, ésteres de ácidos grasos de polioxietilensorbitán.

45 Cabe señalar que, en este caso, una preparación farmacéutica puede contener una sal, glucosa o glicerina en una cantidad suficiente para preparar una solución isotónica. Alternativamente, se puede añadir un solubilizador auxiliar general, tampón, agente calmante. Además, si es necesario, a la preparación farmacéutica, se puede añadir un pigmento, conservante, aromatizante, sabor, agente edulcorante y otras sustancias medicinales.

50 La cantidad de un compuesto de la fórmula general (1) y de una de sus sales contenida en una preparación farmacéutica según la presente invención no está particularmente limitada y se selecciona apropiadamente de un amplio intervalo. Sin embargo, generalmente, es del aproximadamente 1 al 70% en peso, preferentemente, del aproximadamente 1 al 30% en peso de la composición de la preparación.

55 No se especifica ningún procedimiento de administración de una preparación farmacéutica según la presente invención, pudiendo administrarse mediante un procedimiento según la forma de preparación, la edad, el sexo y otras condiciones del paciente, y de la gravedad de la enfermedad. Por ejemplo, en el caso de comprimidos, píldoras, agentes líquidos, suspensiones, emulsiones, gránulos y cápsulas, la administración es por vía oral. Además, en el caso de inyecciones, se administran intravenosamente solas o mezcladas con un reforzador general, tal como glucosa y aminoácidos y, si es necesario, se administran únicamente intramuscular, intracutánea, subcutánea o intraperitonealmente. En el caso de los supositorios, se administra en el recto.

65 La dosis de la preparación farmacéutica según la presente invención se selecciona apropiadamente en función de la pauta de dosificación (indicaciones de uso), edad, sexo y otras condiciones del paciente, y de la gravedad de la enfermedad, etc. Sin embargo, la dosis del ingrediente activo se puede fijar en general y preferentemente en de

aproximadamente 0,1 a 10 mg/peso (kg) al día. Es deseable que el ingrediente activo esté contenido en el intervalo de aproximadamente 1 a 200 mg por unidad de dosis de preparación.

[Ventajas de la invención]

5 Un compuesto según la presente invención tiene un efecto agonista parcial hacia el receptor D₂, efecto antagonista contra el receptor 5-HT_{2A} y un efecto inhibidor de la absorción de la serotonina.

10 El efecto agonista parcial hacia el receptor D₂ se refiere a una acción que desacelera la neurotransmisión dopaminérgica (DA) cuando se aumenta, mientras que acelera la neurotransmisión dopaminérgica (DA) cuando se reduce. De esta manera, el agonista parcial del receptor D₂ actúa como un estabilizador del sistema de la dopamina, que estabiliza la neurotransmisión DA en un estado normal. En virtud de este efecto, el compuesto de la presente invención produce un efecto de mejora clínica excelente sobre los síntomas causados por la neurotransmisión DA anómala (aceleración o desaceleración) sin generar efectos secundarios. Como efecto de mejora clínica excelente, cabe mencionar los efectos de mejora de los síntomas positivos y negativos, del deterioro cognitivo y del síntoma depresivo (véase Michio Toru, *Psychiatry*, Vol. 46, páginas 855-864 (2004); Tetsuro Kikuchi y Hirose Takeshi, *Brain Science*, vol. 25, páginas 579-583 (2004); y Harrison, T. S. y Perry, C.M.: *Drugs* 64: 1715-1736, 2004).

20 El efecto antagonista hacia el receptor 5-HT_{2A} se refiere a una acción que reduce los efectos secundarios extrapiramidales y desarrolla una respuesta clínica superior y, más específicamente, funciona eficazmente en la mejora de los síntomas negativos, del deterioro cognitivo, del síntoma de depresión y del insomnio (véase Jun Ishigooka y Ken Inada: *Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology*, vol. 4, páginas 1653-1664 (2001); Mitsukuni Murasaki: *Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology*, vol. 1, páginas 5-22 (1998), y Meltzer, H. Y. et al.: *Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry* 27:1159-1172, 2003).

25 El efecto inhibidor de la absorción de la serotonina es, por ejemplo, eficaz en la mejora de síntomas depresivos (véase Mitsukuni Murasaki: *Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology*, vol. 1, páginas 5-22 (1998)).

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

Además, algunos de los compuestos según la presente invención tienen un efecto antagonista hacia el receptor α_1 , además de los efectos anteriormente mencionados. El antagonista del receptor α_1 es eficaz en la mejora de los síntomas positivos de la esquizofrenia (véase Svensson, T. H.: *Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry* 27: 1145-1158, 2003).

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

40 Por consiguiente, el compuesto de la presente invención es sumamente eficaz en la mejora de diversos tipos de trastornos del sistema nervioso central tales como esquizofrenia; esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; trastorno emocional; trastorno psicótico; trastorno del estado de ánimo; trastorno bipolar (por ejemplo, trastorno bipolar de tipo I y trastorno bipolar de tipo II); depresión, depresión endógena, depresión principal; melancolía y depresión refractaria; trastorno distímico; trastorno ciclotímico; trastorno de ansiedad (por ejemplo, ataque de pánico, trastorno de pánico, agorafobia, fobia social, trastorno obsesivo-compulsivo, trastorno de estrés post-traumático, trastorno de ansiedad generalizada y trastorno de estrés agudo); trastorno somatoforme (por ejemplo, histeria, trastorno de somatización, trastorno de conversión, trastorno de dolor e hipocondriasis); trastorno facticio; trastorno disociativo; trastorno sexual (por ejemplo, disfunción sexual, trastorno del deseo sexual, trastorno de excitación sexual y disfunción eréctil); trastorno de la alimentación (por ejemplo, anorexia nerviosa y bulimia nerviosa); trastorno del sueño; trastorno de ajuste; trastorno relacionado con sustancias (por ejemplo, alcoholismo, intoxicación por alcohol, toxicomanía; intoxicación por estimulantes y narcotismo); anhedonia (por ejemplo, anhedonia iatrogénica, anhedonia por causa psíquica o mental, anhedonia asociada con depresión y anhedonia asociada con esquizofrenia); delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo asociado con la enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y otras enfermedades neurodegenerativas; deterioro cognitivo causado por la enfermedad de Alzheimer; enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; vómitos; mareo por movimiento; obesidad; migraña; dolor; retraso mental; trastorno de autismo (autismo); trastorno de Tourette; trastorno de tic; trastorno de déficit de atención/hiperactividad; trastorno de la conducta; y síndrome de Down.

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

Los compuestos iniciales usados en cada una de las fórmulas de reacción anteriores pueden ser una sal adecuada o el compuesto diana obtenido mediante cada reacción puede formar una sal adecuada. Dichas sales adecuadas incluyen las sales preferidas del compuesto (1) ejemplificadas a continuación.

Las sales preferidas del compuesto (1) son sales farmacéuticamente aceptables, y los ejemplos incluyen sales metálicas, tales como sales de metales alcalinos (por ejemplo, sal sodio, sal potasio, etc.), sales de metales alcalinotérreos (por ejemplo, sal calcio, sal magnesio, etc.), sales de bases inorgánicas, tales como sal amonio, carbonatos de metales alcalinos (por ejemplo, carbonato de litio, carbonato de potasio, carbonato de sodio, carbonato de cesio, etc.), carbonatos ácidos de metales alcalinos (por ejemplo, carbonato ácido de litio, carbonato ácido de sodio, bicarbonato de potasio, etc.), hidróxidos de metales alcalinos (por ejemplo, hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio, etc.); por ejemplo, sales de bases orgánicas, tales como trietilamina inferior (por ejemplo, trimetilamina, trietilamina, *N*-etil-diisopropilamina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilalanilina, *N*-alquil inferior-morfolina (por ejemplo, *N*-metilmorfolina), 1,5-diazabicyclo[4.3.0]noneno-5 (DBN), 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undeceno-7 (DBU), 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano (DABCO); sales de ácidos inorgánicos, tales como clorhidrato, bromhidrato, yodhidrato, sulfato, nitrato, fosfato; sales de ácidos orgánicos, tales como formiato, acetato, propionato, oxalato, malonato, succinato, fumarato, maleato, lactato, malato, citrato, tartrato, carbonato, picrato, metanosulfonato, etanosulfonato, *p*-toluenosulfonato, glutamato.

Además, en cada una de las fórmulas generales, se incluyen los compuestos en la forma en la que se añadió el solvato (por ejemplo, hidrato, etanolato, etc.) a los compuestos iniciales y el compuesto diana mostrado en cada una de las fórmulas de reacción. Como solvato preferido, cabe mencionar hidrato.

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

El compuesto representado por la fórmula general (1) de la presente invención engloba de manera natural isómeros tales como isómero geométrico, estereoisómero y enantiómero.

El compuesto de la fórmula general (1) y una de sus sales se pueden usar en una forma común de preparación farmacéutica. La preparación farmacéutica se realiza usando un diluyente o un excipiente habitualmente usados, tales como una carga, un agente de extensión, aglutinante, humectante, agente desintegrante, tensioactivo y lubricante. En cuanto a esta preparación farmacéutica, se pueden seleccionar diversas formas en función del objetivo del tratamiento, y los ejemplos más comunes incluyen comprimido, píldora, polvo, solución, suspensión, emulsión, gránulo, cápsula, supositorio e inyección (solución, suspensión).

Para formar comprimidos, se pueden usar ampliamente diversos materiales ampliamente conocidos como vehículos en la técnica. Como ejemplos, se pueden usar excipientes tales como lactosa, sacarosa, cloruro de sodio, glucosa, urea, almidón, carbonato de calcio, caolín, celulosa cristalina, silicato; aglutinantes tales como agua, etanol, propanol, jarabe simple, solución de glucosa, almidón líquido, solución de gelatina, carboximetilcelulosa, laca, metilcelulosa, fosfato de potasio, polivinilpirrolidina; agentes desintegrantes tales como almidón seco, alginato de sodio, agar en polvo, laminarán en polvo, carbonato ácido de sodio, carbonato de calcio, éster de ácido graso de polioxietilensorbitán, laurilsulfato de sodio, monoglicérido de ácido esteárico, almidón, lactosa; agentes inhibidores de la desintegración tales como sacarosa, estearina, mantequilla de cacao, aceite hidrogenado; sorbefacientes tales como base de amonio cuaternario, laurilsulfato de sodio; humectantes tales como glicerina, almidón; agentes absorbentes tales como almidón, lactosa, caolín, bentonita, sílice coloidal; lubricantes tales como talco refinado, estearato, borato en polvo, polietilenglicol. Además, el comprimido puede ser un comprimido con una cubierta convencional según sea necesario, por ejemplo, comprimido revestido de azúcar, comprimido encapsulado de gelatina, comprimido revestido con una cubierta entérica, comprimido revestido con una película o comprimido de doble capa y comprimido de múltiples capas.

Para la formación de píldoras, se pueden usar ampliamente diversos materiales conocidos como vehículos en la técnica. Como ejemplos, se pueden usar excipientes tales como glucosa, lactosa, almidón, mantequilla de cacao, aceite vegetal hidrogenado, caolín, talco; aglutinantes tales como goma arábiga en polvo, tragacanto en polvo, gelatina, etanol; agentes desintegrantes tales como laminarán, agar.

Para la formación de supositorios, se pueden usar ampliamente diversos materiales conocidos como vehículos en la técnica. Sus ejemplos incluyen polietilenglicol, mantequilla de cacao, alcohol superior, ésteres de alcohol superior, gelatina, glicérido semisintético.

Las cápsulas se preparan habitualmente según un procedimiento convencional mezclando los ingredientes activos con diversos vehículos ejemplificados anteriormente y rellenando con ellos cápsulas de gelatina duras, cápsulas blandas o similares.

Cuando se preparan como inyecciones líquidas, es preferible que la solución, emulsión y suspensión estén esterilizadas y sean isotónicas en la sangre, y para formarlas de estos modos, se puede usar cualquier diluyente convencionalmente usado en la técnica, por ejemplo, agua, alcohol etílico, macrogol, propilenglicol, alcohol isostearílico etoxilado, alcohol isostearílico polioxilado, éster de ácido graso de polioxietilensorbitán, etc.

La preparación farmacéutica puede contener una sal común, glucosa o glicerina en una cantidad suficiente para preparar una solución isotónica en este caso, pudiéndose añadir también un solubilizador, tampón, agente calmante convencionales. Además, si es necesario, puede haber un pigmento, conservante, aromatizante, sabor, edulcorante y otras sustancias farmacéuticas.

La cantidad de un compuesto de la fórmula general (1) y de una de sus sales contenida en una preparación farmacéutica de la presente invención no está particularmente limitada, pero, generalmente, lo adecuado es que sea del aproximadamente 1 al 70% en peso de la composición de la preparación, y preferentemente, del aproximadamente 1% al 30% en peso.

No se especifica ningún procedimiento de administración en particular de la preparación farmacéutica de la presente invención, pudiendo administrarse mediante un procedimiento según la forma de preparación específica, la edad, el sexo y otras condiciones del paciente, y de la gravedad de la enfermedad, etc. Por ejemplo, en el caso de comprimidos, píldoras, soluciones, suspensiones, emulsiones, gránulos y cápsulas, la administración es por vía oral. En el caso de inyecciones, se administran intravenosamente solas o mezcladas con un líquido reforzador convencional, tal como glucosa y aminoácidos y, si es necesario, se puede administrar la preparación sola intramuscular, intracutánea, subcutánea o intraperitonealmente. En el caso de los supositorios, se administran en el recto.

La dosis aplicada de la preparación farmacéutica de la presente invención se selecciona apropiadamente según la pauta de dosificación, edad, sexo y otras condiciones del paciente, gravedad de la enfermedad, etc., peso lo adecuado es administrar una cantidad de ingrediente activo, habitualmente, de aproximadamente 0,1 a 10 mg/kg de peso corporal al día. Además, es deseable que el ingrediente activo esté contenido en la preparación de una forma de dosificación unitaria en el intervalo de aproximadamente 1 a 200 mg.

El compuesto de la presente invención tiene un efecto agonista parcial hacia el receptor D₂, efecto antagonista contra el receptor 5-HT_{2A} y un efecto inhibidor de la absorción de la serotonina (o efecto inhibidor de la reabsorción de la serotonina).

El efecto agonista parcial hacia el receptor D₂ inhibe la neurotransmisión dopaminérgica (DA) cuando se aumenta y acelera la neurotransmisión DA cuando se reduce, y por tanto, tiene una función de estabilización de la neurotransmisión DA a su estado normal (estabilizador del sistema de dopamina). Según esta función, se desarrolla sin producir efectos secundarios un excelente efecto de mejora clínica de las afecciones basadas en la neurotransmisión DA anómala (aumento y descenso), por ejemplo, efecto de mejora de los síntomas positivos y negativos; efecto de mejora del deterioro cognitivo, efecto de mejora del síntoma depresivo, etc. (Véase Michio Toru: *Seishin-Igaku (Psychiatry)*, Vol. 46, pp. 855-864 (2004), Tetsuro Kikuchi y Tsuyoshi Hirose: *Nou-no-Kagaku (Brain Science)*, Vol. 25, pp. 579-583 (2003) y Harrison, T.S. y Perry, C.M.: *Drugs* 64: 1715-1736, 2004).

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

El efecto inhibidor de la absorción de la serotonina (o efecto inhibidor de la reabsorción de la serotonina) es eficaz, por ejemplo, en la mejora de síntomas depresivos (véase Mitsukuni Murasaki: *Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology*, vol. 1, páginas 5-22 (1998)).

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

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

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

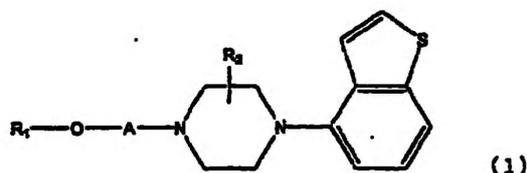
Por consiguiente, los compuestos de la presente invención son sumamente eficaces en el tratamiento o la prevención de trastornos del sistema nervioso central incluidos en el grupo que consiste en esquizofrenia; esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; trastorno emocional; trastorno psicótico; trastorno del estado de ánimo; trastorno bipolar (por ejemplo, trastorno bipolar de tipo I y trastorno bipolar de tipo II); depresión; depresión endógena; depresión principal; melancolía y depresión refractaria; trastorno distímico; trastorno ciclotímico; trastorno de ansiedad (por

ejemplo, ataque de pánico, trastorno de pánico, agorafobia, fobia social, trastorno obsesivo-compulsivo, trastorno de estrés post-traumático, trastorno de ansiedad generalizada, trastorno de estrés agudo, etc.); trastorno somatoforme (por ejemplo, histeria, trastorno de somatización, trastorno de conversión, trastorno de dolor, hipocondriasis, etc.); trastorno facticio; trastorno disociativo; trastorno sexual (por ejemplo, disfunción sexual, trastorno del deseo sexual, trastorno de excitación sexual, disfunción eréctil, etc.); trastorno de la alimentación (por ejemplo, anorexia nerviosa, bulimia nerviosa, etc.); trastorno del sueño; trastorno de ajuste; trastorno relacionado con sustancias (por ejemplo, alcoholismo, intoxicación por alcohol, toxicomanía; intoxicación por estimulantes, narcotismo, etc.); anhedonia (por ejemplo, anhedonia iatrogénica, anhedonia por causa psíquica o mental, anhedonia asociada con depresión, anhedonia asociada con esquizofrenia, etc.); delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo asociado con la enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y otras enfermedades neurodegenerativas; deterioro cognitivo causado por la enfermedad de Alzheimer; enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; vómitos; mareo por movimiento; obesidad; migraña; dolor; retraso mental; trastorno de autismo (autismo); trastorno de Tourette; trastorno de tic; trastorno de déficit de atención/hiperactividad; trastorno de la conducta; y síndrome de Down.

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

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

[Fórmula 1]



en la que R^2 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior; A representa un grupo alquileo inferior o un grupo alquenilo inferior (preferentemente, un grupo alquileo inferior); y R^1 representa a un grupo heterocíclico seleccionado entre:

un grupo heterocíclico fusionado a benceno que tiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre, y que se selecciona del grupo que consiste en (1) un grupo tetrahidroquinoxalinilo, (2) un grupo tetrahidroquinazolinilo, (3) un grupo dihidroquinazolinilo, (4) un grupo indolinilo, (5) un grupo indolilo, (6) un grupo isoindolinilo, (7) un grupo bencimidazolilo, (8) un grupo dihidrobencimidazolilo, (9) un grupo tetrahidrobenzazepinilo, (10) un grupo tetrahidrobenzodiazepinilo, (11) un grupo hexahidrobenzazocinilo, (12) un grupo dihidrobenzoxazinilo, (13) un grupo dihidrobenzoxazolilo, (14) un grupo bencisoxazolilo, (15) un grupo benzoxadiazolilo, (16) un grupo tetrahidrobenzoxazepinilo, (17) un grupo dihidrobenzotiazinilo, (18) un grupo benzotiazolilo, (19) un grupo benzoxatolilo, (20) un grupo cromenilo, (21) un grupo dihidrobenzofurilo, (22) un grupo carbazolilo, (23) un grupo dibenzofurilo y (24) un grupo quinoxalinilo, en el que puede estar presente, como sustituyente, un grupo heterocíclico representado por R^1 , 1 a 5 (más preferentemente, de 1 a 3) grupos seleccionados del grupo que consiste en los siguientes grupos (1) a (66):

- (1) un grupo alquilo inferior,
- (2) un grupo alquenilo inferior,
- (3) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- (4) un grupo alcoxilo inferior,
- (5) un grupo fenoxilo,
- (6) un grupo alquiltio inferior,
- (7) un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno,
- (8) un grupo hidroxilo,
- (9) un grupo fenilalcoxilo inferior,
- (10) un grupo hidroxialquilo inferior,
- (11) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior,
- (12) un átomo de halógeno,
- (13) un grupo ciano,
- (14) un grupo fenilarilo,
- (15) un grupo nitro,
- (16) un grupo amino,
- (17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior; un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alquilcarbamoilo inferior, un grupo aminoalcanoilo inferior, un grupo alcaniloamin inferior-alcanoilo

- inferior y un grupo alcocarbonilamin inferior-alcanoilo inferior como sustituyente/s (más preferentemente, un grupo *N*-alquilamino inferior, grupo *N,N*-dialquilamino inferior, grupo *N*-alcanoilamino inferior, grupo *N*-alcocarbonilamino inferior, grupo *N*-alquilsulfonilamino inferior, grupo *N*-alquil inferior-*N*-alcanoilamino inferior, grupo *N*-alquil inferior-*N*-alcocarbonilamino inferior, grupo *N*-[carbamoil]amino, grupo *N*-[*N*-alquilcarbamoil inferior]amino, grupo *N*-[*N,N*-dialquilcarbamoil inferior]amino, grupo *N*-[aminoalcanoil inferior]amino, grupo *N*-[[*N*-alcanoilaminamino inferior]alcanoil inferior]amino o grupo *N*-[[*N*-alcocarbonilamin inferior]alcanoil inferior]amino),
- (18) un grupo alcanoilo inferior,
- (19) un grupo fenilsulfonilo que puede tener un grupo alquilo inferior en el grupo fenilo (más preferentemente, un grupo alquilfenilsulfonilo inferior),
- (20) un grupo carboxilo,
- (21) un grupo alcocarbonilo inferior,
- (22) un grupo carboxialquilo inferior,
- (23) un grupo alcocarbonil inferior-alquilo inferior,
- (24) un grupo alcanoilamin inferior-alcanoilo inferior,
- (25) un grupo carboxialquenilo inferior,
- (26) un grupo alcocarbonil inferior-alquenilo inferior,
- (27) un grupo carbamoil-alquenilo inferior que puede tener como sustituyente/s de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con de 1 a 3 átomos de halógeno (más preferentemente, un grupo carbamoil-alquenilo inferior, un grupo *N*-alquilcarbamoil inferior-alquenilo inferior, grupo *N,N*-dialquilcarbamoil inferior-alquenil inferior o grupo *N*-[alquil inferior sustituido con de 1 a 3 átomos de halógeno]carbamoil-alquenilo inferior),
- (28) un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en los siguientes grupos (i) a (lxxviii) como sustituyente/s:
- (i) un grupo alquilo inferior,
- (ii) un grupo alcóxilo inferior,
- (iii) a un grupo hidroxialquilo inferior,
- (iv) un grupo alcóxi inferior-alquilo inferior,
- (v) un grupo fenoxialquilo inferior,
- (vi) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- (vii) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo benzilo y un grupo carbamoilo (más preferentemente, un grupo *N,N*-dialquilamin inferior-alquilo inferior, grupo *N*-alcanoilamin inferior-alquilo inferior, grupo *N*-alquil inferior-*N*-alcanoilamin inferior-alquilo inferior, grupo *N*-alquil inferior-*N*-benzoiilamin inferior-alquilo inferior o grupo *N*-carbamoilamin inferior-alquilo inferior),
- (viii) un grupo cicloalquilo C3-C8 que puede tener de 1 a 3 grupos (preferentemente, de 1 a 2 grupos, y más preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo alcocarbonilo inferior y un grupo fenilalcóxilo inferior como sustituyente,
- (ix) un grupo alquilo inferior sustituido con cicloalquilo C3-C8,
- (x) un grupo alquenilo inferior,
- (xi) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos carbamoilo que pueden tener de 1 a 2 grupos (preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo que puede tener un solo grupo alquilo inferior y un grupo fenilo que puede tener un solo grupo alcóxilo inferior como sustituyente/s (más preferentemente, un grupo carbamoil-alquilo inferior, un grupo dicarbamoil-alquilo inferior, grupo *N*-alquilcarbamoil inferior-alquilo inferior, grupo *N,N*-dialquilcarbamoil inferior-alquilo inferior, grupo *N*-[alquilfenil inferior]carbamoil-alquilo inferior o grupo *N*-[alcóxi fenil inferior]carbamoil-alquilo inferior),
- (xii) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos alcocarbonilo inferior,
- (xiii) un grupo furilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente/s en el grupo furilo),
- (xiv) un grupo tetrahidrofurilalquilo inferior,
- (xv) un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior,
- (xvi) un grupo tetrahidropiranilalquilo inferior,
- (xvii) un grupo pirrolilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente/s en el grupo pirrolilo),
- (xviii) un grupo dihidropirazolilalquilo inferior que puede tener un solo grupo oxo,
- (xix) un grupo pirazolilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como sustituyente/s en el grupo pirazolilo),
- (xx) un grupo imidazolilalquilo inferior,
- (xxi) un grupo piridilalquilo inferior,
- (xxii) un grupo pirazinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferentemente 1) grupos alquilo inferior como sustituyente en el grupo pirazinilo),
- (xxiii) un grupo pirrolidinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior como sustituyente/s en el grupo pirrolidinilo),
- (xxiv) un grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos (preferentemente, 1 grupo)

- seleccionados del grupo que consiste en un grupo benzoílo y un grupo alcanóilo inferior como sustituyente/s en el grupo piperidilo),
- (xxv) un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos alquilo inferior como sustituyente/s en el grupo piperazinilo),
- 5 (xxvi) un grupo morfolinilalquilo inferior,
- (xxvii) un grupo tienilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos alquilo como sustituyente/s en el grupo tienilo),
- (xxviii) un grupo tiazolilalquilo inferior,
- (xxix) un grupo dihidrobenzofurilalquilo inferior,
- 10 (xxx) un grupo benzopiraniilalquilo inferior (que puede tener un solo grupo oxo como sustituyente en el grupo benzopiraniilo),
- (xxxi) un grupo bencimidazolilalquilo inferior,
- (xxxii) un grupo indolilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (preferentemente 1) grupos alcoxicarbonilo inferior en el grupo alquilo inferior),
- 15 (xxxiii) un grupo imidazolilalquilo inferior que tiene de 1 a 3 sustituyentes (preferentemente, 1 sustituyente) seleccionados del grupo que consiste en un grupo carbamoílo y un grupo alcoxicarbonilo inferior en el grupo alquilo inferior,
- (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior y un grupo alquiltio inferior-alquilo inferior como sustituyente/s,
- 20 (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo benzoílo como sustituyente,
- (xxxvi) un grupo piperidinilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo benzoílo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un átomo de halógeno en el grupo fenilo,
- 25 (xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (xxxviii) un grupo hexahidroazepinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- 30 (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo y un grupo furilo como sustituyente,
- (xl) un grupo tiazolilo,
- (xli) un grupo tiadiazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos alquilo inferior,
- (xlii) un grupo isoxazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) grupos alquilo inferior,
- 35 (xliii) un grupo indazolilo,
- (xliv) un grupo indolilo,
- (xlv) un grupo tetrahidrobenzotiazolilo,
- (xlvi) un grupo tetrahidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior, un átomo de halógeno y un grupo oxo como sustituyente,
- 40 (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos alquilo inferior,
- (xlviii) un grupo benzodioxolilalquilo inferior,
- (xlix) un grupo fenilo o grupo naftilo que puede tener de 1 a 3 grupos como sustituyente/s seleccionados del grupo que consiste en:
- 45 un átomo de halógeno; un grupo alquilo inferior; un grupo alcoxilo inferior; un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno; un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno; un grupo alquenilo inferior; un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo sulfamoílo; un grupo alquiltio inferior; un grupo alcanóilo inferior; un grupo alcoxicarbonilo inferior; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo inferior; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo feniloxilo; un grupo fenilalcoxilo inferior; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxialquilo inferior; un grupo carbamoílo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo fenilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, de 1 a 2) grupos alquilo inferior; un grupo dihidrofurilo que puede tener un solo grupo oxo; un grupo tiazolidinilalquilo inferior que puede tener dos grupos oxo; un grupo imidazolilalcanoílo inferior y un grupo piperidinilcarbonilo,
- 50 (l) un grupo cianoalquilo inferior,
- (li) un grupo dihidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo oxo,
- 60 (lii) un grupo alquilamino inferior sustituido con halógeno,
- (liii) un grupo alquiltio inferior-alquilo inferior,
- (liv) un grupo amidino que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior,
- (lv) un grupo amidinoalquilo inferior,
- (lvi) un grupo alqueniloxialquilo inferior,
- 65 (lvii) un grupo fenilamino que puede tener de 1 a 3 sustituyentes (más preferentemente, 1 sustituyente) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior, un grupo

- alquilo inferior sustituido con halógeno y un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno en el grupo fenilo,
- (lviii) un grupo fenilalquenilo inferior,
- 5 (lix) un grupo piridilamino que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, de 1 a 2) grupos alquilo inferior (más preferentemente, un grupo *N*-alquil inferior-*N*-[alquilpiridil inferior]amino),
- (lx) un grupo fenilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferentemente, de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxilo inferior, un grupo carbamoilo y un grupo alcoxycarbonilo inferior como sustituyente en el grupo fenilo y/o el grupo alquilo inferior),
- 10 (lxi) un grupo alquinilo inferior,
- (lxii) un grupo feniloxialquilo inferior (que puede tener como sustituyente/s en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos (preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo inferior, un grupo *N*-alcoxi inferior-*N*-alquilcarbamoilo inferior y un grupo oxopirrolidinilo),
- 15 (lxiii) un grupo isoxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (lxiv) un grupo dihidroindenilo,
- (lxv) un grupo fenilalcoxi inferior-alquilo inferior,
- (lxvi) un grupo tetrahidropiranilo,
- 20 (lxvii) un grupo azetidínilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior y un grupo benzoilo,
- (lxviii) un grupo azetidínialquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior y un grupo benzoilo,
- (lxix) un grupo tetrazolilo,
- 25 (lxx) un grupo indolinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (lxxi) un grupo triazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferentemente, de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilio inferior,
- (lxxii) un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, 1) grupos carbamoilo,
- (lxxiii) un grupo oxazolilo que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, 1) grupos alquilo inferior,
- 30 (lxxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, 1) grupos alquilo inferior,
- (lxxv) un grupo bencimidazolilo,
- (lxxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, 1) grupos alcoxycarbonilo inferior, y
- (lxxviii) un grupo oxazolilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, de 1 a 2) grupos alquilo inferior,
- 35
- (29) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo fenilo; un grupo fenilalquilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo aminoalquilo sustituido (que puede tener de 1 a 2 (más preferentemente, 2) grupos alquilo inferior como sustituyente/s en el grupo amino) en el grupo amino,
- 40 (30) un grupo alquilo inferior sustituido con un solo grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- (31) un grupo tiocarbamoilo que puede tener de 1 a 2 (más preferentemente, 1) grupo alquilo inferior,
- 45 (32) un grupo sulfamoilo,
- (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo (más preferentemente, un grupo oxazolidinilo sustituido con un solo grupo oxo),
- (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior,
- 50 (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (36) un grupo imidazolilo,
- (37) un grupo triazolilo,
- (38) un grupo isoxazolilo,
- 55 (39) un grupo piperidinilo que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, de 1 a 2, e incluso más preferentemente 1) sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alquilfenilsulfonilo inferior, un grupo oxo, un grupo hidroxilo y grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior y grupo alcanóilamin inferior-alcanóilo inferior (más preferentemente, un grupo piperidinilo que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, de 1 a 2, e incluso más preferentemente 1) sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alquilfenilsulfonilo inferior, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo *N*-alquilamino inferior, un grupo *N,N*-dialquilamino inferior, un grupo *N*-alcanóilamino inferior, un grupo *N*-alquil inferior-*N*-alcoxycarbonilamino inferior, un grupo *N*-alquil inferior-*N*-alcanóilamino inferior y un grupo *N*-alcanóilamin inferior-alcanóilamino inferior),
- 60
- 65 (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, de 1 a 2) sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, a un grupo hidroxialquilo

inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo carboxialquilo inferior, un grupo alquilcarbamoíl inferior-alquilo inferior, un grupo carbamoíl, un grupo alcoxilo inferior, un grupo carboxilo, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior y un grupo benzoílo), un grupo piperidinilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos (más preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior y un grupo benzoílo), un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 (más preferentemente, de 1 a 2) grupos alquilo inferior como sustituyente), un grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decilo, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que puede estar presente un solo grupo alquilo inferior como sustituyente), piridilo, grupo piridiloxilo, grupo piridilalcoxilo inferior, grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un solo grupo oxo), grupo benzodioxolilo, grupo fenilalcoxilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferentemente, de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior y un grupo alcoxilo inferior sustituido con halógeno en el grupo fenilo), grupo fenilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos (preferentemente, de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxilo inferior y un grupo hidroxilo), un grupo feniloxilo (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos (preferentemente, de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), un grupo fenilalquilo inferior (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos (más preferentemente, de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno) y un grupo benzoílo (que puede tener, en el grupo fenilo, de 1 a 3 grupos (más preferentemente, de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxilo inferior, (41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, 1) grupos como sustituyente seleccionados del grupo que consiste en un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo carbamoíl, un grupo hidroxilo, un grupo amino (que puede tener, en el grupo amino, de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo benzoílo), grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo piperidilalquilo inferior, un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener un solo grupo alquilo inferior como sustituyente en el grupo piperazinilo), un grupo aminoalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo amino), grupo feniloxilo (que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, 1) grupos alcoxilo inferior sustituidos con halógeno en el grupo fenilo), un grupo feniloxialquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente 1) grupos alcoxilo inferior sustituidos con halógeno en el grupo fenilo) y un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un grupo oxo), (42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferentemente, de 1 a 2 grupos) como sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo cicloalquilo C3-C8, un grupo alcanóilo inferior, un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo aminoalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente en el grupo amino), un grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 (más preferentemente, 1) grupos alquilo inferior como sustituyente/s en el grupo piperidilo), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior, un grupo tetrahydrofuralalquilo inferior, un grupo piridilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 (más preferentemente 1) grupos fenilo como sustituyente/s en el grupo alquilo inferior), un grupo imidazolilalquilo inferior, un grupo furilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilcarbonilalquilo inferior, un grupo piperidinilo que puede tener de 1 a 2 (más preferentemente, 1) grupos alquilo inferior como sustituyente/s, un grupo piridilo (que puede tener, en el grupo piridilo, de 1 a 3 grupos (más preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciano y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como sustituyente), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo fenilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos (más preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo benzoílo, un grupo furilcarbonilo, un grupo alcoxicarbonilfenilo inferior y un grupo oxo, (43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo, (44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes (más preferentemente, de 1 sustituyentes) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo piridilo, (45) un grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, de 1 a 2) grupos alquilo inferior, (46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo, (47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo piperidilalquilo inferior y un grupo fenilo, (48) un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, 1) grupos fenilo que pueden tener de 1 a 3 grupos (más preferentemente, 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo inferior y un grupo ciano, (49) un grupo azabiciclo[3.2.2]nonilcarbonilo, (50) un grupo 8-azabiciclo[3.2.1]octilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, 1) grupos feniloxilo sustituidos o no sustituidos con halógeno, (51) un grupo indolinilcarbonilo, (52) un grupo tetrahydroquinolilcarbonilo, (53) un grupo tetrahidropirido[3,4-b]indolilcarbonilo, (54) un grupo morfolinilalquilo inferior,

- (55) un grupo piperazinilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, 1) grupos alquilo inferior en el grupo piperazinilo,
 (56) un grupo morfolinilcarbonilalquilo inferior,
 (57) un grupo piperazinilcarbonilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, 1) grupos alquilo inferior en el grupo piperazinilo,
 (58) un grupo oxo,
 (59) un grupo aminoalcoxilo inferior (que puede tener de 1 a 2 (más preferentemente, 2) grupos alquilo inferior en el grupo amino),
 (60) un grupo alcoxi inferior-alcoxilo inferior,
 (61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferentemente, de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo alcoxycarbonilo inferior (más preferentemente, un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo oxo, un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo alquilo inferior, un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo alcanóilo inferior, un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo oxo y un solo grupo alcanóilo inferior y un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo oxo y un solo grupo alcoxycarbonilo inferior),
 (62) un grupo morfolinilo,
 (63) un grupo 1, 3,8-triazaspiro[4.5]decanilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferentemente, de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo fenilo,
 (64) un grupo tetrahidropiridilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferentemente, 1) grupos piridilo,
 (65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener un grupo tioxo y
 (66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decanilo.

Ejemplos

- 25 A continuación, se seguirá explicando la presente invención con referencia a Ejemplos de referencia, Ejemplos y Ejemplos de experimentos farmacológicos y Ejemplos preparativos.

Ejemplo de referencia 1

- 30 Síntesis de clorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina

Se sometió a reflujo con calentamiento durante una hora bajo una atmósfera de nitrógeno una mezcla que consistía en 14,4 g de 4-bromobenzo[b]tiofeno, 29,8 g de anhídrido de piperazina, 9,3 g de *t*-butóxido de sodio, 0,65 g de (*R*)-(+)-2,2'-bis(difenilfosfin)-1,1'-binaftilo (BINAP), 0,63 g de tris(dibencilidenacetona)dipaladio (0) y 250 ml de tolueno.
 35 Se vertió agua a la solución de reacción que luego se extrajo con acetato de etilo, se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. Se evaporó el disolvente bajo una presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano:metanol:agua con amoníaco al 25% = 100:10:1), obteniéndose 9,5 g de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina en forma de un aceite amarillo.

- 40 Después, se añadieron 3,7 ml de ácido clorhídrico concentrado a una solución de metanol de 9,5 g de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina, y se evaporó el disolvente bajo presión reducida. Se añadió acetato de etilo al residuo obtenido y se obtuvieron cristales precipitados mediante filtración. La recristalización se realizó en metanol, obteniéndose clorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina en forma de cristales de tipo aguja incoloros.

Punto de fusión: 276-280°C.

- 45 RMN de ¹H (DMSO-d₆) δppm: 3,25-3,35 (8H, m), 6,94 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,30 (1H, dd, J = 7,8 Hz, J = 7,8 Hz), 7,51 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,68 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,73 (1H, d, J = 5,5 Hz), 9,35 (2H, sa).

Ejemplo de referencia 2

- 50 Síntesis de 4-benzo[b]tiofen-4-il-3-metilpiperazin-1-carboxilato de *terc*-butilo.

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

- 55 RMN de ¹H (CDCl₃) δppm: 1,85-1,95 (3H, m), 1,50 (9H, s), 2,8-2,9 (1H, m), 3,15-3,35 (2H, m), 3,4-3,5 (1H, m), 3,5-3,65 (1H, m), 3,65-3,7 (1H, m), 3,7-3,9 (1H, m), 6,98 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,29 (1H, dd, J = 8 Hz, J = 8 Hz), 7,38 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,61 (1H, d, J = 8 Hz).

Ejemplo de referencia 3

- 60 Síntesis de diclorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-2-metilpiperazina

- 65 Se añadió ácido trifluoroacético (6 ml) a una solución de 1,22 g (3,7 mmol) de 4-benzo[b]tiofen-4-il-3-metilpiperazin-1-carboxilato de *terc*-metilo en una solución de diclorometano (12 ml), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante una hora. Se concentró la mezcla de reacción bajo presión reducida y se añadió una solución acuosa de carbonato de potasio al 5% al residuo, y se extrajo la mezcla resultante con diclorometano. Se secó la solución de extracción con diclorometano sobre sulfato de magnesio y, tras ello, se

concentró bajo presión reducida. Al residuo obtenido, se añadieron ácido clorhídrico concentrado (0,6 ml) y metanol (10 ml), y se concentró la mezcla resultante bajo presión reducida. Se sometió el residuo obtenido a una recristalización en acetonitrilo, obteniéndose diclorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-2-metilpiperazina (0,98 g) en forma de polvo marrón claro.

- 5 RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ ppm: 0,92 (3H, d, J = 6,5 Hz), 2,8-3,6 (6H, m), 3,6-4,0 (1H, m), 5,3-6,8 (1H, m), 7,20 (1H, sa), 7,38 (1H, dd, J = 8 Hz; J = 8 Hz), 7,5-8,0 (3H, m), 9,4-10,1 (2H, m).

Ejemplo de referencia 4

- 10 Síntesis de diclorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-3-metilpiperazina

El compuesto del título se obtuvo usando 2-metilpiperazina y 4-bromobenzo[b]tiofen-4-il-3-metilpiperazina de la misma manera que en el Ejemplo de referencia 1.

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

Ejemplo de referencia 5

- 20 Síntesis de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propionato de etilo

Se añadieron 5,05 g (19,8 mmol) de clorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina a una solución acuosa de hidróxido de sodio y se extrajo la muestra con diclorometano. Se secó la solución de extracción sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida. Se disolvió el residuo obtenido en 50 ml de etanol y se añadió al mismo acrilato de etilo (2,44 ml; 21,8 mmol), y luego se sometió la mezcla de reacción a reflujo con calentamiento durante 4 horas. Se enfrió la solución de reacción hasta la temperatura ambiente y se concentró bajo una presión reducida. Se añadió diisopropiléter al residuo y se obtuvo la materia insoluble precipitada mediante filtración, se lavó con diisopropiléter, y se secó, obteniéndose 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propionato de etilo (5,26 g) en forma de polvo blanco.

30 NMR de ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,28 (3H, t, J = 7,0 Hz), 2,50-2,63 (2H, m), 2,67-2,87 (6H, m), 3,11-3,24 (4H, m), 4,17 (2H, c, J = 7,0 Hz), 6,89 (1H, d, J = 7,8 Hz), 7,27 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,37-7,42 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 7,8 Hz).

Ejemplo de referencia 6

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

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

- 45 RMN de ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,75-1,85 (2H, m), 2,74 (2H, t, J = 5,8 Hz), 2,75-2,85 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 3,85 (2H, t, J = 5,3 Hz), 5,19 (1H, sa), 6,88 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,27 (1H, dd, J = 7,9 Hz, J = 7,8 Hz), 7,39 (2H, s), 7,56 (1H, d, J = 8,0 Hz).

Ejemplo de referencia 7

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

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

- 60 NMR de ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,60-1,73 (4H, m), 2,07 (3H, s), 2,47 (2H, t, J = 7,2 Hz), 2,60-2,72 (4H, m), 3,17-3,22 (4H, m), 4,11 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,27 (1H, dd, J = 7,6 Hz, J = 8,0 Hz), 7,37-7,42 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz).

Ejemplo de referencia 8

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

Se añadió carbonato de potasio (3,87 g, 28 mmol) a una solución de 7,76 g (23,3 mmol) de acetato de 4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butilo en solución de metanol al 90% (150 ml). Se agitó la mezcla de solución a temperatura ambiente durante 2 h. Se añadió agua a la solución de reacción, que se extrajo con diclorometano. Se secó la solución de extracción sobre sulfato de sodio y se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 2:1 → 1:1) y se concentró bajo presión reducida, obteniéndose 4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butan-1-ol (6,65 g) en forma de aceite incoloro.

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

Ejemplo de referencia 9

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

Se suspendieron 3,56 g (12,9 mmol) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propan-1-ol en 30 ml de diclorometano, y, a esto, se añadieron tetracloruro de carbono (30 ml) y trifeniilfosfina (4,06 g, 15,5 mmol). Se sometió la mezcla a reflujo con calentamiento durante 3 horas. Se enfrió la solución de reacción hasta la temperatura ambiente, y luego se añadieron metanol y diclorometano a la misma para homogenizar la muestra. Se añadió gel de sílice (30 g) a la solución y se evaporó el disolvente bajo una presión reducida. Se cargó el residuo obtenido en una columna de gel de sílice (300 g) y se extrajo con una mezcla disolvente de *n*-hexano:acetato de etilo = 2:1. Se concentró la solución de extracción bajo presión reducida, obteniéndose 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-(3-cloropropil)piperazina (2,36 g) en forma de aceite incoloro.

RMN de ¹H (CDCl₃) δppm: 1,95-2,10 (2H, m), 2,60 (2H, t, J = 7,2 Hz), 2,65-2,75 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 3,65 (2H, t, J = 6,6 Hz), 6,89 (1H, dd, J = 7,6 Hz, J = 0,7 Hz), 7,27 (1H, dd, J = 7,9 Hz, J = 7,8 Hz), 7,38 (1H, d, J = 5,6 Hz), 7,41 (1H, d, J = 5,7 Hz), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz).

Ejemplo de referencia 10

Síntesis de 4-hidroxitiofeno-2-carboxilato de metilo

Se añadió cloruro de tionilo (1,6 ml) en gotas a una solución de metanol (20 ml) de ácido 4-hidroxitiofeno-2-carboxílico (1,1 g; 7,6 mmol) en enfriamiento con hielo. Se sometió la mezcla de solución a reflujo con calentamiento durante 5 horas. Se enfrió la solución de reacción hasta la temperatura ambiente, se vertió en agua con hielo y se extrajo con acetato de etilo. Se secó la solución de extracción con acetato de etilo sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna de gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 4:1) y se concentró/secó bajo presión reducida, obteniéndose 4-hidroxitiofeno-2-carboxilato de metilo (0,7 g) en forma de un polvo blanco.

RMN de ¹H (CDCl₃) δppm: 3,90 (3H, s), 5,50-6,60 (1H, sa), 6,64 (1H, d, J = 1,9 Hz), 7,43 (1H, d, J = 1,8 Hz).

Ejemplo de referencia 11

Síntesis de 6-hidroxipirimidin-4-carboxilato de etilo

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

RMN de ¹H (CDCl₃) δppm: 1,29 (3H, t, J = 7,0 Hz), 4,29 (2H, c, J = 7,0 Hz), 6,87 (1H, d, J = 1,0 Hz), 8,27 (1H, d, J = 1,0 Hz), 10,54 (1H, sa).

Ejemplo de referencia 12

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

Se enfrió una solución de dietiléter (35 ml) de acetilendicarboxilato de dimetilo (5,0 g, 35 mmol) con un medio de congelación (sal y hielo). A esta solución, se añadió una solución en dietiléter (15 ml) de metilhidrazina (0,63 ml, 35 mmol) en gotas mientras se mantenía la temperatura a 0°C o menos. Tras finalizar la adición de las gotas, se agitó la solución a 0°C durante una hora. Se obtuvo la materia insoluble precipitada mediante filtración y se lavó con dietiléter. Se calentó la torta filtrante hasta 130°C durante 30 minutos y se enfrió hasta la temperatura ambiente. Se añadió metanol a la torta, que se concentró bajo una presión reducida. Se añadió acetato de etilo al residuo obtenido, y se concentró el residuo bajo una presión reducida. Se añadió acetato de etilo al residuo y se obtuvo la materia insoluble precipitada mediante filtración, se lavó con acetato de etilo y se secó, obteniéndose 5-hidroxi-1-metil-1*H*-pirazol-3-carboxilato de metilo (3,26 g) en forma de polvo amarillo claro. RMN de ¹H (DMSO-d₆) δppm: 3,58 (3H, s), 3,73 (3H, s), 5,77 (1H, s), 11,41 (1H, sa).

Ejemplo de referencia 13

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

Se añadieron trietilamina (1,03 ml, 7,4 mmol) y cloroformiato de isobutilo (0,76 ml, 5,5 mmol) a una solución en acetonitrilo (12 ml) de ácido 6-cloronicotínico (0,58 g, 3,6 mmol) bajo enfriamiento con hielo, y se agitó la mezcla a 0°C durante 30 minutos. Se añadió a la mezcla de solución 2,2,2-trifluoroetilamina (0,88 ml, 11,2 mmol) y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 10 minutos. Se añadió agua a la solución de reacción, que luego se extrajo con acetato de etilo. Se secó la solución de extracción con acetato de etilo sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 5:1 → 1: 1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida, y se añadieron diisopropiléter y *n*-hexano. Se obtuvo la materia insoluble precipitada mediante filtración y se secó, obteniéndose 6-cloro-*N*-(2,2,2-trifluoroetil)nicotinamida (0,58 g) en forma de un polvo amarillo claro.

10 RMN de ¹H (CDCl₃) δppm: 4,15 (2H, dc, J = 6,5 Hz, 9,0 Hz), 6,35 (1H, sa), 7,46 (1H, dd, J = 0,7 Hz, J = 8,5 Hz), 8,11 (1H, dd, J = 2,5 Hz, J = 8,5 Hz), 8,77 (1H, dd, J = 0,7 Hz, J = 2,5 Hz).

Ejemplo de referencia 14

15 Síntesis de *N*-(2,2,2-trifluoroetil)-4-cloropiridina-2-carboxamida

Se añadieron 1-hidroxibenzotriazol (0,53 g, 3,5 mmol), clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (WSC) (0,67 g, 3,5 mmol) y 2,2,2-trifluoroetilamina (0,51 ml, 6,35 mmol) a una solución en diclorometano (5 ml) de ácido 4-cloropiridin-2-carboxílico (0,5 g, 3,17 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante una hora. Se añadió agua a la solución de reacción, que luego se extrajo con acetato de etilo. Se secó la solución de extracción con acetato de etilo sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 11:1 → 5:1). Se concentró el producto purificado hasta la sequedad bajo una presión reducida, obteniéndose *N*-(2,2,2-trifluoroetil)-4-cloropiridina-2-carboxamida (435 mg) en forma de polvo blanco.

20 RMN de ¹H (CDCl₃) δppm: 4,13 (2H, dc, J = 6,8 Hz, 9,0 Hz), 7,49 (1H, dd, J = 2,1 Hz, J = 5,3 Hz), 8,22 (1H, dd, J = 0,4 Hz, J = 2,1 Hz), 8,30 (1H, sa), 8,49 (1H, dd, J = 0,4 Hz, J = 5,3 Hz).

Ejemplo de referencia 15

30 Síntesis de 2-clorotiazol-4-carboxamida

Se añadieron 1-hidroxibenzotriazol (0,56 g, 3,7 mmol), clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (WSC) (0,7 g, 3,7 mmol) y agua con amoníaco (28%, 0,5 ml) a una solución en diclorometano (10 ml) de ácido 2-clorotiazol-4-carboxílico (0,5 g, 3,06 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 46 horas. Se añadió agua a la solución de reacción, que luego se extrajo con acetato de etilo. Se secó la solución de extracción con acetato de etilo sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 3:5 → acetal de etilo). Se concentró el producto purificado hasta la sequedad bajo una presión reducida, obteniéndose 2-clorotiazol-4-carboxamida (475 mg) en forma de polvo blanco.

40 RMN de ¹H (CDCl₃) δppm: 5,70 (1H, sa), 7,01 (1H, sa), 8,06 (1H, s).

Ejemplo de referencia 16

45 Síntesis de *N*-metil-2-clorotiazol-5-carboxamida

El compuesto del título se obtuvo usando ácido 2-clorotiazol-5-carboxílico de la misma manera que en el Ejemplo de referencia 13.

RMN de ¹H (CDCl₃) δppm: 3,00 (3H, d, J = 4,9 Hz), 5,92 (1H, sa), 7,84 (1H, sa).

50 Ejemplo de referencia 17

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

Se añadió paladio soportado sobre carbono al 5% (1,5 g) a una solución en etanol (250 ml) de 2-(4-metoxi-2-nitrofenoxi)-2-metilpropionato de etilo (14,6 g, 51,6 mmol) para realizar una reducción catalítica a temperatura ambiente. Se retiró el catalizador por filtración y se concentró el filtrado bajo presión reducida. Se añadió agua al residuo obtenido, que luego se extrajo con acetato de etilo. Se secó la solución de extracción sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 9:1). Se concentró el producto purificado hasta la sequedad bajo una presión reducida, obteniéndose 6-metoxi-2,2-dimetil-4*H*-benzo[1,4]oxazin-3-ona (7,0 g) en forma de polvo blanco.

60 RMN de ¹H (CDCl₃) δppm: 1,53 (6H, s), 3,78 (3H, s), 6,40 (1H, d, J = 2,8 Hz), 6,52 (1H, dd, J = 2,8 Hz, J = 8,8 Hz), 6,88 (1H, d, J = 8,7 Hz), 8,66 (1H, sa).

Ejemplo de referencia 18

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

Se añadió una solución en diclorometano (36 ml) de tribromuro de boro 2M en gotas a una solución en diclorometano de 6-metoxi-2,2-dimetil-4*H*-benzo[1,4]oxazin-3-ona (5,0 g, 26 mmol) bajo enfriamiento con hielo, y se agitó la mezcla durante una noche. Se añadió agua a la solución de reacción para descomponer los reactivos presentes en exceso. Se lavó la solución de reacción con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 2:1). Se concentró el producto purificado hasta la sequedad bajo una presión reducida, obteniéndose 6-hidroxi-2,2-dimetil-4*H*-benzo[1,4]oxazin-3-ona (2,2 mg) en forma de polvo blanco.
RMN de ¹H (DMSO-*d*₆) δppm: 1,34 (6H, s), 6,25-6,40 (2H, m), 6,70 (1H, d, J = 8,5 Hz), 9,09 (1H, s), 10,41 (1H, sa).

10 Ejemplo de referencia 19

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

15 El compuesto del título se obtuvo usando ácido 6-metoxi-2-metil-4*H*-benzo[1,4]oxazin-3-ona de la misma manera que en el Ejemplo de referencia 18.
Polvo blanco
RMN de ¹H (DMSO-*d*₆) δppm: 1,34 (3H, d, J = 6,8 Hz), 4,46 (1H, c, J = 6,8 Hz), 6,23-6,27 (1H, m), 6,33 (1H, d, J = 2,7 Hz), 6,70 (1H, d, J = 8,6 Hz), 9,11 (1H, s), 10,44 (1H, sa).

20 Ejemplo de referencia 20

Síntesis de 4-(4-metoxifenil)-1-(tolueno-4-sulfonil)piperidina

25 Se añadió cloruro de *p*-toluenosulfonilo (4,39 g, 23 mmol) a una solución en piridina (30 ml) de 4-(4-metoxifenil)piperidina (4,0 g, 21 mmol) y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante una noche. Se añadió agua a la mezcla de solución, que luego se extrajo con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con ácido clorhídrico y agua, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 1:1). Se concentró el producto purificado hasta la sequedad bajo una presión reducida, obteniéndose 4-(4-metoxifenil)-1-(tolueno-4-sulfonil)piperidina (4,8 g) en forma de polvo blanco.
30 RMN de ¹H (CDCl₃) δppm: 1,60-1,90 (4H, m), 2,30-2,40 (3H, m), 2,46 (3H, s), 3,78 (3H, s), 3,90-3,95 (2H, m), 6,84 (2H, 35 dd, J = 1,9, J = 6,8 Hz), 7,07 (2H, dd, J = 1,9, J = 6,8 Hz), 7,35 (2H, d, J = 8,2 Hz), 7,68 (2H, d, J = 8,2 Hz).

35 Ejemplo de referencia 21

Síntesis de 4-(4-hidroxifenil)-1-(tolueno-4-sulfonil)piperidina

40 El compuesto del título se obtuvo usando 4-(4-metoxifenil)-1-(tolueno-4-sulfonil)piperidina de la misma manera que en el Ejemplo de referencia 18.
Polvo marrón
RMN de ¹H (CDCl₃) δppm: 1,60-1,90 (4H, m), 2,30-2,50 (3H, m), 2,45 (3H, s), 3,90-3,95 (2H, m), 6,67 (1H, sa), 6,80 (2H, dd, J = 1,9, J = 6,8 Hz), 7,02 (2H, dd, J = 1,8, J = 6,9 Hz), 7,35 (2H, d, J = 8,1 Hz), 7,68 (2H, d, J = 8,1 Hz).

45 Ejemplo de referencia 22

Síntesis de 4-bromo-2-hidroximetil-6-metoxifenol

50 Se añadió borohidruro de sodio (0,28 g, 6,9 mmol) a una solución en THF (30 ml) de 5-bromo-2-hidroxi-3-metoxibenzaldehído (3,2 g 13,8 mmol) bajo enfriamiento con hielo, y se agitó la mezcla a 0°C durante 2 horas. Se añadió ácido acético a la solución de reacción para fijar el pH a 3. Se añadió ácido clorhídrico al 10% a la mezcla de reacción, que luego se extrajo con acetato de etilo. Se secó el material extraído sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía en columna de gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 5:4+1:1) y se concentró hasta la sequedad bajo presión reducida, obteniéndose 4-bromo-2-hidroximetil-6-metoxifenol (3,23 g) en forma de un aceite amarillo claro.
55 RMN de ¹H (CDCl₃) δppm: 3,88 (3H, s), 4,71 (2H, s), 6,94 (1H, d, J = 2,0 Hz), 7,03 (1H, d, J = 2,0 Hz).

Ejemplo de referencia 23

Síntesis de 5-bromo-3-metoxi-2-metoximetoxibenzaldehído

60 Se añadieron etildiisopropilamina (3,01 ml, 17,1 mmol) y cloruro de metoximetilo (1,5 ml, 15,7 mmol) a una solución en diclorometano (30 ml) de 5-bromo-2-hidroxi-3-metoxibenzaldehído (3,3 g, 14,3 mmol) bajo enfriamiento con hielo, y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 2 horas. Se lavó la solución de reacción con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo 3:4+11:9). Se concentró el producto purificado hasta la sequedad bajo una presión reducida, obteniéndose 5-bromo-3-metoxi-2-metoximetoxibenzaldehído (4,2 mg) en forma

de sólido amarillo claro.

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

5 Ejemplo de referencia 24

Síntesis de 3-metoxi-2-metoximetoxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzaldehído

10 Se añadieron 2-oxazolidinona (0,38 g, 4,36 mmol), tris(dibencilidenacetona) de dipaladio (0,17 g, 0,18 mmol), 9,9-dimetil-4,5-bis(difenilfosfino)xanteno (XANTPHOS) (0,32 g, 0,55 mmol) y carbonato de cesio (1,66 g, 5,1 mmol) a una solución en dioxano (20 ml) de 5-bromo-3-metoxi-2-metoximetoxibenzaldehído (1,0 g, 3,6 mmol), y se agitó la mezcla a 100°C durante 24 horas bajo una atmósfera de argón. Se enfrió la solución de reacción hasta la temperatura ambiente y se añadió acetato de etilo a la misma. Se filtró la mezcla sobre cerita. Se lavó el filtrado con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante
15 cromatografía en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo 4:1→1:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida. Se añadieron al residuo acetato de etilo y diisopropiléter. Se obtuvo la materia insoluble así purificada mediante filtración y se secó, obteniéndose 3-metoxi-2-metoximetoxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzaldehído (0,5 g) en forma de un polvo blanco.

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

Ejemplo de referencia 25

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

25 Se disolvió 3-metoxi-2-metoximetoxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzaldehído (0,5 g, 1,79 mmol) en una mezcla disolvente de ácido acético (5 ml) y etanol (5 ml), y se añadió paladio soportado sobre carbono al 10% (0,05 g) para realizar una reducción catalítica a 1 atm y 50°C durante 4 horas. Se enfrió la mezcla de reacción hasta la temperatura ambiente y se filtró a través de cerita. Se concentró el filtrado bajo presión reducida. Se disolvió el residuo en ácido acético (10 ml) y se añadió paladio soportado sobre carbono al 10% (0,05 g) para realizar la reducción catalítica a 1 atm y 50°C durante 6 horas. Se retiró el disolvente bajo presión reducida, obteniéndose
30 3-(3-metoxi-4-metoximetoxi-5-metilfenil)oxazolidin-2-ona en forma de un producto en bruto, que se sometió así a la siguiente reacción.

35 RMN de ^1H (CDCl_3) δ ppm: 2,32 (3H, s), 3,56 (3H, s), 3,85 (3H, s), 3,98-4,06 (2H, m), 4,43-4,50 (2H, m), 5,05 (2H, s), 6,61 (1H, d, J = 2,3 Hz), 7,36 (1H, d, J = 2,3 Hz).

Ejemplo de referencia 26

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

40 Se añadió ácido clorhídrico al 10% (5 ml) a una solución de metanol (5 ml) de 3-(3-metoxi-4-metoximetoxi-5-metilfenil)oxazolidin-2-ona (0,48 g, 1,79 mmol) y se agitó la mezcla a 50°C durante 10 minutos. Se añadió agua a la solución de reacción, que luego se extrajo con acetato de etilo. Se secó el material extraído sobre sulfato de magnesio y después se concentró hasta la sequedad bajo presión reducida, obteniéndose
45 3-(4-hidroxi-3-metoxi-5-metilfenil)oxazolidin-2-ona (434 mg) en forma de un polvo amarillo claro.

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

Ejemplo de referencia 27

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

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

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

Ejemplo de referencia 28

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

Se añadió ácido clorhídrico al 10% (4 ml) a una solución en THF (7 ml) de 1-(8-metoxi-2,2-dimetil-4*H*-benzo[1,3]dioxin-6-il)pirrolidin-2-ona (0,36 g, 1,3 mmol) y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 17 horas. Se añadió agua a la solución de reacción, que luego se extrajo con diclorometano. Se secó el material extraído sobre sulfato de magnesio, se concentró bajo presión reducida y se purificó mediante
65 cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano: metanol = 300:1→30:1). Se concentró el producto

purificado hasta la sequedad bajo una presión reducida, obteniéndose 1-(4-hidroxi-3-hidroximetil-5-metoxifenil)pirrolidin-2-ona (0,31 g) en forma de un polvo marrón claro. RMN de ^1H (CDCl_3) δ ppm: 2,05-2,28 (3H, m), 2,26 (2H, t, J = 7,5 Hz), 3,84 (2H, t, J = 7,0 Hz), 3,91 (3H, s), 4,74 (2H, s), 5,90 (1H, sa), 6,78 (1H, d, J = 2,5 Hz), 7,52 (1H, d, J = 2,5 Hz).

5

Ejemplo de referencia 29

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

10 El compuesto del título se obtuvo usando ácido 5-bromo-3-metoxi-2-metoximetoxibenzaldehído y 2-pirrolidona de la misma manera que en el Ejemplo de referencia 25.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ ppm: 2,11-2,24 (2H, m), 2,63 (2H, t, J = 8,3 Hz), 3,56 (3H, s), 3,89 (2H, t, J = 7,0 Hz), 3,92 (3H, s), 5,21 (2H, s), 7,08 (1H, d, J = 2,5 Hz), 8,28 (1H, d, J = 2,5 Hz), 10,46 (1H, s).

15 Ejemplo de referencia 30

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

20 Se disolvió 3-metoxi-2-metoximetoxi-5-(2-oxopirrolidin-1-il)benzaldehído (0,72 g, 2,56 mmol) en una mezcla disolvente de ácido acético (5 ml) y etanol (7 ml) y se añadió paladio soportado sobre carbono al 10% (70 mg) para realizar una reducción catalítica a 50°C durante 10 horas. Se enfrió la solución de reacción hasta la temperatura ambiente y se filtró a través de cerita. Se concentró la torta filtrada bajo presión reducida. Se disolvió el residuo así obtenido en diclorometano (15 ml), y se añadieron ácido trifluoroacético (2,0 ml, 25,6 mmol) y trietilsilano (2,0 ml, 12,8 mmol) bajo un enfriamiento con hielo. Se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 16 horas. Se concentró la mezcla bajo presión reducida y se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 5:1 \rightarrow acetato de etilo). Se concentró el producto purificado bajo una presión reducida, obteniéndose 1-(4-hidroxi-3-metoxi-5-metilfenil)pirrolidin-2-ona (0,41 g) en forma de aceite amarillo claro. RMN de ^1H (CDCl_3) δ ppm: 2,17-2,25 (5H, m), 2,72 (2H, t, J = 8,3 Hz), 3,88 (2H, t, J = 7,0 Hz), 3,89 (3H, s), 6,66 (1H, d, J = 2,5 Hz), 7,15 (1H, d, J = 2,5 Hz).

30

Ejemplo de referencia 31

Síntesis de 3,4-diacetoxi-5-metilbenzaldehído

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

40

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

45 Ejemplo de referencia 32

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

50 El compuesto del título se obtuvo usando ácido 7-metoximetoxi-1,4-dihidrobenzo[d][1,3]oxazin-2-ona de la misma manera que en el Ejemplo de referencia 26.

Polvo blanco

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

55

Ejemplo de referencia 33

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

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

65

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

Ejemplo de referencia 34

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

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

Polvo marrón claro

- 10 RMN de ¹H (DMSO-d₆) δppm: 4,18 (2H, sa), 6,75-6,85 (1H, m), 7,01 (1H, dd, J = 2,0 Hz, J = 9,0 Hz), 8,07 (1H, d, J = 9,0 Hz), 8,87 (1H, sa), 9,48 (1H, sa), 13,21 (1H, sa).

Ejemplo de referencia 35

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

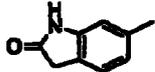
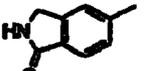
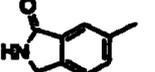
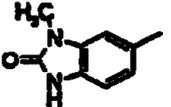
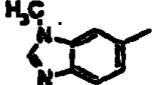
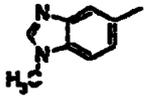
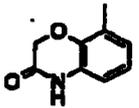
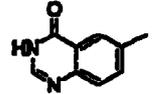
- 15 Se añadieron carbonato de cesio (2,08 g, 6,4 mmol) y 1-bromo-3-cloropropano (1,6 ml) a una solución en DMF (5 ml) de 5-hidroxi-1-metil-1*H*-pirazol-3-carboxilato de metilo (0,83 g, 5,3 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 21 horas. Se añadió agua a la solución de reacción, que luego se extrajo con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. Se concentró la solución de reacción bajo presión reducida.
- 20 Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 100:1 → 4:1). Se concentró el producto purificado hasta la sequedad bajo presión reducida, obteniéndose 5-(3-cloropropoxi)-1-metil-1*H*-pirazol-3-carboxilato de metilo (1,17 g) en forma de sólido blanco.
- 25 RMN de ¹H (CDCl₃) δppm: 2,21-2,32 (2H, m), 3,72 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,72 (2H, s), 3,91 (3H, s), 4,24 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,10 (1H, s).

Ejemplo de referencia 36

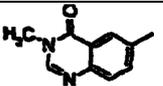
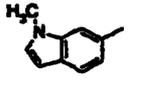
Síntesis de 7-(3-cloropropoxi)-2*H*-1,4-benzoxazin-3(4*H*)-ona

- 30 El compuesto del título se obtuvo usando 7-hidroxi-2*H*-1,4-benzoxazin-3(4*H*)-ona y 1-bromo-3-cloropropano de la misma manera que en el Ejemplo de referencia 35.
- Cristal de tipo aguja de color marrón claro (etanol-*n*-hexano).
Punto de fusión: 119-120°C.
- 35 Los compuestos enumerados en las siguientes Tablas 1 a 3 se produjeron usando las sustancias iniciales apropiadas de las mismas maneras que los Ejemplos de referencia 1 a 36.

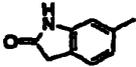
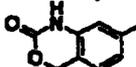
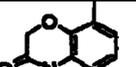
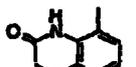
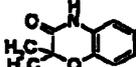
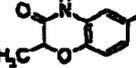
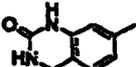
[Tabla 1]

R1-O-(CH ₂) ₃ -Cl		
Ejemplo de referencia	R1	RMN
37		RMN de ¹ H (DMSO-d ₃) δppm: 2,1-2,2 (2H, m), 8,37 (2H, s), 3,71 (2H, t J = 6,5 Hz), 4,04 (2H, t, J = 6Hz), 6,40 (1H, d, J = 2,5 Hz). 649 (1H, dd, J = 25,8 Hz), 7,08 (1H, d, J = 8 Hz), 10,53 (1H, sa).
38		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δppm 227 (2H, t, J = 6,1 Hz), 376 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,19 (2H, t, J = 5,7 Hz), 4,41 (2H, s), 6,86 (1H, s), 7,01 (1H, dd, J = 2,2; 5,5 Hz), 7,17 (1H, sa), 7,77 (1H, d, J = 8,4 Hz).
39		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δppm: 2,27 (2H, t, J = 6,1 Hz), 3,75 (2H, t, J = 5,3 Hz), 4,19 (2H, t, J = 5,7 Hz), 4,40 (2H, s), 6,50-6,60 (1H, sa), 7,15 (1H, dd, J = 2,3; 8,5 Hz), 7,35-7,40 (2H, m).
40		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δppm 2,20-2,35 (2H, m), 3,38 (3H, s), 3,75-3,80 (2H, m), 4,05-4,15 (2H, m), 6,55-6,65 (2H, m), 6,98 (1H, d, J = 7,5 Hz), 9,92 (1H, sa).
41		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δppm: 2,28 (2H, t, J = 8,0 Hz), 3,75-3,80 (5H, m), 4,18 (2H, t, J = 5,7 Hz), 6,85 (1H, d, J = 2,1 Hz), 6,906,85 (1H, m), 7,66 (1H, d, J = 8,8 Hz), 7,78 (1H, s).
42		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δppm: 2,20-2,30 (2H, m), 3,78 (2H, t, J = 6,9 Hz), 3,92 (3H, s), 4,18 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,97 (1H, dd, J = 2,3; 88 Hz), 7,25-7,30 (2H, m), 7,81 (1H,s).
43		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δppm: 2,20-2,35 (2H, m), 3,77 (2H, t, J = 5,2 Hz), 4,19 (2H, t, J = 8,0 Hz), 4,68 (2H, s), 6,47 (1H, dd, J = 7,9,12 Hz), 6,67 (1H, dd, J = 8,3; 1,1 Hz), 6,90 (1H, dd, J = 8,2; 8,1 Hz), 8,29 (1H, sa).
44		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δppm: 2,24 (2H, t, J = 6,2; 5,2 Hz), 3,70 (2H, t, J = 6,4 Hz), 3,77 (3H, s), 4,45 (2H, t, J = 6,1 Hz), 6,70 (1H, d, J = 8,9 Hz), 8,98 (1H, dd, J = 8,9; 3,0 Hz), 7,35 (1H, d, J = 3,0 Hz).

[Tabla 2]

R1-O-(CH ₂) ₃ -Cl		
Ejemplo de referencia	R1	RMN
45		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δppm: 2,30 (2H, tt, J = 6,1; 6,1 Hz), 3,60 (3H, s), 3,77 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,25 (2H, t, J = 5,8 Hz), 7,34 (1H, dd, J = 8,9; 2,9 Hz), 7,65 (1H, d, J = 8,9 Hz), 7,88 (1H, d, J = 2,9 Hz); 7,95 (1H, s)
121		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δppm: 2,25 (2H, tt, J = 6,1; 6,1 Hz), 3,76 (3H, s), 3,78 (2H, t, J = 6,4 Hz), 4,25 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,39 (1H, t, J = 3,0 Hz), 6,88 (1H, dd, J = 8,8; 2,4 Hz), 7,02 (1H, d, J = 3,0 Hz). 7,10 (1H, d, J = 2,3 Hz), 7,21 (1H, d, J = 8,8 Hz)

[Tabla 3]

R1-O-(CH ₂) ₄ -Cl		
Ejemplo de referencia	R1	RMN
46		RMN de ¹ H (DMSO-d ₆) δppm: 1,75-1,9 (4H, m), 3,36 (2H, s), 3,70 (2H, t, J = 6,5Hz), 3,98 (2H, t, J = 6 Hz), 6,38 (1H, d, J = 2 Hz), 6,48 (1H, dd, J = 2,5; 8 Hz), 7,07 (1H, d, J = 8 Hz), 10,32 (1H, sa)
47		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δppm: 1,91-2,00 (4H, m), 3,82 (2H, t, J = 6,2 Hz), 3,98 (2H, t, J = 5,6 Hz), 5,25 (2H, s), 6,36 (1H, d, J = 2,3 Hz), 6,57 (1H, dd, J = 8,4; 2,3 Hz), 7,00 (1H, d, J = 8,4 Hz), 8,08 (1H, sa)
48		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δppm: 1,95-2,04 (4H, m), 3,61-3,65 (2H, m), 4,06-4,09 (2H, m), 4,66 (2H, s), 6,46 (1H, d, J = 8,0 Hz), 6,63 (1H, d, J = 8,3 Hz), 6,89 (1H, dd, J = 8,0; 8,3 Hz), 8,41 (1H, sa)
49		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δppm: 1,80-2,00 (4H, m), 3,77 (2H, t, J = 6,4 Hz), 4,24 (2H, t, J = 5,8 Hz), 4,63 (2H, s), 6,55-6,70 (2H, m), 6,90 (1H, dd, J = 8,4; 8,4 Hz), 8,00 (1H, sa).
50		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δppm: 1,52 (6H, s), 1,90-2,10 (4H, m), 3,63 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,95 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,38 (1H, d, J = 2,8 Hz), 6,50 (1H, dd, J = 2,8; 8,7 Hz), 6,86 (1H, d, J = 8,8 Hz), 8,57 (1H, sa).
51		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δppm: 1,56 (3H, d, J = 6,8 Hz), 1,85-2,10 (4H, m), 3,61 (2H, t, J = 6,2 Hz), 3,94 (2H, t, J = 5,8 Hz), 4,59 (1H, c, J = 6,8 Hz), 6,38 (1H, d, J = 2,8 Hz), 6,49 (1H, dd, J = 2,8; 8,7 Hz), 6,88 (1H, d, J = 8,7 Hz), 8,60 (1H, sa).
52		RMN de ¹ H (DMSO-d ₆) δppm: 1,81-2,10 (4H, m), 3,54-3,70 (2H, m), 3,89-4,03 (2H, m), 4,47 (2H, sa), 5,02 (1H, sa), 6,22 (1H, d, J = 2,4 Hz), 6,49 (1H, dd, J = 6,3, 2,4 Hz), 6,85-7,00 (2H, m).

Ejemplo 1 (Referencia)

5

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

Se añadieron 5-(3-cloropropoxi)-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (1,17 g, 5,0 mmol), clorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina (1,35 g, 5,3 mmol), carbonato potásico (1,74, 12,6 mmol) y yoduro de sodio (0,75 g, 5,0 mmol) a DMF (12 ml), y se agitó la mezcla a 80°C durante 3 horas. Se enfrió la solución de reacción hasta la temperatura ambiente, se añadió agua a la misma y luego se extrajo con acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. Se concentró la solución de reacción bajo presión reducida y se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 7:3 → diclorometano: acetato de etilo – 100:3). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida, obteniéndose una sustancia oleaginosa de color amarillo claro (1,97 g). Se dejó reposar la sustancia oleaginosa a temperatura ambiente, obteniéndose una sustancia sólida que se lavó con diisopropiléter y se secó, obteniéndose 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (1,49 g).

Punto de fusión: 109,0-110,5°C;

EM: 414 (M⁺)

20

Ejemplo 2 (Referencia)

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

Se añadió una solución acuosa de hidróxido de sodio 6N (2 ml) a una solución en etanol (10 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (1,62 g, 3,9 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 4 días. Después, se añadió ácido clorhídrico 6N (2 ml) a la solución de reacción bajo enfriamiento con hielo y se agitó la mezcla de solución. Se añadió diclorometano a la solución de reacción y se obtuvo el precipitado mediante filtración. Se separó el filtrado y se concentró la fase orgánica bajo presión reducida. Se combinaron la torta filtrante y el residuo, se lavaron con agua y se secaron, obteniéndose ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico (1,53 g) en forma de polvo blanco.

Punto de fusión: 114,5-118,0°C.

30

Ejemplo 3 (Referencia)

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

5 Se enfrió una solución en DMF de ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)]propoxil-1-metil-1*H*-pirazol-3-carboxílico (0,3 g, 0,75 mmol) sobre hielo, y se añadieron trietilamina (0,73 ml, 5,2 mmol), clorhidrato de metilamina (0,3 g, 4,5 mmol) y dietilfosforocianidato (DEPC) (0,25 ml, 1,4 mmol) a la misma, y luego se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 24 horas. Se añadieron a la
10 solución de reacción trietilamina (0,73 ml, 5,2 mmol), clorhidrato de metilamina (0,3 g, 4,5 mmol) y DEPC (0,25 ml, 1,4 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 4 días. Se añadió agua a la solución de reacción, que luego se extrajo con acetato de etilo. Se lavó el material extraído con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. Se concentró la solución bajo presión reducida y se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 5:1→ acetato de etilo). Se concentró el producto purificado bajo presión
15 reducida y se disolvió el residuo en acetato de etilo, y se añadió al mismo una solución de ácido clorhídrico 4*N*/acetato de etilo. Se obtuvo la materia insoluble precipitada mediante filtración y se secó, obteniéndose clorhidrato de *N*-metil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)]propoxi]-1-metil-1*H*-pirazol-3-carboxamida (0,24 g) en forma de un polvo amarillo
20 Punto de fusión: 228,0-232,5°C (descompuesto).

Ejemplo 4 (Referencia)

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

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

Ejemplo 5 (Referencia)

Síntesis de clorhidrato de *N*-metil-2-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)]propoxiltiazol-4-carboxamida

35 Se añadió hidruro de sodio (55%, oleaginoso; 90 mg, 2,2 mmol) a una solución en DMF (2 ml) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propanol (0,2 g, 0,7 mmol) y *N*-metil-2-clorotiazol-4-carboxamida (0,26 g, 1,45 mmol) bajo un enfriamiento con hielo, y se agitó la solución a 80°C durante 1,5 horas. Tras enfriar la solución de reacción hasta la temperatura ambiente y añadir agua a la misma, se extrajo con acetato de etilo. La solución de extracción con acetato de etilo se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano:acetato de etilo = 5:1 → acetato de etilo). Tras concentrar el producto purificado bajo presión reducida, se disolvió el residuo en acetato de etilo. Se
40 añadió una solución de ácido clorhídrico 4*N*/acetato de etilo a la solución y se obtuvo la materia insoluble precipitada mediante filtración y se secó, obteniéndose clorhidrato de *N*-metil-2-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)]propoxi]tiazol-4-carboxamida (0,24 g) en forma de polvo amarillo claro.
45 Punto de fusión: 199,5-202,5°C

Ejemplo 6 (Referencia)

Síntesis de (Referencia)

50 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)]propoxi]-3-metoxi-5-metilnilina

Se añadió ácido clorhídrico 6*N* (3 ml) a una solución en metanol (10 ml) de *tert*-butiléster de ácido {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)]propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}-carbámico (2,18 g, 4,3 mmol), y se agitó la
55 mezcla a temperatura ambiente durante una noche. Tras agitar a 60°C durante 15 minutos, se enfrió la mezcla hasta la temperatura ambiente y se añadió una solución acuosa de hidróxido de sodio 6*N* a la misma para neutralizarla. Se añadió diclorometano a la mezcla de reacción y se secó la sustancia extraída con diclorometano sobre sulfato de magnesio, y se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 3:2→ acetato de etilo). Se concentró el producto purificado hasta la
60 sequedad bajo presión reducida, obteniéndose 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)]propoxil-3-metoxi-5-metilnilina (1,26 g) en forma de sólido amarillo claro.
Punto de fusión: 155,0-158,0°C;
EM: 411 (M⁺)

65

Ejemplo 7 (Referencia)

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

- 5 Se añadió 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil (0,9 g, 2,2 mmol) a formatos de etilo (10 ml) y se sometió a reflujo con calentamiento durante 33 horas. Tras enfriar la solución de reacción hasta la temperatura ambiente, se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 5:1→ acetato de etilo). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se añadió una solución de ácido clorhídrico 4N/acetato de etilo a una solución en acetato de etilo del residuo. Se obtuvo la materia insoluble precipitada mediante filtración, obteniéndose clorhidrato de *N*--{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}formamida (0,3 g) en forma de polvo blanco. Punto de fusión: 247,5-253,0°C (descompuesto)

Ejemplo 8 (Referencia)

- 15 Síntesis de clorhidrato de *N*--metil-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil

- 20 Se añadió una solución acuosa de clorhidrato de sodio 6N a clorhidrato de *N*--{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}formamida (0,23 g, 0,48 mmol) y se extrajo la mezcla de solución con diclorometano. Se secó la solución de extracción con diclorometano sobre sulfato de magnesio, y se concentró bajo presión reducida. Se disolvió el residuo obtenido en una solución de tetrahidrofurano (THF) (5 ml) y se añadió hidruro de litio y aluminio (30 mg; 0,71 mmol) al mismo bajo un enfriamiento con hielo, y se sometió a reflujo con calentamiento durante 15 minutos. Se enfrió la solución de reacción sobre hielo, y se añadieron agua (0,03 ml), solución acuosa de hidróxido de sodio al 15% (0,03 ml) y agua (0,09 ml) por este orden a la mezcla de reacción, y se agitó. Se retiró la materia insoluble por filtración y se concentró el filtrado bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 5:1→ 3:1) y se concentró bajo presión reducida. Se añadió una solución de ácido clorhídrico 4N/acetato de etilo a una solución del residuo en acetato de etilo, y se obtuvo la materia insoluble precipitada mediante filtración, obteniéndose clorhidrato de *N*--metil-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil (63 mg) en forma de polvo blanco. Punto de fusión: 239,5-244,0°C (descompuesto)

Ejemplo 9 (Referencia)

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

- 40 Se añadió hidruro de sodio (55%, oleaginoso, 0,06 g, 1,3 mmol) a una solución en DMF (5 ml) de *N*--{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}acetamida (0,45 g, 0,99 mmol) bajo un enfriamiento con hielo, y se agitó la mezcla a 0°C durante 15 minutos. Se añadió yoduro de metilo (0,07 ml, 1,1 mmol) a la solución de reacción, y se agitó la solución a 0°C durante una hora. Luego, se añadieron hidruro de sodio (55%, oleaginoso, 0,06 g, 1,3 mmol) y yoduro de metilo (0,07 ml, 1,1 mmol) a la solución de reacción y se agitó la mezcla de solución a 0°C durante 2 horas. Se añadió agua a la solución de reacción y se realizó una extracción con acetato de etilo. Se lavó el material extraído con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. Se concentró la solución de reacción bajo presión reducida y se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 5:1 → acetato de etilo). Tras concentrar el producto purificado bajo presión reducida, se añadió una solución de ácido clorhídrico 4N/acetato de etilo a una solución en acetato de etilo del residuo. Se obtuvo la materia insoluble precipitada mediante filtración, obteniéndose clorhidrato de *N*--{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}-*N*-metilacetamida (325 mg). Punto de fusión: 230,0-234,0°C (descompuesto)

- 50 Ejemplo 10 (Referencia)

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

- 55 Se añadieron formalina (37%, 0,29 ml, 3,9 mmol) y cianoborohidruro de sodio (0,21 g, 3,1 mmol) a una solución en metanol (6 ml) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil (0,32 g, 0,78 mmol) bajo un enfriamiento con hielo, y se agitó la mezcla a 0°C durante 15 minutos. A la solución de reacción, se añadió ácido acético (0,18 ml, 3,1 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante una hora. Se añadió una solución acuosa de carbonato de potasio a la solución de reacción bajo un enfriamiento con hielo, y se realizó la extracción con acetato de etilo. Se secó el material extraído sobre sulfato de magnesio. Se concentró la solución de reacción bajo presión reducida y se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 11:1→ 3:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida. Se añadió una solución de ácido clorhídrico 4N/acetato de etilo a una solución del residuo en solución de acetato de etilo, y se obtuvo la materia insoluble precipitada mediante filtración, obteniéndose clorhidrato de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-*N,N*-dimetil-3-metoxi-5-metilfenil (137 mg) en forma de polvo blanco.

Punto de fusión: 234,5-240,5°C (descompuesto)

Ejemplo 11:

Síntesis de clorhidrato de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3,9-dihidro-2*H*-benzo[1,4]oxazina

5 Se suspendió hidruro de litio y aluminio (86 mg, 2,3 mmol) en THF (20 ml). A esta solución, se añadió una solución en THF (10 ml) de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3,4-dihidro-2*H*-benzo[1,4]oxazin-3-ona (0,8 g, 1,9 mmol) en gotas bajo una atmósfera de argón. Tras finalizar la adición de las gotas, se sometió la mezcla de solución a reflujo con calentamiento durante una hora. Se añadieron agua (0,1 ml), solución acuosa de hidróxido de sodio al 15% (0,1 ml) y agua (0,3 ml) a la mezcla de reacción con enfriamiento con hielo y se agitó. Se retiró la materia insoluble por filtración en cerita y se concentró el filtrado bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano:metanol = 4:20:1) y se concentró bajo presión reducida. Se disolvió el residuo en acetato de etilo (10 ml) y se añadió una solución (0,34 ml) de ácido clorhídrico 1*N*/etanol al mismo, y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 15 minutos. Se obtuvo la materia insoluble precipitada mediante filtración, se lavó con acetato de etilo y se secó, obteniéndose clorhidrato de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3,4-dihidro-2*H*-benzo[1,4]oxazina (0,11 g) en forma de sólido blanco. Punto de fusión: 207,9-208,8°C

Ejemplo 12

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

20 El compuesto del título se obtuvo usando 7-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3,4-dihidro-2*H*-benzo[1,4]oxazin-3-ona de la misma manera que en el Ejemplo 11. Sólido marrón claro (acetato de etilo). Punto de fusión: 214,0-215,9°C.

Ejemplo 13

Síntesis de clorhidrato de 7-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-9-metil-3,4-dihidro-2*H*-benzo(1,4)oxazina

30 Se añadieron formalina (37%, 0,22 ml, 2,7 mmol) y cianoborohidruro de MP (2,41 mmol)/g, 1,12 g, 2,7 mmol) a una solución en metanol (15 ml) de 7-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3,4-dihidro-2*H*-benzo[1,4]oxazina (0,30 g, 0,67 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante una noche. Se retiró la materia insoluble por filtración y se concentró el filtrado bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano:metanol = 1:0→50:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se disolvió el residuo en acetato de etilo (15 ml), y se añadió al mismo una solución (0,64 ml) de ácido clorhídrico 1*N*/etanol. Se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 15 minutos. Se obtuvo la materia insoluble precipitada mediante filtración, se lavó con acetato de etilo y se secó, obteniéndose clorhidrato de 7-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-4-metil-3,4-dihidro-2*H*-benzo[1,4]oxazina (0,23 g) en forma de sólido marrón claro. Punto de fusión: 248,1-249,6°C.

Ejemplo 14

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

50 Se enfrió sobre hielo una solución en THF (20 ml) de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metilquinazolina (0,25 g, 0,58 mmol). A esta solución, se añadió una solución en THF (5 ml) de hidruro de litio y aluminio (26 mg, 0,69 mmol) en gotas bajo una atmósfera de argón. Tras finalizar la adición de las gotas, se agitó la solución hasta la temperatura ambiente durante 20 minutos y se sometió a reflujo con calentamiento durante una hora. Se añadieron agua (0,03 ml), solución acuosa de hidróxido de sodio al 15% (0,03 ml) y agua (0,1 ml) a la solución de reacción bajo enfriamiento con hielo, y se agitó. Se retiró la materia insoluble por filtración en cerita y se concentró el filtrado bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano:metanol = 1:0 →25:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se disolvió el residuo en acetato de etilo (5 ml). A esto, se añadió una solución (0,189 ml) de ácido clorhídrico 1*N*/etanol y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 15 minutos. Se obtuvo la materia insoluble precipitada mediante filtración, se lavó con acetato de etilo y se secó, obteniéndose clorhidrato de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinazolin-4-ol (87 mg) en forma de sólido blanco. EM: 438 (M⁺).

65 Se pasó a través de la columna de cromatografía en columna sobre gel de sílice una solución eluyente de diclorometano/metanol (10:1). Se concentró el eluido bajo presión reducida y luego se disolvió el residuo en acetato de etilo (5 ml). A esto, se añadió una solución (0,226 ml) de ácido clorhídrico 1*N*/etanol y se agitó la mezcla a temperatura

ambiente durante 15 minutos. Se obtuvo la materia insoluble precipitada mediante filtración, se lavó con acetato de etilo y se secó, obteniéndose clorhidrato de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxil-3-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinazolina (49 mg) en forma de sólido blanco.

5 Punto de fusión: 203,1-204,4°C

Ejemplo 15

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

10

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

15

20

Los compuestos enumerados en las siguientes Tablas 4 a 30 se produjeron usando las sustancias iniciales apropiadas de las mismas maneras que los Ejemplos de referencia 1 a 36 o los Ejemplos 1 a 15 y 145 a 161.

25

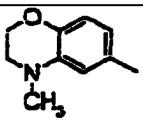
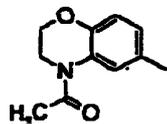
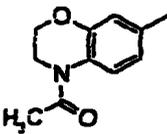
En las siguientes tablas, los compuestos con propiedades físicas tales como la forma cristalina, el p.f. (punto de fusión), sal, RMN de ¹H y EM (espectro de masas) se prepararon realmente.

30

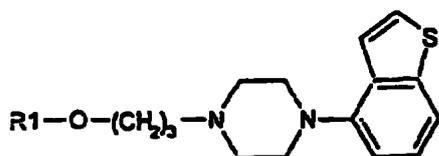
[Tabla 4]

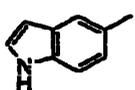
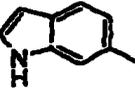
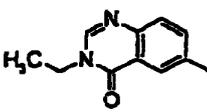
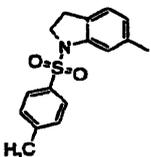
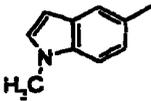
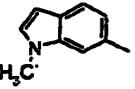
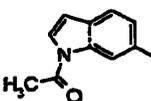
Ejemplo	R1	Forma del cristal (disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
16		Polvo blanco (acetato de etilo)	149-150	-
17		Polvo rosa claro (acetato de etilo)	161-163	-
18		Sólido blanco (acetato de etilo)	226,8-229,0	Clorhidrato
19		Sólido blanco (acetato de etilo)	213,1-218,5	-
20		Sólido blanco (acetato de etilo)	252,9-254,3	Clorhidrato

(Continuación)

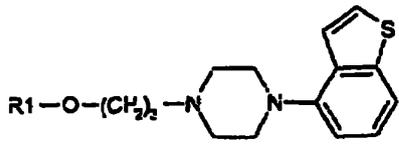
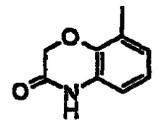
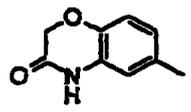
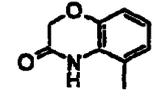
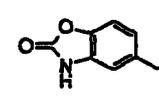
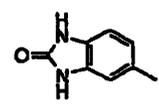
Ejemplo	R1	Forma del cristal (disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
21		Sólido blanco (acetato de etilo)	238,7-239,9	Clorhidrato
22		Sólido blanco (acetato de etilo)	238,6-220,4	Clorhidrato
23		Sólido marrón claro (acetato de etilo)	218,4-220,4	Clorhidrato

[Tabla 5]

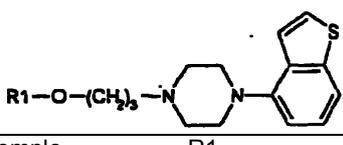
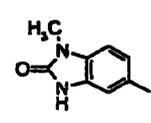
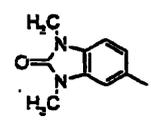
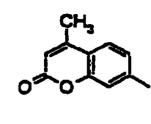
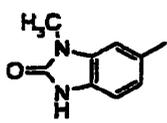


Ejemplo	R1	Forma del cristal (disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
24		Sólido blanco (acetato de etilo)	267,0-271,0	Clorhidrato
25		Sólido blanco (acetato de etilo/hexano)	143,8-145,2	-
26		Sólido blanco (acetato de etilo)	250,6-252,1	Clorhidrato
27		Sólido blanco (acetato de etilo)	233,3-235,2	Clorhidrato
28		Sólido blanco (acetato de etilo)	255,1-256,6	Clorhidrato
29		Sólido blanco (acetato de etilo)	207,9-208,7	Clorhidrato
30		Sólido blanco (acetato de etilo)	214,5-216,8	Clorhidrato

[Tabla 6]

Ejemplo	R1	RMN de H	Sal
			
31		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δ ppm 204-213 (2H, m), 2,65 (2H, t, J = 7,2 Hz), 2,73 (4H, sa), 3,19 (4H, sa), 4,15 (2H, t, J = 6,6 Hz), 4,67 (2H, s), 6,42 (1H, dd, J = 1,3; 8,0 Hz), 6,69 (1H, dd, J = 1,3; 8,3 Hz), 6,81-6,92 (2H, m), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,42 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,84 (1H, sa)	-
32		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ ppm: 1,80-2,00 (2H, m), 2,45-2,55 (2H, m), 2,55-2,65 (4H, sa), 3,00-3,10 (4H, sa), 3,93 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,47 (2H, s), 6,45-6,55 (2H, m), 6,80-6,90 (2H, m), 7,26 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,38 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,60 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,67 (1H, d, J = 5,5 Hz), 10,59 (1H, s)	-
33		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 2,06 (2H, quint, J = 6,5 Hz), 2,66 (2H, t, J = 6,9 Hz), 2,70-2,80 (4H, m), 3,20-3,25 (4H, m), 4,12 (2H, t, J = 6,1 Hz), 4,60 (2H, s), 6,55-6,70 (2H, m), 6,88 (1H, d, J = 8,3 Hz), 6,91 (1H, d, J = 8,3 Hz), 7,20-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,1 Hz), 8,43 (1H, sa)	-
34		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) ppm 1,80-1,90 (2H, m), 2,41 (2H, t, J = 6,6 Hz), 2,50-2,55 (4H, m), 2,95-3,00 (4H, m), 3,88 (2H, t, J = 6,7 Hz), 6,47 (1H, dd, J = 2,4; 8,6 Hz), 6,70 (1H, d, J = 2,4 Hz), 6,85 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,09 (1H, d, J = 8,6 Hz), 7,27 (1H, dd, J = 7,9; 7,9 Hz), 7,38 (1H, d, J = 5,6 Hz), 7,60 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,67 (1H, d, J = 5,6 Hz), 9,46 (1H, sa)	-
35		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ ppm: 1,88 (2H, t, J = 6,8 Hz), 2,50-2,55 (2H, m), 2,60 (4H, sa), 3,06 (4H, sa), 3,95 (2H, t, J = 6,4 Hz), 6,45-6,55 (2H, m), 6,78 (1H, d, J = 9,1 Hz), 6,88 (1H, d, J = 7,7 Hz), 7,26 (1H, dd, J = 7,8; 7,8 Hz), 7,39 (1H, d, J = 5,6 Hz), 7,55-7,70 (2H, m), 10,35 (1H, sa), 10,49 (1H, sa)	-

[Tabla 7]

Ejemplo	R1	RMN	Sal
			
36		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ ppm: 2,20-2,30 (2H ₁ , m), 2,45-2,55 (2H, m), 3,00-3,80 (11H, m), 4,06 (2H, t, J = 3,9 Hz), 6,60-6,70 (2H, m), 6,90-7,00 (2H, m), 7,33 (1H, dd, J = 7,9; 7,9 Hz), 7,50 (1H, d, J = 5,3 Hz), 7,71 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,78 (1H, d, J = 5,5 Hz), 10,67 (1H, sa), 10,81 (1H, sa)	Diclorhidrato
37		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 2,00-2,10 (4H, m), 270-285 (6H, m), 3,20-3,25 (4H, m), 3,40 (6H, s), 4,097 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,61 (1H, d, J = 2,2 Hz), 6,68 (1H, dd, J = 2,3; 8,4 Hz), 6,25 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,92 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,25-7,35 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,57 (1H, d, J = 8,0 Hz)	-
38		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ ppm: 2,25-2,35 (2H, m), 2,40 (3H, s), 3,20-3,70 (10H, m), 4,22 (2H, t, J = 5,9 Hz), 6,22 (1H, s), 6,95-7,05 (3H, m), 7,31 (1H, dd, J = 7,9; 7,9 Hz), 7,49 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,65-7,80 (3H, m), 10,93 (1H, sa)	Clorhidrato
39		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 2,00-2,10 (2H, m), 2,60-2,70 (2H, m), 2,75 (4H, sa), 3,21 (4H, sa), 3,39 (3H, s), 4,05-4,15 (2H, m), 6,55-6,70 (2H, m), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 6,96 (1H, d, J = 8,5 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,1 Hz), 9,12 (1H, sa)	-

[Tabla 7-1]

Ejemplo	R1	RMN	Sal
40		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 2,10 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,70 (2H, t, J = 7,4 Hz), 2,77 (4H, sa), 3,22 (4H, sa), 3,80 (3H, s), 4,14 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,85-7,00 (3H, m), 7,25-7,35 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,56 (1H, d, J = 8,1 Hz) 7,68 (1H, d, J = 8,8 Hz), 7,77 (1H, s)	-
41		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 2,07 (2H, t, J = 7,0 Hz), 2,63 (2H, t, J = 7,2 Hz), 2,74 (4H, sa), 3,20 (4H, sa), 4,13 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,40 (2H, 9), 6,38 (1H, sa), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 6,97 (1H, s), 7,02 (1H, dd, J = 2,1; 8,4 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,78 (1H, d, J = 8,4 Hz)	-
42		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 2,07 (2H, t, J = 7,0 Hz), 2,66 (2H, t, J = 5,7 Hz), 2,74 (4H, sa), 3,17 (3H, s), 3,20 (4H, sa), 4,12 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,31 (2H, s), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 6,90-7,00 (2H, m), 7,25-7,30 (1H, m), 7,39 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,41 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,55 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,74 (1H, d, J = 8,4 Hz)	-

[Tabla 7-2]

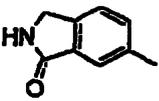
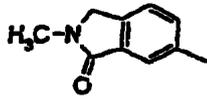
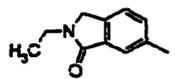
Ejemplo	R1	Forma del cristal (disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
43		Polvo blanco (metanol)	242-246	Clorhidrato

5

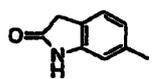
[Tabla 7-3]

Ejemplo	R1	RMN	Sal
44		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 2,08 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,69 (2H, t, J = 7,4 Hz), 2,76 (4H, sa), 3,21 (4H, sa), 3,62 (3H, s), 4,13 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,91 (1H, d, J = 6,3 Hz), 6,99 (1H, dd, J = 2,3; 8,7 Hz), 7,25-7,35 (3H, m), 7,39 (1H, d, J = 5,6 Hz), 7,43 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,81 (1H, s)	-

(Continuación)

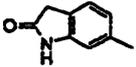
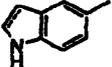
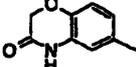
Ejemplo	R1	RMN	Sal
45		RMN de ^1H (CDCl_3) δ ppm: 2,00-2,10 (2H, m), 2,65 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,74 (4H, sa), 3,21 (4H, sa), 4,13 (2H, t, J = 6,4 Hz), 4,40 (2H, s), 6,84 (1H, sa), 6,91 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,16 (1H, dd, J = 2,3; 8,3 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (4H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz)	-
46		RMN de ^1H (CDCl_3) δ ppm 2,06 (2H, t, J = 7,2 Hz), 2,65 (2H, t, J = 7,3 Hz), 27,4 (4H, sa), 3,20 (7H, sa), 4,12 (2H, t, J = 6,4 Hz), 4,31 (2H, s), 6,91 (1H, d, J = 7,7 Hz), 7,10 (1H, dd, J = 2,4; 8,3 Hz), 7,25-7,35 (2H, m), 7,35 (1H, d, J = 2,3 Hz), 7,39 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,42 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz), 8,3	-
47		^1H -NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1,15 (3H, t, J = 7,3 Hz), 2,20-2,30 (2H, m), 3,15-3,30 (2H, m), 3,30-3,40 (4H, m), 3,45-3,70 (6H, m), 4,16 (2H, t, J = 5,8 Hz), 4,39 (2H, s), 6,97 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,10-7,25 (2H, m), 7,31 (1H, dd, J = 7,9; 7,9 Hz), 7,45-7,55 (2H, m), 7,69 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,76 (1H, d, J = 5,6 Hz), 10,74 (1H, sa)	Clorhidrato

[Tabla 8]

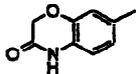
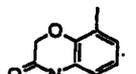
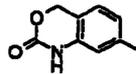
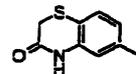
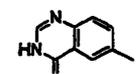
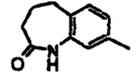
Ejemplo	R1	Forma del cristal (Disolvente de recrystalización)	Punto de fusión ($^{\circ}\text{C}$)	Sal
48		Polvo marrón rojizo (Acetonitrilo)	191-193	-

5

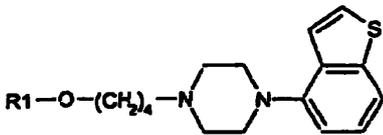
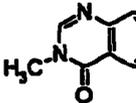
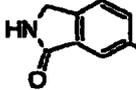
[Tabla 9]

Ejemplo	R1	Forma del cristal (Disolvente de recrystalización)	Punto de fusión ($^{\circ}\text{C}$)	Sal
49		Polvo marrón rojizo (Etanol)	215-217	Clorhidrato
50		Sólido blanco (Acetato de etilo)	209,2-210,9	Clorhidrato
51		Polvo blanco (Etanol)	211-213	Clorhidrato

(Continuación)

Ejemplo	R1	Forma del cristal (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
52		Polvo púrpura claro (Acetato de etilo)	180-182	-
53		Polvo rosa claro (Etanol)	170,2-171,9	-
54		Polvo blanco (Etanol/acetato de etilo)	253-258 (descompuesto)	Clorhidrato
55		Polvo blanco (2-propanol)	213,7-220,8 Clorhidrato 213,7-220,8	Clorhidrato
56		Sólido blanco (Acetato de etilo)	152,6-155,3	Clorhidrato
57		Polvo blanco (Etanol/acetato de etilo)	226-228	Clorhidrato

[Tabla 10]

				
Ejemplo	R1	Forma del cristal (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
58		Sólido blanco (Acetato de etilo)	238,8-241,8	Clorhidrato
59		Polvo blanco (Acetato de etilo/éter)	157-161	-

[Tabla 11]

Ejemplo	R1	RMN	Sal
60		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ ppm: 1,75-1,85 (2H, m), 1,90-1,95 (2H, m), 3,05 (3H, s), 3,15-3,35 (6H, m), 3,55-3,65 (4H, m), 4,08 (2H, t, J = 6,1 Hz), 4,36 (2H, s), 6,95 (1H, d, J = 7,7 Hz), 7,10-7,20 (2H, m), 7,30 (1H, dd, J = 7,9; 7,9 Hz), 7,45-7,50 (2H, m), 7,69 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,75 (1H, d, J = 5,5, Hz), 10,75 (1H, sa).	Diclorhidrato
61		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ ppm: 1,70-1,80 (2H, m), 1,85-2,00 (2H, m), 3,22 (3H, s), 3,15-3,35 (6H, m), 3,45-3,60 (4H, m), 3,95 (2H, t, J = 6,1 Hz), 6,60-6,65 (2H, m), 6,90-7,00 (2H, m), 7,30 (1H, dd, J = 7,9, 7,9 Hz), 7,45-7,50 (1H, m), 7,68 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,75 (1H, d, J = 5,5 Hz), 10-82 (1H, s), 11,31 (1H, sa).	Clorhidrato
62		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 1,52 (6H, s), 1,60-1,90 (4H, m), 2,53 (2H, t, J = 7,3 Hz), 270-2,80 (4H, m), 3,10-3,30 (4H, m), 3,97 (2H, t, J = 6,0 Hz), 6,37 (1H, d, J = 2,7 Hz), 6,53 (1H, dd, J = 2,7; 8,8 Hz), 6,85-6,95 (2H, m), 7,25-7,35 (2H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,56 (1H, d, J = 8,0 Hz), 8,06 (1H, s)	-
63		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ ppm: 1,37 (3H, d, J = 6,7 Hz), 1,50-1,80 (4H, m), 2,41 (2H, t, J = 6,9 Hz), 2,55-2,85 (4H, sa), 3,90 (2H, t, J = 6,2 Hz), 4,51 (1H, c, J = 6,7 Hz), 6,45-6,50 (2H, m), 6,80-6,90 (2H, m), 7,25 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,38 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,59 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,67 (1H, d, J = 5,5 Hz), 10,53 (1H, s)	-
64		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 1,65-1,95 (4H, m), 2,53 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,70-2,75 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 4,08 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,61 (2H, s), 6,57 (1H, d, J = ε.3 Hz), 6,81 (1H, d, J = ε.3 Hz), 6,85-6,95 (2H, m), 7,20-7,35 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,80 (1H, sa)	-
65		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 1,60-1,88 (4H, m), 2,51 (2H, t, J = 7,5 Hz), 2,83-2,77 (4H, m), 3,13-3,25 (4H, m), 3,95 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,46 (2H, s), 5,28 (1H, sa), 6,25 (1H, d, J = 2,4 Hz), 6,50 (1H, dd, J = 8,4; 2,4 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,7 Hz), 6,92 (1H, d, J = 8,4 Hz), 7,27 (1H, dd, J = 7,8; 8,0 Hz), 7,38 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,41 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,51 (1H, sa), 7,54 (1H, d, J = 8,0 Hz)	-

[Tabla 12]

Ejemplo	R1	Forma del cristal (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
66		Polvo blanco (Acetato de etilo)	143-144	-

[Tabla 13]

Ejemplo	R1	RMN	Sal
67		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ ppm: 1,40-1,67 (2H, m), 1,73-1,90 (4H, m), 3,13-3,30 (6H, m), 3,52-3,62 (4H, m), 3,96-4,01 (2H, m), 4,54 (2H, a), 6,50 (1H, d, J = 7,7 Hz), 6,67 (1H, d, J = 7,3 Hz), 8,83-6,88 (1H, m), 6,96 (1H, d, J = 7,7 Hz), 7,28-7,34 (1H, m), 7,48 (1H, d, J = 5,6 Hz), 7,70 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,76 (1H, d, J = 5,6 Hz), 10,67 (1H, sa)	Clorhidrato
68		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ ppm: 1,40-1,60 (4H, m), 1,60-1,80 (2H, m), 2,35-2,45 (2H, m), 2,55-2,65 (4H, sa), 3,90 (2H, t, J = 6,4 Hz), 4,49 (2H, s), 6,45-6,55 (2H, m), 6,80-6,95 (2H, m), 7,28 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,40 (1H, d, J = 5,6 Hz), 7,62 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,69 (1H, d, J = 5,5 Hz), 10,61 (1H, s)	-
69		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 1,45-1,70 (4H, m), 1,80-1,90 (2H, m), 2,45-2,55 (2H, m), 2,65-2,75 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 4,05 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,61 (2H, s), 6,50-6,65 (2H, m), 6,65-6,95 (2H, m), 7,20-7,35 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,80 (1H, sa)	-

[Tabla 14]

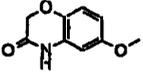
Ejemplo	R1	RMN	Sal
70		RMN de ¹ H (CDCl ₃) δ ppm: 2,73 (4H, m), 3,19-3,20 (6H, m), 4,56 (2H, s), 4,54-4,62 (2H, m), 5,76-5,92 (2H, m), 6,38 (1H, d, J = 2,7 Hz), 6,54 (1H, dd, J = 8,8; 2,7 Hz), 6,89-6,92 (2H, m), 7,25 (1H, m), 7,39-7,41 (2H, m), 7,53-7,56 (2H, m)	-

5

[Tabla 15]

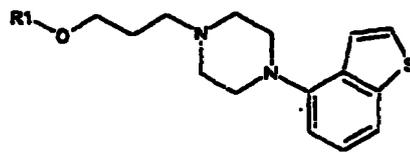
Ejemplo	R1	n	Forma del cristal (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
71		4	Polvo blanco (Acetonitrilo)	154-156	Diclorhidrato

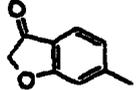
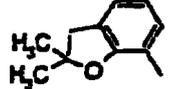
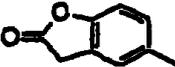
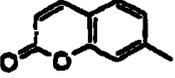
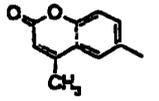
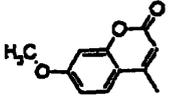
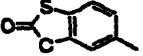
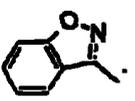
[Tabla 16]

Ejemplo	R1	n	Forma del cristal (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
72		4	Polvo blanco (Etanol/acetato de etilo)	220-225	Diclorhidrato

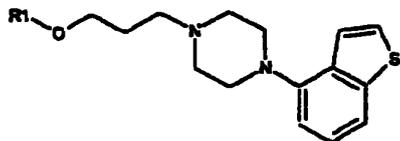
[Tabla 17]

5



Ejemplo	R1	EM (M+1)
73		409
74		423
75		409
76		421
77		435
78		451
79		427
80		394

[Tabla 18]

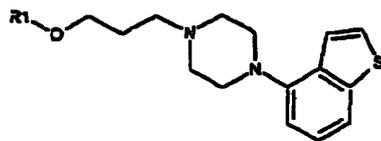


Ejemplo	R1	EM (M+1)
81		395
82		450
83		436
84		410
85		424
86		424
87	-2-BENZTIAZOLILO	410



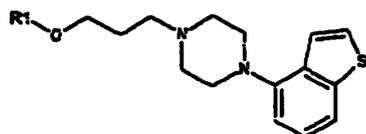
[Tabla 19]

89		440
90		451
91		465



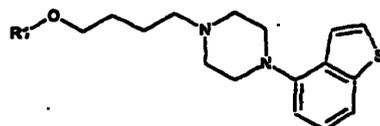
Ejemplo	R1	EM (M+1)
		465
93		436
94		450
95		436
96		438
97		452
98		438
99		438
100		479
101		451

[Tabla 20]



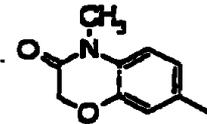
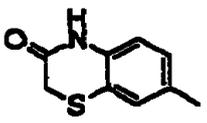
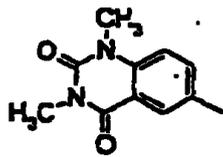
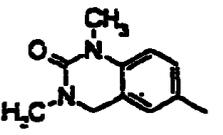
Ejemplo	R1	EM (M+1)
102		465
103		479
104		450
105		443

[Tabla 21]

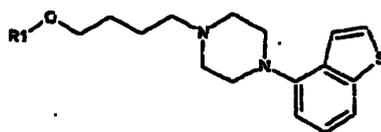


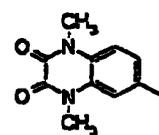
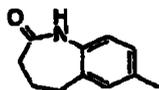
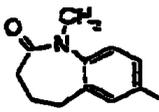
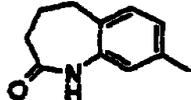
Ejemplo	R1	EN (M+1)
106		464
107		450
108		424
109		438
110		438

(Continuación)

Ejemplo	R1	EN (M+1)
111		452
112		454
113		479
114		465

[Tabla 22]



Ejemplo	R1	EM (M+1)
115		479
116		450 464
117		464
118		450

(Continuación)

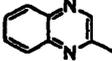
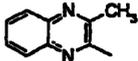
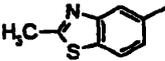
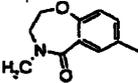
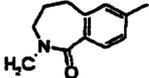
Ejemplo	R1	EM (M+1)
119		466
120		465
121		493
122		479
123		493
124 5		464

[Tabla 23]

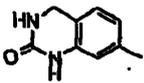
5

Ejemplo	R1	Forma del cristal (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
125		Polvo blanco (Acetato de etilo/hexano)	115	-
126		Polvo marrón claro (Etanol)	134,7	-

[Tabla 24]

$\text{R1-O-(CH}_2\text{)}_3\text{-N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{C}_6\text{H}_4\text{-S} \end{array}$				
Ejemplo	R1	Forma del cristal (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
127		Polvo blanco (Etanol)	131,3	-
128		Polvo blanco (Etanol)	107,1	-
129		Polvo blanco (Acetato de etilo)	231,3-232,8	Clorhidrato
130		Polvo blanco (Acetato de etilo)	218,9-221,0	Clorhidrato
131		Polvo blanco (Acetato de etilo)	259,0-260,2	Clorhidrato

[Tabla 25]

$\text{R1-O-(CH}_2\text{)}_3\text{-N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{C}_6\text{H}_4\text{-S} \end{array}$				
Ejemplo	R1	Punto de fusión (°C)	Sal	
132		RMN de ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,89-2,13 (21H, m), 2,52-2,83 (GH, m), 3,03-3,33 (4H, m), 4,01 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,46 (2H, sa), 5,30 (1H, sa), 6,51 (1H, dd, J = 6,3; 2,3 Hz), 6,83-6,96 (21H, m), 7,19-7,45 (3H, m), 7,18 (1H, sa), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz).	Fimarata	

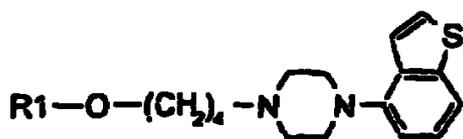
[Tabla 26]

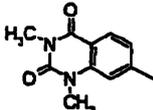
$\text{R1-O-(CH}_2\text{)}_4\text{-N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{C}_5\text{H}_4\text{S} \end{array}$				
Ejemplo	R1	Forma del cristal (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
133		Polvo blanco (Acetato de etilo)	230,2-231,5	Clorhidrato
134		Polvo blanco (Acetato de etilo)	207,4-209,6	Clorhidrato

[Tabla 27]

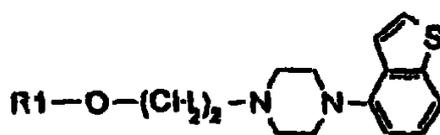
$\text{R1-O-(CH}_2\text{)}_4\text{-N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{C}_5\text{H}_4\text{S} \end{array}$				
Ejemplo	R1	Forma del cristal (Disolvente de recristalización)	Punto de fusión (°C)	Sal
135		Polvo blanco (Acetato de etilo)	213,8-215,2	Clorhidrato
136		Polvo blanco (Acetato de etilo)	217,0-218,0	Clorhidrato
137		Polvo blanco (Acetato de etilo)	231,6-239,9	Clorhidrato
138		Polvo amarillo claro (Etanol)	135,7	-
139		Polvo marrón claro (Etanol)	238,1-240,1	Clorhidrato
140		Polvo blanco (Etanol)	210,4	Clorhidrato
141		Polvo blanco (Etanol)	94,1	-

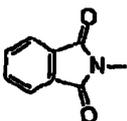
[Tabla 28]



Ejemplo	R1	RMN	Sal
142		RMN de 1H (CDCl ₃) δ ppm: 1,72-1,83 (2H, m), 1,83-1,98 (2H, m), 2,48-2,59 (2H, m), 2,64-2,81 (4H, m), 3,12-3,28 (4H, m), 3,46 (3H, s), 3,58 (3H, s), 4,13 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,62 (1H, d, J = 2,1 Hz), 6,80 (1H, dd, J = 8,8; 2,1 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,20-7,31 (1H, m), 7,35-7,43 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz), 8,15 (1H, d, J = 8,8 Hz).	-

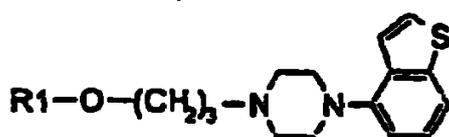
[Tabla 29]

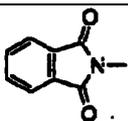


Ejemplo	R1	RMN
143		RMN de 1H (CDCl ₃) δ ppm: 2,70-2,87 (4H, m), 2,95 (2H, t, J = 5,1 Hz), 2,99-3,14 (1H, m), 4,42 (2H, t, J = 5,1 Hz), 6,78 (1H, dd, J = 0,6 Hz, 7,6 Hz), 7,18-7,30 (1H, m), 7,38 (2H, s), 7,54 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,69-7,80 (2H, m), 7,60-7,89 (2H, m).

5

[Tabla 30]



Ejemplo	R1	RMN
144		RMN de 1H (CDCl ₃) δ ppm: 1,95-2,13 (2H, m), 2,65-2,83 (6H, m), 3,09-3,27 (4H, m), 4,33 (2H, t, J = 6,4 Hz), 6,89 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,20-7,32 (1H, m), 7,40 (1H, dd, J = 5,6 Hz, 9,0 Hz), 7,64 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,71-7,80 (2H, m), 7,80-7,90 (2H, m).

Ejemplo 145 (Referencia)

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

10

Se añadió paladio soportado sobre carbono al 5% (0,8 g) a una solución en etanol (30 ml) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-N-etil-3-nitrobenzamidato (1,0 g, 2,1 mmol) y se sometió la mezcla a una reducción catalítica a temperatura ambiente bajo una presión normal. Se retiró el catalizador por filtración y se concentró el filtrado bajo presión reducida. Se añadió agua al residuo y se extrajo la solución con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano:metanol (30:1→20:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida, obteniéndose

15

3-amino-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-*N*-etil-benzamida (0,78 g, rendimiento del 83%) en forma de un sólido amorfo amarillo.

RMN de ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,23 (3H, t, J = 7,4 Hz), 2,00-2,15 (2H, m), 2,67 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,75 (4H, sa), 3,21 (4H, sa), 3,40-3,50 (2H, m), 3,50-4,30 (2H, sa), 4,13 (2H, t, J = 6,5 Hz), 5,99 (1H, sa), 6,80 (1H, d, J = 8,4 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,08 (1H, dd, J = 2,1; 8,3 Hz), 7,19 (1H, d, J = 2,1 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz).

Ejemplo 146 (Referencia)

10 Síntesis de clorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(1-acetilpiperidin-4-iloxi)propil]piperazina

Se añadió trietilamina (0,28 ml, 2,0 mmol) a una solución en diclorometano (15 ml) de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(piperidin-4-iloxi)propil]-piperazina (0,45 g, 1,25 mmol) y se enfrió la mezcla en un baño de hielo. A esto, se añadió acetilcloruro (0,1 ml, 1,4 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante una noche. Se añadió agua a la solución de reacción y luego se extrajo con diclorometano. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano:metanol = 30:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida. Al residuo, se añadió solución de clorhidrato 0,5N-metanol (3 ml). Se obtuvo el cristal producido mediante filtración y se secó, obteniéndose clorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(1-acetilpiperidin-4-iloxi)propil]piperazina en forma de polvo blanco (0,36 g, rendimiento del 66%).

Punto de fusión: 208-210°C

Ejemplo 147 (Referencia)

25 Síntesis de clorhidrato de 1-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]pirrolidin-2,5-diona

Se añadieron PS-trifenilfosfina (3 mmol/g, 1,80 g), di-*terc*-butilazodicarboxilato (1,27 g, 5,4 mmol) y *N*-hidroxisuccinimida (510 mg, 4,3 mmol) a una solución en THF (50 ml) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propanol (1,00 g, 3,6 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 4 horas. Se retiró la resina por filtración y se concentró el filtrado bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 1:2). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida, obteniéndose un sólido amorfo blanco (762 mg, rendimiento del 47%). Se disolvieron 157 mg del sólido amorfo blanco en etanol. A la solución, se añadió una solución de ácido clorhídrico 1N-etanol (0,42 ml) y luego se añadió éter. Se dejó reposar la solución en un refrigerador. Se filtró y secó el cristal producido, obteniéndose clorhidrato de 1-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-pirrolidin-2,5-diona (158 mg) en forma de polvo blanco.

Punto de fusión: 255,0-257,0°C

Ejemplo 148 (Referencia)

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

Se añadieron trietilamina (0,24 ml, 1,7 mmol) y cloroformiato de isobutilo (0,19 ml, 1,4 mmol) a una solución en acetonitrilo de ácido 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-naftalen-1-carboxílico (0,52 g, 1,2 mmol) bajo enfriamiento con hielo, y se agitó la mezcla durante 20 minutos. A la solución de reacción, se añadió agua con amoníaco al 28% (0,5 ml), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 20 minutos. A la solución de reacción, se añadió acetato de etilo y se lavó la solución con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 2:1 → 0:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se recristalizó el residuo en una mezcla disolvente de acetato de etilo-diisopropiléter, obteniéndose amida de ácido 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-naftalen-1-carboxílico (0,27 g, rendimiento del 53%) en forma de polvo blanco.

Punto de fusión 167,0-169,0°C

55 Ejemplo (Referencia).

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

Se añadió una solución de metanol y metilamina al 40% (5 ml) a una solución en metanol (5 ml) de etiléster de ácido 1-alquil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1*H*-pirazol-3-carboxílico (0,5 g, 1,1 mmol) y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 3 días. Se concentró la solución bajo presión reducida y se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 5:1 → 0:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se recristalizó el residuo en una mezcla disolvente de acetato de etilo-diisopropiléter, obteniéndose metilamida de ácido 1-alquil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1*H*-pirazol-3-carboxílico (0,32 g, rendimiento del 67%) en forma de polvo blanco.

Punto de fusión: 138,5-140,5°C

Ejemplo 150 (Referencia)

5 Síntesis de amida de ácido 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-ciclohexanecarboxílico

Se añadieron agua con amoníaco (28%, 0,5 ml), clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (WSC) (0,36 g, 1,9 mmol) y 4-dimetilaminopiridina (DMAP) (0,05 g, 0,4 mmol) a una solución de diclorometano (10 ml) de ácido 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-ciclohexanecarboxílico (0,5 g, 1,2 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 19 horas. A la solución de reacción, se añadió diclorometano y se lavó la mezcla con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 3:1 → 0:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se recristalizó el residuo en una mezcla disolvente de acetato de etilo-diisopropiléter, obteniéndose amida de ácido

15 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)-propoxi]-ciclohexanecarboxílico (0,1 g, rendimiento del 22%) en forma de polvo blanco.
Punto de fusión: 107,5-208,5°C

Ejemplo 151 (Referencia)

20 Síntesis de clorhidrato de (6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metil-fenil)amida de ácido etanosulfónico

Se enfrió sobre hielo una solución en diclorometano (4 ml) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenilamina (0,2 g, 0,49 mmol). A esto, se añadieron *N*-etilidiispropilazina (0,15 ml, 0,87 mmol) y sulfonilcloruro de etano (0,07 ml, 0,73 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante una hora. Luego, se añadieron *N*-etilidiispropilamina (0,15 ml, 0,87 mmol) y sulfonilcloruro de etano (0,07 ml, 0,73 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante una 19 horas. A esto, se añadió una solución acuosa de hidróxido de sodio 6N (0,5 ml) y etanol (2 ml), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante una noche. A la solución de reacción, se añadió diclorometano, que luego se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 2:1 → 0:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida. Se añadió al residuo una solución con clorhidrato 4N/acetato de etilo. Se filtró y secó el cristal generado, obteniéndose clorhidrato de {4-(3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi)-3-metoxi-5-metil-fenil}amida de ácido etanosulfónico (222 mg, rendimiento del 85%) en forma de polvo blanco.

35 Punto de fusión: 235,5-237,5°C

Ejemplo 152 (Referencia)

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

Se enfrió sobre hielo una solución en diclorometano (2 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1*H*-pirazol-3-il-amina (0,17 g, 0,47 mmol). A esto, se añadieron piridina (0,08 ml, 0,94 mmol) y metilcloroformiato (0,04 ml, 0,52 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante una 17 horas. A la solución de reacción, se añadió acetato de etilo y se lavó la mezcla de reacción con agua. Se extrajo la capa acuosa con acetato de etilo. Se combinaron las capas orgánicas, se secaron sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentraron bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 2:1 → 1:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se recristalizó el residuo en una mezcla disolvente de acetato de etilo-diisopropiléter, obteniéndose metiléster de ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxil-1-metil-1*H*-pirazol-3-il}carbámico (0,10 g, rendimiento del 51%) en forma de polvo blanco.

50 Punto de fusión: 162,5-165,0°C.

Ejemplo 153 (Referencia)

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

Se enfrió sobre hielo una solución en diclorometano (5 ml) de S-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1*H*-pirazol-3-il-amina (0,27 g, 0,73 mmol). A esto, se añadieron trietilamina (0,36 ml, 2,5 mmol), cloruro de dimetilcarbamoilo (0,20 ml, 2,1 mmol) y piridina (0,06 ml; 0,73 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante una noche. A la solución de reacción, se añadió agua y se extrajo la solución de reacción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 3:1 → 0:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se disolvió el residuo en acetato de etilo, y se añadió una solución de clorhidrato 4N/acetato de etilo al mismo. Se filtró y

secó el cristal producido, obteniéndose clorhidrato de 3-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-1,1-dimetil-urea (0,10 g, rendimiento del 30%) en forma de polvo amarillo claro.
Punto de fusión: 174,0-176,5°C

5

Ejemplo 154 (Referencia)

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

10 Se añadió una solución de dimetilamina acuosa (50%, 0,16 ml, 1,6 mmol) a una solución en DMF (3 ml) de feniléster de ácido 5-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butoxi]-1-metil-1*H*-pirazol-3-il-carbámico (0,26 g, 0,52 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 16 horas. Se añadió agua a la solución de reacción y luego se extrajo con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 7:3 → 0:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se disolvió el residuo en acetato de etilo.
15 Se añadió una solución de ácido clorhídrico 1N/etanol y se filtró y secó el cristal producido, obteniéndose clorhidrato de 3-(5-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butoxi]-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-1,1-dimetil-urea (95 mg, rendimiento del 37%) en forma de polvo blanco.
Punto de fusión: 186,0-187,5°C

20

Ejemplo 155 (Referencia)

Síntesis de *N*-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-2-metil-1*H*-pirazol-3-il}-acetamida

25 Se añadieron anhídrido acético (1 ml) y trietilamina (0,09 ml, 0,65 mmol) a una solución en diclorometano (4 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1*H*-pirazol-3-il-amina (0,20 g, 0,54 mmol), y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 6 horas. Se añadió una solución acuosa de carbonato de potasio a la solución de reacción, que luego se extrajo con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 2:1 → 0:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se
30 recrystalizó el residuo en una mezcla disolvente de acetato de etilo-diisopropiléter, obteniéndose *N*-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1*H*-pirazol-3-il}-acetamida (0,19 g, rendimiento del 89%) en forma de polvo blanco.
Punto de fusión: 137,0-139,0°C

35

Ejemplo 156 (Referencia)

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

40

En primer lugar, se añadió clorhidrato de 2-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzaldehído (1,28 g, 2,4 mmol) a una solución acuosa de clorhidrato de potasio. Se extrajo la mezcla con diclorometano. Se concentró la solución extraída bajo presión reducida y se disolvió el residuo en THF (15 ml). A la solución, se añadió borohidruro de sodio (0,05 g, 1,2 mmol) bajo un enfriamiento con hielo y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 3 horas. Después se añadió ácido clorhídrico al 10% a la mezcla bajo un enfriamiento con hielo para descomponer el reactivo presente en exceso. Tras añadir una solución acuosa de hidróxido de sodio 6N a la solución para convertirla en una solución alcalina, se extrajo con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano:acetato de etilo = 3:7 → diclorometano:metanol = 100:3). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se disolvió el residuo en etanol. Se añadió una solución de ácido clorhídrico 1N-etanol a esto. Se
45 recrystalizó el cristal producido en etanol, obteniéndose clorhidrato de 3-(4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-hidroximetil-5-metoxi-fenil)oxazolidin-2-ona (0,52 g, rendimiento del 41%) en forma de polvo blanco.
50 Punto de fusión: 224,0-253,0°C (descompuesto)

55

Ejemplo 157 (Referencia)

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

60

Se añadieron clorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-bromo-2-metoxi-6-metilfenoxi)propil]piperazina (0,5 g, 0,98 mmol), 1-acetil-piperazina (0,15 g, 1,2 mmol), acetato de paladio (11 mg, 0,048 mmol), 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo (BINAP) (63 mg, 0,098 mmol) y *t*-butóxido de sodio (0,23 g, 2,3 mmol) a tolueno (10 ml), y se agitó la mezcla bajo una atmósfera de argón a 90°C durante 22 horas. Se enfrió la mezcla de reacción hasta la temperatura ambiente y se filtró a través de cerita. Se lavó la torta filtrante con acetato de etilo. Se combinaron el filtrado y el líquido de lavado, y luego se concentraron bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante
65

5 cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 11:1 → 1:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se disolvió el residuo en acetato de etilo. Se añadió a esto una solución de ácido clorhídrico 1N/etanol y se filtró y secó el cristal producido, obteniéndose clorhidrato de 1-acetil-4-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}-piperazina (75 mg, 142, rendimiento) en forma de polvo blanco.

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

Ejemplo 158 (Referencia)

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

15 Se añadieron 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-yodo-2-metoxi-6-metil-fenoxi)-propil]-piperazina (0,6 g, 0,69 mmol), imidazol, (0,07 g, 1,03 mmol), yoduro de cobre (I) (13 mg, 0,069 mmol), trans-*N,N'*-dimetil-1,2-ciclohexanedimina (0,02 ml, 0,14 mmol) y carbonato de cesio (0,47 g, 1,38 mmol) a 1,4-dioxano (6 ml), y se sometió la mezcla a reflujo con calentamiento bajo una atmósfera de argón durante 50 horas. Tras enfriar la mezcla de reacción resultante hasta la temperatura ambiente, se añadió agua a la solución de reacción, que luego se extrajo con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 5:1 → 1:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se disolvió el residuo en acetato de etilo. Se añadió a esto una solución de ácido clorhídrico 1N/etanol, y se filtró y secó el cristal producido, obteniéndose diclorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-imidasol-1-il-2-metoxi-6-metilfenoxi)propil]-piperazina (60 mg, rendimiento del 17%) en forma de un polvo amarillo claro.

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

25 Ejemplo 159 (Referencia)

Síntesis de clorhidrato de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-*N*-dimetil-5-(2,2,2-trifluoroetoxi)benzamida de

30 Se añadieron carbonato de cesio (0,34 g, 0,99 mmol) y 1,1,1-trifluoro-2-yodoetano (0,05 ml, 0,47 mmol) a una solución en DMF (2 ml) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-hidroxi-5-*N*-dimetilbenzamida (188 mg, 0,39 mmol), y se agitó la mezcla 40°C durante 2 horas. Después, se añadió 1,1,1-trifluoro-2-yodoetano (0,1 ml; 0,94 mmol) y se agitó la mezcla a 40°C durante 5 horas. Tras enfriar la mezcla de reacción hasta la temperatura ambiente, se añadió agua a la solución de reacción, que luego se extrajo con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (*n*-hexano:acetato de etilo = 3:1 → 0:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se disolvió el residuo en alcohol isopropílico. Se añadió a esto una solución de ácido clorhídrico 1N/etanol y luego se concentró bajo presión reducida. Se recrystalizó el residuo en una mezcla disolvente de alcohol isopropílico/acetato de etilo, obteniéndose clorhidrato de 4-[3-(4-benzo[b]tiofan-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-*N*-dimetil-5-(2,2,2-trifluoro-etoxi)benzamida (88 mg, rendimiento del 40%) en forma de polvo amarillo claro.

Punto de fusión: 156,0-157,5°C

Ejemplo 160 (Referencia)

45 Síntesis de clorhidrato de 1{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1*H*-pirazol-3-il}-etanona

50 Se añadió clorhidrato de metoximetilamida de ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1*H*-pirazol-3-carboxílico (0,61 g, 1,3 mmol) a una solución acuosa de hidróxido de sodio, y se extrajo la mezcla de solución con diclorometano. Se concentró la solución extraída bajo presión reducida y se disolvió el residuo en THF (12 ml). Se enfrió la solución a -78°C y se añadió solución de éter de metiltilio 1N (1,2 ml) a la misma, y se agitó la mezcla a la misma temperatura durante 2 horas. A la solución de reacción, se añadió una solución acuosa de cloruro de amonio y se calentó la solución hasta la temperatura ambiente. Se añadió cloruro de potasio a la solución, que luego se extrajo con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano:acetato de etilo = 3:2→0:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se disolvió el residuo en etanol. Se añadió una solución de ácido clorhídrico 1N/etanol, y se recrystalizó el cristal producido en etanol que contenía agua, obteniéndose clorhidrato de 1-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxil-1-metil-1*H*-pirazol-3-il]-il}etanona (0,22 g, rendimiento del 40%) en forma de polvo blanco.

Punto de fusión: 245,0°C (descompuesto)

Ejemplo 161 (Referencia)

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

Se enfrió sobre hielo una solución en THF (8 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-(*terc*-butil-dimetilsilaniloximetil)-1-metil-1*H*-pirazol (0,75 g, 1,5 mmol), y se añadió a la misma una solución en THF 1M de fluoruro de tetrabutilamonio (1,7 ml). Se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 16 horas. A la solución de reacción, se añadió acetato de etilo, que luego se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo obtenido mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano:metanol = 1:0→30:1 →15:1). Se concentró el producto purificado bajo presión reducida y se recrystalizó el residuo en una mezcla disolvente de acetato de etilo-diisopropiléter, obteniéndose 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)-propoxi]-3-hidroximetil-1-metil-1*H*-pirazol (0,46 g, rendimiento del 79%) en forma de polvo blanco.

Temperatura de fusión: 123,5-126,0°C

Prueba farmacológica 1

15 1) Ensayo de unión al receptor de dopamina D₂

El ensayo se realizó según un procedimiento descrito por Kohler *et al.* (Kohler C, Hall H, Ogren SO y Gawell L, "Specific in vitro and in vivo binding of 3H-raclopride. A potent substituted benzamide drug with high affinity for dopamine D-2 receptors in the rat brain". *Biochem. Pharmacol.*, 1985; 34: 2251-2259).

Se decapitaron ratas macho Wistar, se recuperó el cerebro de inmediato y se extrajo el cuerpo estriado. Se homogenizó en tampón de tris(hidroximetil)ammonio (Tris)-ácido clorhídrico 50mM (pH 7,4) de un volumen 50 veces el peso del tejido, usando un homogenizador con una cuchilla giratoria de alta velocidad, y se centrifugó a 4°C, 48.000 xg durante 10 minutos. Se volvió a suspender el precipitado obtenido en el tampón anteriormente descrito de un volumen 50 veces el peso del tejido y, tras incubarlo a 37°C durante 10 minutos, se centrifugó en la condición anteriormente descrita. Se suspendió el precipitado obtenido en tampón de (Tris)-ácido clorhídrico 50mM (que contenía NaCl 120mM, KCl 5mM, CaCl₂ 2mM, MgCl₂ 1mM, pH 7,4) de un volumen 25 veces el peso del tejido y se conservó mediante congelación a -85°C, hasta que se usó para el ensayo de unión como muestra membranosa.

Se realizó el ensayo de unión usando 40 µl de muestra membranosa, 20 µl de [³H]-racloprida (concentración final de 1 a 2nM), 20 µl de un fármaco de prueba y tampón de (Tris) -ácido clorhídrico 50mM (que contenía NaCl 120mM, KCl 5mM, CaCl₂ 2mM, MgCl₂ 1mM, pH 7,4), de manera que la cantidad total fue de 200 µl (concentración final de dimetilsulfóxido del 1%). Se realizó la reacción a temperatura ambiente durante 1 hora y se finalizó realizando una filtración mediante succión con un cosechador celular sobre una placa filtrante de fibra de vidrio. Se lavó la placa filtrante de fibra de vidrio con tampón de Tris-ácido clorhídrico 50mM (pH 7,4) y tras secar, se añadió un cóctel de centelleo líquido de microplacas y se midió la radiactividad con un contador de centelleo de microplacas. La radiactividad en presencia de clorhidrato de (+)-butaclamol 10µM se consideró unión inespecífica.

Se calculó el valor de CI₅₀ a partir de una reacción dependiente de la concentración usando un programa de análisis no lineal. Se calculó el valor de K_i a partir del valor de CI₅₀ usando la fórmula de Cheng-Prussoff. Los resultados se muestran en la siguiente Tabla 31.

[Tabla 31]

Ensayo de unión al receptor de dopamina D ₂	
Compuesto de prueba	K _i (nM)
Compuesto del Ejemplo 19	2,4
Compuesto del Ejemplo 20	1,9
Compuesto del Ejemplo 35	1,0
Compuesto del Ejemplo 38	1,6
Compuesto del Ejemplo 44	1,1
Compuesto del Ejemplo 46	0,7
Compuesto del Ejemplo 49	0,4
Compuesto del Ejemplo 54	0,3
Compuesto del Ejemplo 63	0,4
Compuesto del Ejemplo 65	0,1
Compuesto del Ejemplo 83	3,3
Compuesto del Ejemplo 85	2,2
Compuesto del Ejemplo 95	1,9
Compuesto del Ejemplo 96	1,9
Compuesto del Ejemplo 103	2,1

2) Ensayo de unión al receptor de serotonina 5-HT_{2h}

5 El ensayo se realizó según un procedimiento descrito por Leysen J. E. *et al.* (Leysen J. E, Niemegeers C.J.E., Van Nueten J.M. y Laduron P. M. “[3H] Ketanserin (R 41 468), a selective 3H-ligand for serotonin 2 receptor binding sites”. *Mol. Pharmacol.*, 1982, 21: 301-314).

10 Se decapitaron ratas macho Wistar, se recuperó el cerebro de inmediato y se extrajo la corteza frontal. Se homogenizó en sacarosa 0,25M de un volumen 10 veces el peso del tejido, usando un homogenizador de vidrio de Teflón y se centrifugó a 4°C, 1.000 xg durante 10 minutos. Se transfirió el sobrenadante obtenido a otro tubo de centrifugación y se suspendió en sacarosa 0,25M de un volumen 5 veces el peso del tejido y se centrifugó el precipitado en las condiciones anteriormente descritas. Se combinó el sobrenadante obtenido con el sobrenadante obtenido anteriormente y se ajustó hasta un volumen 40 veces el peso del tejido con tampón de Tris-ácido clorhídrico 50mM (pH 7,4), y se centrifugó a 4°C, 35.000 xg durante 10 minutos. Se volvió a suspender el precipitado obtenido en el tampón anteriormente descrito de un volumen 40 veces el peso del tejido y se centrifugó en las condiciones anteriormente descritas. Se suspendió el precipitado obtenido en el tampón anteriormente descrito de un volumen 20 veces el peso del tejido y se conservó mediante congelación a -85°C, hasta que se usó para el ensayo de unión como muestra membranosa.

20 Se realizó el ensayo de unión usando 40 µl de muestra membranosa, 20 µl de [³H]-ketanserina (concentración final de 1 a 3nM), 20 µl de un fármaco de prueba y tampón de (Tris)-ácido clorhídrico 50mM (pH 7,4), de manera que la cantidad total fue de 200 µl (concentración final de dimetilsulfóxido del 1%). Se realizó la reacción a 37°C durante 20 minutos y se finalizó realizando una filtración mediante succión con un cosechador celular sobre una placa filtrante de fibra de vidrio.

25 Se lavó la placa filtrante de fibra de vidrio con tampón de Tris-ácido clorhídrico 50mM (pH 7,4) y tras secar, se añadió un cóctel de centelleo líquido de microplacas y se midió la radiactividad con un contador de centelleo de microplacas. La radiactividad en presencia espiperona 10µM se consideró unión inespecífica.

30 Se calculó el valor de CI₅₀ a partir de una reacción dependiente de la concentración usando un programa de análisis no lineal. Se calculó el valor de K_i a partir del valor de CI₅₀ usando la fórmula de Cheng-Prussoff. Los resultados se muestran en la siguiente Tabla 32.

[Tabla 32]

35

Ensayo de unión al receptor de serotonina B-HT _{2h}	
Compuesto de prueba	K _i (nM)
Compuesto del Ejemplo 19	2,0
Compuesto del Ejemplo 20	2,3
Compuesto del Ejemplo 35	0,7
Compuesto del Ejemplo 38	3,7
Compuesto del Ejemplo 44	1,5
Compuesto del Ejemplo 46	1,4
Compuesto del Ejemplo 49	2,4
Compuesto del Ejemplo 54	4,7
Compuesto del Ejemplo 63	1,4
Compuesto del Ejemplo 65	2,4
Compuesto del Ejemplo 83	4,2
Compuesto del Ejemplo 85	2,3
Compuesto del Ejemplo 95	3,5
Compuesto del Ejemplo 96	2,0
Compuesto del Ejemplo 103	3,1

3) Ensayo de unión al receptor de adrenalina α₁

40 El ensayo se realizó según el procedimiento descrito por Groß G *et al.* (Groß G, Hanft G y Kolassa N. “Urapidil and some analogues with hypotensive properties show high affinities for 5-hidroxitryptamine (5-HT) binding sites of the 5-HT_{1A} subtype and for α₁-adrenoceptor binding sites”. *Naunyn-Schmiedeberg's Arch Pharmacol.*, 1987, 336: 597-601).

Se decapitaron ratas macho Wistar, se recuperó el cerebro de inmediato y se extrajo la corteza cerebral. Se homogenizó en tampón de Tris-ácido clorhídrico 50mM (NaCl 100mM, que contenía etilendiamino tetraacetato disódico dihidrogenado, pH 7,4) de un volumen 20 veces el peso del tejido, usando un homogenizador con una cuchilla giratoria de alta velocidad, y se centrifugó a 4°C, 80.000 xg durante 20 minutos. Se volvió a suspender el precipitado
 5 obtenido en el tampón anteriormente descrito de un volumen 20 veces el peso del tejido y, tras incubarlo a 37°C durante 10 minutos, se centrifugó en las condiciones anteriormente descritas. Se volvió a suspender el precipitado obtenido en el tampón anteriormente descrito de un volumen 20 veces el peso del tejido y se centrifugó en las condiciones anteriormente descritas. Se suspendió el precipitado obtenido en tampón de (Tris)-ácido clorhídrico 50mM (que contenía etilendiamino tetraacetato disódico dihidrogenado 1mM, pH 7,4) de un volumen 20 veces el peso del tejido y
 10 se conservó mediante congelación a -85°C, hasta que se usó para el ensayo de unión como muestra membranosa.

Se realizó el ensayo de unión usando 40 µl de muestra membranosa, 20 µl de [³H]-prazosina (concentración final de 0,2 a 0,5nM), 20 µl de un fármaco de prueba y tampón de Tris-ácido clorhídrico 50mM (que contenía EDTA 1mM, pH 7,4), de manera que la cantidad total fue de 200 µl (concentración final de dimetilsulfóxido del 1%). Se realizó la
 15 reacción a 30°C durante 45 minutos y se finalizó realizando una filtración mediante succión con un cosechador celular sobre una placa filtrante de fibra de vidrio.

Se lavó la placa filtrante de fibra de vidrio con tampón de Tris-ácido clorhídrico 50mM (pH 7,4) y tras secar, se añadió un cóctel de centelleo líquido de microplacas y se midió la radiactividad con un contador de centelleo de microplacas.
 20 La radiactividad en presencia de clorhidrato de fentolamina 10µM se consideró unión inespecífica.

Se calculó el valor de CI_{50} a partir de una reacción dependiente de la concentración usando un programa de análisis no lineal. Se calculó el valor de K_i a partir del valor de CI_{50} usando la fórmula de Cheng-Prusoff.

25 Prueba farmacológica 12

Actividad agonista parcial sobre el receptor de dopamina D_2 usando células de expresión del receptor D_2

Se evaluó la actividad agonista parcial sobre el receptor de dopamina D_2 determinando cuantitativamente el efecto
 30 inhibidor de la producción de AMP cíclico de un compuesto de prueba en células de expresión del receptor de dopamina D_2 en las que se había inducido la producción de adenosina 3',5'-monofosfato cíclico (AMP cíclico) mediante estimulación con forskolina.

Se cultivaron células de ovario de hámster chino/DHFR(-) que expresaban el receptor de dopamina D_2 recombinante
 35 humano en un medio de cultivo (medio de Dulbecco modificado por Iscove (medio de cultivo IMDM), suero bovino fetal al 10%, 50 U.I./ml de penicilina, 50 µg/ml de estreptomina, 200 µg/ml de genecitina, hipoxantina de sodio 0,1mM, timidina 16µM) a 37°C y dióxido de carbono al 5%. Se sembraron las células a 10^4 células/pocillo sobre una placa de microvaloración de 96 pocillos revestida con poli-L-lisina y se cultivaron bajo las mismas condiciones durante 2 días. Se lavó cada pocillo con 100 µl de un medio de cultivo (medio de cultivo IMDM, hipoxantina de sodio 0,1mM, timidina
 40 16µM). Se reemplazó el medio de cultivo por 50 µl de medio de cultivo (medio de cultivo de IMDM, ascorbato de sodio al 0,1%, hipoxantina de sodio 0,1mM, timidina 16µM) que tenía disuelto compuesto de prueba 3µM. Tras dejar una incubación a 37°C, dióxido de carbono al 5% durante 20 minutos, se reemplazó el medio de cultivo por 100 µl de medio de cultivo estimulante de forskolina (medio de cultivo de IMDM, ascorbato de sodio al 0,1%, hipoxantina de sodio 0,1mM, timidina 16µM, forskolina 10µM, 3-isobutil-1-metilxantina 500µM) que tenía disuelto compuesto de prueba
 45 3µM, y se incubó a 37°C, dióxido de carbono al 5%, durante 10 minutos. Tras retirar el medio de cultivo, se dispensaron 200 µl de solución acuosa de 1B de lisis (Amersham Bioscience, reactivo unido a un sistema de inmunoensayo enzimático de Biotrack con AMP cíclico), y se agitó durante 10 minutos. Se usó la solución acuosa de cada pocillo como muestra para la medición. Las muestras de medición diluidas por cuadruplicado se sometieron a la medición de la cantidad de AMP cíclico usando el sistema de inmunoensayo enzimático anteriormente descrito. Se calculó la
 50 proporción de inhibición del respectivo compuesto de prueba suponiendo del 100% la cantidad de AMP cíclico del pocillo al que no se había añadido compuesto de prueba. En este sistema analítico empírico, la dopamina que se usó como fármaco de control inhibió la cantidad de AMP cíclico hasta aproximadamente el 10% de la actividad máxima.

En el ensayo anteriormente descrito, se confirmó que los compuestos de análisis tenían actividad agonista parcial por
 55 el receptor de dopamina D_2 .

Ya que los compuestos de prueba tienen actividad agonista parcial hacia el receptor de dopamina D_2 , pueden estabilizar la neurotransmisión de la dopamina en condiciones normales en un paciente de esquizofrenia y, por
 60 consiguiente, presentan, por ejemplo, un efecto de mejora de las condiciones positivas y negativas, un efecto de mejora del deterioro cognitivo y efectos de mejora de otros síntomas sin provocar efectos secundarios.

Prueba farmacológica 3

Efecto inhibidor del comportamiento estereotipado inducido por la apomorfina en ratas

65 Como animales de prueba, se usaron ratas Wistar (macho, de seis-siete semanas de vida, Japan SLC, Inc). Se

suspendió un compuesto de prueba en goma arábica al 5% (solución salina fisiológica o agua) usando un mortero de ágata y se diluyó con el mismo disolvente cuando fue necesario.

5 Se mantuvieron los animales de prueba en ayunas durante una noche desde el día anterior. Se administró apomorfina (0,7 mg/kg) subcutáneamente (1 ml/kg) 1 hora después de la administración oral de cada compuesto de prueba (5 ml/kg). Se observó el comportamiento estereotipado durante 1 minuto respectivamente 20, 30 y 40 minutos después de la inyección de apomorfina.

10 Se cuantificó el comportamiento estereotipado de cada animal según las siguientes condiciones, y se sumó la puntuación calculada en tres puntos y se evaluó el efecto contra la apomorfina. Se usaron seis animales de prueba por cada grupo.

0: El aspecto de los animales es el mismo que el de las ratas tratadas con solución salina;

1: Olfateo discontinuo, actividad de exploración constante;

15 2: Olfateo continuo, actividad de exploración periódica;

3: Olfateo continuo, mordisqueo, roído o lamido discontinuo. Periodos muy breves de actividad locomotora;

4: Mordisqueo, roído o lamido continuos; sin actividad de exploración.

20 Se usó un sistema de análisis estadístico no clínico para todo el procesamiento estadístico. Se consideró la existencia de una diferencia relevante para los valores de probabilidad de significación inferiores a 0,05. Se analizó la diferencia de puntuación entre el grupo de administración del disolvente y el grupo de administración de cada compuesto de prueba usando la prueba de Wilcoxon para muestras independientes o el test de Steel. Además, se usó un análisis de regresión lineal para calcular el 50% de la dosis eficaz (intervalo de confianza del 95%).

25 Puesto que los compuestos de prueba mostraron un efecto inhibitor del comportamiento estereotipado inducido por la apomorfina, se confirmó que los compuestos de prueba tienen efecto antagonista contra el receptor D₂.

Prueba farmacológica 4

30 Efecto inhibitor del movimiento de cabeza inducido por la (±)D-2,5-dimetoxi-4-yodoanfetamina (DOI) en ratas

Como animales de prueba, se usaron ratas Wistar (macho, de seis-siete semanas de vida, Japan SLC, Inc). Se suspendió un compuesto de prueba en goma arábica al 5% (solución salina fisiológica o agua) usando un mortero de ágata y se diluyó con el mismo disolvente cuando fue necesario.

35 Se mantuvieron los animales de prueba en ayunas durante una noche desde el día anterior. Se administró DOI (5,0 mg/kg) subcutáneamente (1 ml/kg) 1 hora después de la administración oral de cada compuesto de prueba (5 ml/kg). Se contó el número de movimientos de cabeza durante 10 minutos inmediatamente después de la inyección de DOI. Se usaron seis animales de prueba por cada grupo.

40 Se usó un análisis estadístico no clínico para todo el procesamiento estadístico. Se consideró la existencia de una diferencia relevante para los valores de probabilidad de significación inferiores a 0,05. Se analizó la diferencia del número de movimientos de cabeza entre el grupo de administración del disolvente y el grupo de administración de cada compuesto de prueba usando el test t o la prueba de Dunnett. Además, se usó un análisis de regresión lineal para calcular el 50% de la dosis eficaz (intervalo de confianza del 95%).

45 Puesto que los compuestos de prueba mostraron un efecto inhibitor del movimiento de cabeza inducido por DOI, se confirmó que los compuestos de prueba tienen efecto antagonista contra el receptor de serotonina 5HT_{2A}.

Prueba farmacológica 5

50 Efecto inductor de la catalepsia en ratas

Como animales de prueba, se usaron ratas Wistar (macho, de seis-siete semanas de vida, Japan SLC, Inc). Se suspendió un compuesto de prueba en goma arábica al 5% (solución salina fisiológica o agua) usando un mortero de ágata y se diluyó con el mismo disolvente cuando fue necesario.

55 Se mantuvieron los animales de prueba en ayunas durante la noche desde el día anterior, y se realizó la observación de la catalepsia y la ptosis 1, 2, 4, 6 y 8 horas después de la administración oral de cada compuesto de prueba (5 ml/kg). Se usaron seis animales de prueba por cada grupo.

60 Se colocó una pata delantera de una rata en un borde de una pequeña caja de acero (anchura: 6,5 cm; profundidad: 4,0 cm; altura: 7,2 cm) (postura no natural) y cuando la rata mantuvo la postura durante más de 30 segundos, se consideró el caso como catalepsia positiva. Se realizó esta observación tres veces en cada punto y cuando se produjo al menos un caso positivo, se supuso que había catalepsia en el individuo.

65 Por consiguiente, se disoció el efecto de inducción de la catalepsia de un compuesto de prueba del efecto inhibitor del

comportamiento estereotipado inducido por la apomorfina, sugiriendo, por tanto, que la percepción del efecto secundario extrapiramidal en clínica sería bajo.

Prueba farmacológica 6

5 Medición de la actividad inhibidora de la absorción de la serotonina (5-HT) de un compuesto de prueba mediante sinaptosoma de cerebro de rata

10 Se decapitaron ratas macho Wistar, se recuperó el cerebro de inmediato y se diseccionó la corteza frontal, y se homogenizó en solución de sacarosa 0,32M de un peso 20 veces el peso del tejido usando un homogenizador de tipo Potter. Se centrifugó el homogenizado a 4°C, 1.000 xg durante 10 minutos, y se centrifugó más el sobrenadante obtenido a 4°C, 20.000 xg durante 20 minutos, y se suspendieron los sedimentos en un tampón de incubación (tampón de HEPES 20mM (pH 7,4) que contenía glucosa 10mM, cloruro sódico 145mM, cloruro potásico 4,5mM, cloruro de magnesio 1,2mM, cloruro de calcio 1,5mM) que se usó como fracción de sinaptosoma en bruto.

15 La reacción de absorción de 5-HT se realizó en un volumen de 200µl usando una placa de fondo redondo de 96 pocillos, y se usó un tampón de incubación que tras la reacción contenía pargilina (concentración final de 10µM) y ascorbato de sodio (concentración final de 0,2 mg/ml).

20 Se añadieron a cada pocillo tampón de incubación (recuento total), 5-HT sin marcar (concentración final de 10pM, recuento inespecífico) y el compuesto de prueba diluido (concentración final 300nM). Se añadió una décima parte de la cantidad del volumen final de la fracción de sinaptosoma y, tras preincubar a 37°C durante 10 minutos, se añadió solución de 5-HT marcada con tritio (concentración final 8nM) y se inició la reacción de absorción a 37°C. La duración de la absorción fue de 10 minutos y se terminó la reacción mediante una filtración al vacío a través de una placa de papel filtrante de fibra de vidrio de 96 pocillos, y tras lavar el papel filtrante con solución salina normal fría, se secó lo suficiente y se añadió Microscint0 (Perkin-Elmer) al filtro, y se midió la radiactividad restante sobre el filtro.

Se calculó la actividad inhibidora de la absorción de la serotonina (%) a partir de la radiactividad del recuento total como el 100%, del recuento inespecífico como el 0% y del recuento obtenido con el compuesto de prueba.

30 **% de inhibición de 5-HT (%) =**
100-[(recuento obtenido con el compuesto de prueba-recuento inespecífico (absorción del 0%))/(recuento total (absorción del 100%)-recuento inespecífico (absorción del 0%))] x 100

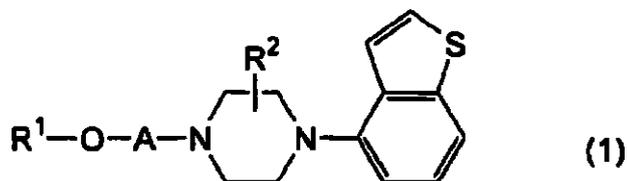
Ejemplos preparativos

35 Se mezclaron 100 g de un compuesto de la presente invención, 40 g de Avicel (nombre comercial, producto de Asahi Chemical Industry Co., Ltd.), 30 g de almidón de maíz y 2 g de estearato de magnesio, y se pulieron y comprimieron con una mano de mortero formando glicocalix R10 mm.

40 Se revistió el comprimido obtenido con una película usando un agente filmógeno que consistía en 10 g de TC-5 (nombre comercial, producto de Shin-Etsu Chemical Co., Ltd., hidroxipropilmetilcelulosa), 3 g de polietilenglicol 6000, 40 g de aceite de ricino y una cantidad apropiada de etanol, produciendo un comprimido revestido con una película de la composición anterior.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto heterocíclico o una de sus sales representado por la fórmula (1):



5 en la que R² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6;
 A representa un grupo alquileo C1-C6 o un grupo alquenileo C2-C6; y
 R¹ representa un grupo heterocíclico seleccionado de un grupo heterocíclico fusionado a benceno que tiene de 1 a 4
 10 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de
 azufre, y que se selecciona del grupo que consiste en (1) un grupo tetrahydroquinoxalinilo, (2) un grupo
 tetrahydroquinazolinilo, (3) un grupo dihydroquinazolinilo, (4) un grupo indolinilo, (5) un grupo indolilo, (6) un grupo
 isoindolinilo, (7) un grupo bencimidazolilo, (8) un grupo dihydrobencimidazolilo, (9) un grupo tetrahydrobenzazepinilo,
 15 (10) un grupo tetrahydrobenzodiazepinilo, (11) un grupo hexahydrobenzazocinilo, (12) un grupo dihydrobenzoxazinilo,
 (13) un grupo dihydrobenzoxazolilo, (14) un grupo bencisoxazolilo, (15) un grupo benzoxadiazolilo, (16) un grupo
 tetrahydrobenzoxazepinilo, (17) un grupo dihydrobenzotiazinilo, (18) un grupo benzotiazolilo, (19) un grupo
 benzoxatiolilo, (20) un grupo cromenilo, (21) un grupo dihydrobenzofurilo, (22) un grupo carbazolilo, (23) un grupo
 dibenzofurilo y (24) un grupo quinoxalinilo, en el que puede estar presente al menos un grupo seleccionado del grupo
 que consiste en los siguientes grupos (1) a (66) como sustituyente en el grupo heterocíclico representado por R¹:

- 20 (1) un grupo alquilo C1-C6,
 (2) un grupo alqueno C2-C6,
 (3) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno,
 (4) un grupo alcoxilo C1-C6,
 25 (5) un grupo ariloxilo,
 (6) un grupo alquiltio C1-C6,
 (7) un grupo alcoxilo C1-C6 sustituido con halógeno,
 (8) un grupo hidroxilo,
 (9) un grupo hidroxilo protegido,
 30 (10) un grupo hidroxialquilo C1-C6,
 (11) un grupo hidroxialquilo C1-C6 protegido,
 (12) un átomo de halógeno,
 (13) un grupo ciano,
 (14) un grupo arilo,
 35 (15) un grupo nitro,
 (16) un grupo amino,
 (17) un grupo amino que tiene uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo
 C1-C6, un grupo alcanilo C1-C6, un grupo alcocarbonilo C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo
 carbamoilo, un grupo alquilcarbamoilo C1-C6, un grupo aminoalcanoilo C1-C6, un grupo
 40 alcanilamin-C1-C6-alcanoilo C1-C6 y un grupo alcocarbonilamin C1-C6-alcanoilo C1-C6 como sustituyente,
 (18) un grupo alcanilo C1-C6,
 (19) un grupo arilsulfonilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 en el grupo arilo,
 (20) un grupo carboxilo,
 (21) un grupo alcocarbonilo C1-C6,
 45 (22) un grupo carboxialquilo C1-C6,
 (23) un grupo alcocarbonil C1-C6-alquilo C1-C6,
 (24) un grupo alcanilamin C1-C6-alcanoilo C1-C6,
 (25) un grupo carboxialqueno C2-C6,
 (26) un grupo alcocarbonil C1-C6-alqueno C2-C6,
 50 (27) un grupo carbamoil-alqueno C2-C6 que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que
 consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno como sustituyente,
 (28) un grupo carbamoilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en los
 siguientes grupos (i) a (1xxviii) como sustituyente:

- 55 (i) un grupo alquilo C1-C6,
 (ii) un grupo alcoxilo C1-C6,
 (iii) un grupo hidroxialquilo C1-C6,
 (iv) un grupo alcoxi C1-C6-alquilo C1-C6,
 (v) un grupo ariloxialquilo C1-C6,
 60 (vi) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno,

- (vii) un grupo aminoalquilo C1-C6 que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo aroílo y un grupo carbamoílo,
- 5 (viii) un grupo cicloalquilo C3-C8 que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6 y un grupo fenilalcoxilo C1-C6 como sustituyente,
- (ix) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con cicloalquilo C3-C8,
- (x) un grupo alqueno C2-C6,
- (xi) un grupo carbamoílalquilo C1-C6 que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo fenilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 y uno o varios grupos fenilo que puede tener uno o varios grupos alcoxilo C1-C6 como sustituyente,
- 10 (xii) un grupo alcoxicarbonil C1-C6-alquilo C1-C6,
- (xiii) un grupo furilalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 como sustituyente) en el grupo furilo,
- (xiv) un grupo tetrahidrofurilalquilo C1-C6,
- 15 (xv) un grupo 1,3-dioxolanilalquilo C1-C6,
- (xvi) un grupo tetrahidropiranilalquilo C1-C6,
- (xvii) un grupo pirrolilalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 como sustituyente en el grupo pirrolilo),
- (xviii) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con un grupo dihidropirazolilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
- 20 (xix) un grupo pirazolilalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 como sustituyente en el grupo pirazolilo),
- (xx) un grupo imidazolilalquilo C1-C6,
- (xxi) un grupo piridilalquilo C1-C6,
- 25 (xxii) un grupo pirazinilalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 como sustituyente en el grupo pirazínilo),
- (xxiii) un grupo pirrolidinilalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en uno o varios grupos oxo y un grupo alquilo C1-C6 como sustituyente en el grupo pirrolidinilo),
- (xxiv) un grupo piperidilalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo benzoílo y un grupo alcanóilo C1-C6 como sustituyente en el grupo piperídilo),
- 30 (xxv) un grupo piperazinilalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 como sustituyentes en el grupo piperazínilo),
- (xxvi) un grupo morfolinilalquilo C1-C6,
- (xxvii) un grupo tienilalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 como sustituyente en el grupo tienilo),
- 35 (xxviii) un grupo tiazolilalquilo C1-C6,
- (xxix) un grupo dihidrobenzofurilalquilo C1-C6,
- (xxx) un grupo benzopiranilalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos oxo como sustituyente en el grupo benzopiranilo),
- 40 (xxxi) un grupo bencimidazolilalquilo C1-C6,
- (xxxii) un grupo indolilalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos alcoxicarbonilo C1-C6 como sustituyentes en el grupo alquilo),
- (xxxiii) un grupo imidazolilalquilo C1-C6 que tiene de uno a varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo carbamoílo y un grupo alcoxicarbonilo C1-C6 en el grupo alquilo C1-C6,
- 45 (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxilo C1-C6 y un grupo alquiltio C1-C6-alquilo C1-C6 como sustituyente,
- (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo aroílo como sustituyente,
- 50 (xxxvi) un grupo piperídilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo aroílo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un átomo de halógeno como sustituyente,
- (xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
- 55 (xxxviii) un grupo hexahidroazepínilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
- (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener de uno a varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo aroílo y un grupo furilo como sustituyentes,
- (xl) un grupo tiazolilo,
- (xli) un grupo tiadiazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6,
- 60 (xli) un grupo isoxazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6,
- (xlili) un grupo indazolilo,
- (xliv) un grupo indolilo,
- (xlv) un grupo tetrahidrobenzotiazolilo,
- (xlvi) un grupo tetrahidroquinolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxilo C1-C6, un átomo de halógeno y un grupo oxo como sustituyente,
- 65

- (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6,
 (xlviii) un grupo benzodioxolilalquilo C1-C6,
 (xlix) un grupo arilo que puede tener uno o varios grupos como sustituyente seleccionados del grupo que
 5 consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo C1-C6; un grupo alcoxilo C1-C6; un grupo alquilo
 C1-C6 sustituido con halógeno; un grupo alcoxilo C1-C6 sustituido con halógeno; un grupo alqueno
 C2-C6; un grupo amino que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un
 grupo alcanoílo C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo alquilo C1-C6 y un grupo arilo; un grupo
 10 sulfamoílo; un grupo alquiltio C1-C6; un grupo alcanoílo C1-C6; un grupo alcoxycarbonilo C1-C6; un grupo
 pirrolilo; un grupo alquinilo C2-C6; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo ariloxilo; un grupo arilalcoxilo
 C1-C6; un grupo hidroxilo; a un grupo hidroxialquilo C1-C6; un grupo carbamoílo que puede tener uno o
 varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo arilo; un grupo
 pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo oxazolilo; un grupo
 15 imidazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6; un grupo dihidrofurilo que puede tener uno
 o varios grupos oxo; un grupo tiazolidinilalquilo C1-C6 que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo
 imidazolilalcanoílo C1-C6 y un grupo piperidinilcarbonilo,
 (1) un grupo cianoalquilo C1-C6,
 (li) un grupo dihidroquinolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en
 un grupo alquilo C1-C6 y un grupo oxo,
 (lii) un grupo alquilamino C1-C6 sustituido con halógeno,
 20 (liii) un grupo alquiltio C1-C6-alquilo C1-C6,
 (liv) un grupo amidino que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6,
 (lv) un grupo amidinoalquilo C1-C6,
 (lvi) un grupo alquenilo C2-C6-alquilo C1-C6,
 (lvii) un grupo arilamino que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste
 25 en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxilo C1-C6, un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno y un
 grupo alcoxilo C1-C6 sustituido con halógeno en el grupo arilo,
 (lviii) un grupo arilalqueno C2-C6,
 (lix) un grupo piridilamino que puede tener de uno o varios grupos alquilo C1-C6,
 (lx) un grupo arilalquilo C1-C6 (que puede tener en el grupo arilo y/o el grupo alquilo C1-C6 uno o varios
 30 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo
 alquilo C1-C6 sustituido con halógeno, un grupo alcoxilo C1-C6 sustituido con halógeno, un grupo alcoxilo
 C1-C6, un grupo carbamoílo y un grupo alcoxycarbonilo C1-C6 como sustituyente),
 (lxi) un grupo alquinilo C2-C6,
 (lxii) un grupo ariloxialquilo C1-C6 (que puede tener como sustituyente en el grupo arilo uno o varios grupos
 35 seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo C1-C6; un grupo carbamoílo que puede tener
 uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo C1-C6 y un grupo alquilo
 C1-C6; y un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo),
 (lxiii) un grupo isoxazolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (lxiv) un grupo dihidroindenilo,
 40 (lxv) un grupo arilalcoxi C1-C6-alquilo C1-C6,
 (lxvi) un grupo tetrahidropiranilo,
 (lxvii) un grupo azetidínilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un
 grupo alcanoílo C1-C6 y un grupo aroílo,
 (lxviii) un grupo azetidínalquilo C1-C6 que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que
 45 consiste en un grupo alcanoílo C1-C6 y un grupo aroílo,
 (lxix) un grupo tetrazolilo,
 (lxx) un grupo indolinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (lxxi) un grupo triazolilo que puede tener de uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en
 un grupo alquilo C1-C6 y un grupo alquiltio C1-C6,
 50 (lxxii) un grupo imidazolilo que puede tener uno o varios grupos carbamoílo,
 (lxxiii) un grupo oxazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6,
 (lxxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6,
 (lxxv) un grupo bencimidazolilo,
 (lxxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 55 (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener uno o varios grupos alcoxycarbonilo C1-C6, y
 (lxxviii) un grupo oxazolilalquilo C1-C6 que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6,
 (29) un grupo aminoalquilo C1-C6 que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en
 un grupo alquilo C1-C6, un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno, un grupo alcoxycarbonilo C1-C6, un
 60 grupo alcanoílo C1-C6, un grupo arilo, un grupo arilalquilo C1-C6, un grupo aroílo y un grupo aminoalquilo
 sustituido (que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 sustituyentes en el grupo amino) en el grupo amino,
 (30) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con un grupo carbamoílo que puede tener uno o varios grupos
 seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con
 halógeno,
 65 (31) un grupo tiocarbamoílo que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6,
 (32) un grupo sulfamoílo,

- (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo C1-C6,
 5 (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (36) un grupo imidazolilo,
 (37) un grupo triazolilo,
 (38) un grupo isoxazolilo,
 (39) un grupo piperidinilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo arilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo y un grupo amino que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6 y un grupo alcanóilamin C1-C6-alcanóilo C1-C6,
 10 (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxialquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo carboxialquilo C1-C6, un grupo alquilcarbamoil C1-C6-alquilo C1-C6, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxilo C1-C6, un grupo carboxilo, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo amino (en el que pueden estar presentes 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6 y un grupo aroilo), un grupo piperidinilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6 y un grupo aroilo), grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos alquilo C1-C6 como sustituyentes), un grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decilo, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos alquilo C1-C6 como sustituyente), un grupo piridilo, un grupo piridiloxilo, un grupo piridilalcoxilo C1-C6, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo arilalcoxilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxilo C1-C6 y un grupo alcoxilo C1-C6 sustituido con halógeno en el grupo arilo), un grupo arilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxilo C1-C6, un grupo hidroxilo), un grupo ariloxilo (que puede tener en el grupo arilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxilo C1-C6 y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno), un grupo arilalquilo C1-C6 (que puede tener en el grupo arilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxilo C1-C6 y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno) y un grupo aroilo (que puede tener en el grupo arilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxilo C1-C6),
 20 (41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener, como sustituyente, un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo hidroxialquilo C1-C6, un grupo carbamoilo, un grupo hidroxilo, un grupo amino (que puede tener, en el grupo amino, uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo aroilo), un grupo morfolinilalquilo C1-C6, un grupo pirrolidinilalquilo C1-C6, un grupo piperidilalquilo C1-C6, un grupo piperazinilalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 como sustituyentes en el grupo piperazinilo), un grupo aminoalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 como sustituyentes en el grupo amino), un grupo ariloxilo (que puede tener uno o varios grupos alcoxilo C1-C6 sustituidos con halógeno en el grupo arilo), un grupo ariloxialquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos alcoxilo C1-C6 sustituidos con halógeno en el grupo arilo) y un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos oxo),
 25 (42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos como sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo cicloalquilo C3-C8, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo hidroxialquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6-alquilo C1-C6, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo aminoalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 como sustituyentes en el grupo amino), un grupo piperidilalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 como sustituyentes en el grupo piperidilo), un grupo morfolinilalquilo C1-C6, un grupo pirrolidinilalquilo C1-C6, un grupo 1,3-dioxolanilalquilo C1-C6, un grupo tetrahydrofuralalquilo C1-C6, un grupo piridilalquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos fenilo como sustituyentes en el grupo alquilo C1-C6), un grupo imidazolilalquilo C1-C6, un grupo furilalquilo C1-C6, un grupo pirrolidinilcarbonilalquilo C1-C6, un grupo piperidilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 como sustituyentes, un grupo piridilo (que puede tener en el grupo piridilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en grupo alquilo C1-C6, un grupo ciano y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno como sustituyente), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo arilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo C1-C6), un grupo aroilo, un grupo furilcarbonilo, un grupo arilalcoxicarbonilo C1-C6 y un grupo oxo,
 30 (43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,
 (44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener de uno a varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo piridilo,
 35 (45) un grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener de uno o varios grupos alquilo C1-C6,
 (46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo,
 (47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo piperidilalquilo C1-C6 y un grupo arilo,
 40 (48) un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos arilo que pueden tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo C1-C6 y un grupo ciano,
 45
 50
 55
 60
 65

- (49) un grupo azabiciclo[3.2.2]nonilcarbonilo,
 (50) un grupo 8-azabiciclo[3.2.1]octilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos ariloxilo sustituidos o no sustituidos con halógeno,
 (51) un grupo indolinilcarbonilo,
 5 (52) un grupo tetrahidroquinolilcarbonilo,
 (53) un grupo tetrahidropirido[3,4-b]indolilcarbonilo,
 (54) un grupo morfolinilalquilo C1-C6,
 (55) un grupo piperazinilalquilo C1-C6 que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 en el grupo piperazinilo,
 10 (56) un grupo morfolinilcarbonilalquilo C1-C6,
 (57) un grupo piperazinilcarbonilalquilo C1-C6 que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 en el grupo piperazinilo,
 (58) un grupo oxo,
 (59) un grupo aminoalcoxilo C1-C6 que puede tener uno o varios grupos alquilo C1-C6 en el grupo amino,
 15 (60) un grupo alcoxi C1-C6-alcoxilo C1-C6,
 (61) un grupo piperazinilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo alcoxicarbonilo C1-C6,
 (62) un grupo morfolinilo,
 (63) un grupo 1,3,8-triazaspiro[4.5]decanilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo arilo,
 20 (64) un grupo tetrahidropiridilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos piridilo,
 (65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos tioxo y
 (66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decanilo.

2. El compuesto según la reivindicación 1, en el que R¹ representa un grupo heterocíclico seleccionado de un grupo heterocíclico fusionado a benceno que tiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre, y que se selecciona del grupo que consiste en (1) un grupo tetrahidroquinoxalinilo, (2) un grupo tetrahidroquinazolinilo, (3) un grupo dihidroquinazolinilo, (4) un grupo indolinilo, (5) un grupo indolilo, (6) un grupo isoindolinilo, (7) un grupo bencimidazolilo, (8) un grupo dihidrobencimidazolilo, (9) un grupo tetrahidrobenzazepinilo, (10) un grupo tetrahidrobenzodiazepinilo, (11) un grupo hexahidrobenzazocinilo, (12) un grupo dihidrobenzoxazinilo, (13) un grupo dihidrobenzoxazolilo, (14) un grupo bencisoxazolilo, (15) un grupo benzoxadiazolilo, (16) un grupo tetrahidrobenzoxazepinilo, (17) un grupo dihidrobenzotiazinilo, (18) un grupo benzotiazolilo, (19) un grupo benzoxatiolilo, (20) un grupo cromenilo, (21) un grupo dihidrobenzofurilo, (22) un grupo carbazolilo, (23) un grupo dibenzofurilo y (24) un grupo quinoxalinilo
 25 en el que, en el grupo heterocíclico representado por R¹, pueden estar presentes de 1 a 5 grupos seleccionados del grupo que consiste en los siguientes grupos (1) a (66) como sustituyente/s:

- (1) un grupo alquilo C1-C6,
 (2) un grupo alquenilo C2-C6,
 40 (3) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno,
 (4) un grupo alcoxilo C1-C6,
 (5) un grupo fenoxilo,
 (6) un grupo alquiltio C1-C6,
 (7) un grupo alcoxilo C1-C6 sustituido con halógeno,
 45 (8) un grupo hidroxilo,
 (9) un grupo fenilalcoxilo C1-C6,
 (10) un grupo hidroxialquilo C1-C6,
 (11) un grupo alcoxi C1-C6-alquilo C1-C6,
 (12) un átomo de halógeno,
 50 (13) un grupo ciano,
 (14) un grupo fenilo,
 (15) un grupo nitro,
 (16) un grupo amino,
 (17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo carbamoilo, un grupo alquilcarbamoilo C1-C6, un grupo aminoalcanoilo C1-C6, un grupo alcanóilamin-C1-C6-alcanoilo C1-C6 y un grupo alcoxicarbonilamino C1-C6-alcanoilo C1-C6 como sustituyente/s,
 55 (18) un grupo alcanóilo C1-C6,
 (19) un grupo fenilsulfonilo que puede tener un solo grupo alquilo C1-C6 en el grupo fenilo,
 (20) un grupo carboxilo,
 60 (21) un grupo alcoxicarbonilo C1-C6,
 (22) un grupo carboxialquilo C1-C6,
 (23) un grupo alcoxicarbonil C1-C6-alquilo C1-C6,
 (24) un grupo alcanóilamin C1-C6-alcanoilo C1-C6,
 (25) un grupo carboxialquenilo C2-C6,
 65 (26) un grupo alcoxicarbonil C1-C6-alquenilo C2-C6,
 (27) un grupo carbamoilalquenilo C2-C6 que puede tener 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un

grupo alquilo C1-C6 y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyente/s, (28) un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en los siguientes grupos (i) a (lxxviii) como sustituyente/s:

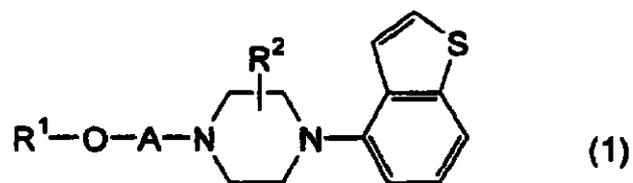
- 5 (i) un grupo alquilo C1-C6,
(ii) un grupo alcoxilo C1-C6,
(iii) un grupo hidroxialquilo C1-C6,
(iv) un grupo alcoxi C1-C6-alquilo C1-C6,
(v) un grupo fenoxialquilo C1-C6,
10 (vi) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno,
(vii) un grupo aminoalquilo C1-C6 que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo benzoílo y un grupo carbamoilo,
(viii) un grupo cicloalquilo C3-C8 que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo hidroxilo, un grupo alcocarbonilo C1-C6 y un grupo fenilalcoxilo C1-C6 como sustituyente/s,
15 (ix) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con cicloalquilo C3-C8,
(x) un grupo alqueno C2-C6,
(xi) un grupo alquilo C1-C6 que tiene de 1 a 2 grupos carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos como sustituyente/s seleccionado/s del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo fenilo que puede tener un solo grupo alquilo C1-C6 y un grupo fenilo que puede tener un solo grupo alcoxilo C1-C6,
20 (xii) un grupo alquilo C1-C6 que tiene de 1 a 2 grupos alcocarbonilo C1-C6,
(xiii) un grupo furilalquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 como sustituyente/s en el grupo furilo),
(xiv) un grupo tetrahidrofurilalquilo C1-C6,
25 (xv) un grupo 1,3-dioxolanilalquilo C1-C6,
(xvi) un grupo tetrahidropiranilalquilo C1-C6,
(xvii) un grupo pirrolilalquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 en el grupo pirrolilo como sustituyente/s),
(xviii) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con un grupo dihidropirazolilo que puede tener un solo grupo oxo,
30 (xix) un grupo pirazolilalquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6 como sustituyente/s en el grupo pirazolilo),
(xx) un grupo imidazolilalquilo C1-C6,
(xxi) un grupo piridilalquilo C1-C6,
(xxii) un grupo pirazinilalquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 3 (preferentemente, 1) grupos alquilo C1-C6 como sustituyente/s en el grupo pirazinilo),
35 (xxiii) un grupo pirrolidinilalquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo C1-C6 como sustituyente/s en el grupo pirrolidino),
(xxiv) un grupo piperidilalquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo benzoílo y un grupo alcanóilo C1-C6 como sustituyente/s en el grupo piperidilo),
40 (xxv) un grupo piperazinilalquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6 como sustituyente/s en el grupo piperazinilo),
(xxvi) un grupo morfolinilalquilo C1-C6,
(xxvii) un grupo tienilalquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6 como sustituyente/s en el grupo tienilo),
45 (xxviii) un grupo tiazolilalquilo C1-C6,
(xxix) un grupo dihidrobenzofurilalquilo C1-C6,
(xxx) un grupo benzopiranilalquilo C1-C6 (que puede tener un solo grupo oxo como sustituyente en el grupo benzopiranilo),
(xxxi) un grupo bencimidazolilalquilo C1-C6,
50 (xxxii) un grupo indolilalquilo C1-C6 que puede tener de 1 a 3 grupos alcocarbonilo C1-C6 en el grupo alquilo C1-C6),
(xxxiii) un grupo imidazolilalquilo C1-C6 que tiene de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcocarbonilo C1-C6 en el grupo alquilo C1-C6,
(xxxiv) un grupo piridilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxilo C1-C6 y un grupo alquilitio C1-C6-alquilo C1-C6 como sustituyente/s,
55 (xxxv) un grupo pirrolidino que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcocarbonilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo benzoílo como sustituyente/s,
(xxxvi) un grupo piperidino que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcocarbonilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo benzoílo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un átomo de halógeno como sustituyente/s en el grupo fenilo),
(xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener un solo grupo oxo,
(xxxviii) un grupo hexahidrozepinilo que puede tener un solo grupo oxo,
65 (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo fenilo y un grupo furilo como sustituyente/s,

- (xl) un grupo tiazolilo,
 (xli) un grupo tiadiazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6,
 (xlii) un grupo isoxazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6,
 (xliii) un grupo indazolilo,
 5 (xliv) un grupo indolilo,
 (xlv) un grupo tetrahydrobenzotiazolilo,
 (xlvi) un grupo tetrahydroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxilo C1-C6, un átomo de halógeno y un grupo oxo como sustituyente/s,
 10 (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6,
 (xlviii) un grupo benzodioxolilalquilo C1-C6,
 (xlix) un grupo fenilo que puede tener de 1 a 3 grupos como sustituyente/s seleccionado/s del grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo C1-C6; un grupo alcoxilo C1-C6; un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno; un grupo alcoxilo C1-C6 sustituido con halógeno; un grupo alqueno C2-C6; un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoílo C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo alquilo C1-C6 y un grupo arilo; un grupo sulfamoílo; un grupo alquiltio C1-C6; un grupo alcanoílo C1-C6; un grupo alcoxycarbonilo C1-C6; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo C2-C6; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo feniloxilo; un grupo fenilalcoxilo C1-C6; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxialquilo C1-C6; un grupo carbamoílo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo fenilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6; un grupo dihydrofurilo que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo tiazolidinilalquilo C1-C6 que puede tener dos grupos oxo; un grupo imidazolilalcanoílo C1-C6 y un grupo piperidinilcarbonilo,
 20 (l) un grupo cianoalquilo C1-C6,
 (li) un grupo dihydroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo oxo,
 (lii) un grupo alquilamino C1-C6 sustituido con halógeno,
 (liv) un grupo alquiltio C1-C6-alquilo C1-C6,
 30 (liv) un grupo amidino que puede tener un grupo alquilo C1-C6,
 (lv) un grupo amidinoalquilo C1-C6,
 (lvi) un grupo alquenoiloxi C2-C6-alquilo C1-C6,
 (lvii) un grupo fenilamino que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxilo C1-C6, un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno y un grupo alcoxilo C1-C6 sustituido con halógeno en el grupo fenilo,
 35 (lviii) un grupo fenilalqueno C2-C6,
 (lix) un grupo piridilamino que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6,
 (lx) un grupo fenilalquilo C1-C6 (que puede tener, como sustituyente/s, en el grupo fenilo y/o el grupo alquilo C1-C6 de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno, un grupo alcoxilo C1-C6 sustituido con halógeno, un grupo alcoxilo C1-C6, un grupo carbamoílo y un grupo alcoxycarbonilo C1-C6),
 40 (lxi) un grupo alquiltio C2-C6,
 (lxii) un grupo feniloxialquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo C1-C6, un grupo N-alcoxi C1-C6 alcoxi-N-alquilcarbamoílo C1-C6 y un grupo oxopirrolidinilo como sustituyente/s en el grupo fenilo),
 45 (lxiii) un grupo isoxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (lxiv) un grupo dihydroindenilo,
 (lxv) un grupo fenilalcoxi C1-C6-alquilo C1-C6,
 (lxvi) un grupo tetrahydropiranilo,
 50 (lxvii) un grupo azetidínilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoílo C1-C6 y grupo benzoílo,
 (lxviii) un grupo azetidínalquilo C1-C6 que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoílo C1-C6 y un grupo benzoílo,
 (lxix) un grupo tetrazolilo,
 55 (lxx) un grupo indolinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (lxxi) un grupo triazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo alquiltio C1-C6,
 (lxxii) un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos carbamoílo,
 (lxxiii) un grupo oxazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6,
 60 (lxxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6,
 (lxxv) un grupo bencimidazolilo,
 (lxxvi) un grupo dihydrobenzotiazolilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxycarbonilo C1-C6, y
 (lxxviii) un grupo oxazolilalquilo C1-C6 que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6,
 65 (29) un grupo aminoalquilo C1-C6 que puede tener a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo

- alquilo C1-C6, un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo fenilo, un grupo fenilalquilo C1-C6, un grupo benzoílo y un grupo aminoalquilo sustituido (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 como sustituyente/s en el grupo amino)
- 5 (30) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con un solo grupo carbamoílo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno,
- (31) un grupo tiocarbamoílo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6,
- 10 (32) un grupo sulfamoílo,
- (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo C1-C6,
- (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- 15 (36) un grupo imidazolilo,
- (37) un grupo triazolilo,
- (38) un grupo isoxazolilo,
- (39) un grupo piperidinilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alquilfenilsulfonilo C1-C6, un grupo oxo, un grupo hidroxilo y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo
- 20 alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6 y un grupo alcanóilamin C1-C6-alcanóilo C1-C6,
- (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyente/s seleccionado/s del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxialquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo carboxialquilo C1-C6, un grupo alquilcarbamoíl C1-C6-alquilo C1-C6, un grupo carbamoílo, un grupo alcoxilo C1-C6, un grupo carboxilo, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo
- 25 alcoxicarbonilo C1-C6 y un grupo benzoílo), un grupo piperidinilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6 y un grupo benzoílo), grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6 como sustituyente/s), un grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decilo, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que puede estar presente un solo grupo alquilo C1-C6 como sustituyente), un grupo piridilo, un grupo piridiloxilo, un grupo piridilalcoxilo C1-C6, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un solo grupo oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo fenilalcoxilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxilo C1-C6
- 30 y un grupo alcoxilo C1-C6 sustituido con halógeno en el grupo fenilo), un grupo fenilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxilo C1-C6, un grupo hidroxilo), un grupo feniloxilo (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxilo C1-C6 y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno), un grupo fenilalquilo C1-C6 (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxilo C1-C6 y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno) y un grupo benzoílo (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxilo C1-C6),
- (41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener, como sustituyente/s, de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo hidroxialquilo C1-C6, un grupo carbamoílo, un grupo hidroxilo, un grupo amino (que puede tener, en el grupo amino, de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo benzoílo), un grupo morfolinilalquilo C1-C6, un grupo pirrolidinilalquilo C1-C6, un grupo piperidilalquilo C1-C6, un grupo piperazinilalquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 como sustituyente/s en el grupo piperazinilo), un grupo aminoalquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2
- 50 grupos alquilo C1-C6 como sustituyentes en el grupo amino), un grupo feniloxilo (que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxilo C1-C6 sustituidos con halógeno en el grupo fenilo), un grupo feniloxialquilo C1-C6 (que puede tener uno o varios grupos alcoxilo C1-C6 sustituidos con halógeno en el grupo fenilo) y un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un grupo oxo),
- (42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos como sustituyente/s seleccionado/s del grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo cicloalquilo C3-C8, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo hidroxialquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6-alquilo C1-C6, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo aminoalquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 como sustituyente/s en el grupo amino), un grupo piperidilalquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 como sustituyente/s en el grupo piperidilo), un grupo morfolinilalquilo C1-C6, un grupo pirrolidinilalquilo C1-C6, un grupo 1,3-dioxoranil-alquilo C1-C6, un grupo tetrahydrofurilalquilo C1-C6, un grupo piridilalquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2 grupos fenilo como sustituyente/s en el grupo alquilo C1-C6), un grupo imidazolilalquilo C1-C6, un grupo furilalquilo C1-C6, un grupo pirrolidinilcarbonilalquilo C1-C6, un grupo piperidinilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6, como sustituyente/s), un grupo piridilo (que puede tener en el grupo piridilo de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en grupo alquilo C1-C6, un grupo ciano y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno como sustituyente/s), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo fenilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo C1-C6), un grupo benzoílo, un
- 65

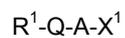
- grupo furilcarbonilo, un grupo ferilalcoxicarbonilo C1-C6 y un grupo oxo,
 (43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,
 (44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyente/s seleccionado/s del grupo
 que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo piridilo,
 5 (45) un grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6,
 (46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo,
 (47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un
 grupo alquilo C1-C6, un grupo piperidilalquilo C1-C6 y un grupo fenilo,
 10 (48) un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos fenilo que puede tener de 1 a 3 grupos
 seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxilo inferior C1-C6 y un grupo ciano,
 (49) un grupo azabiciclo[3.2.2]nonilcarbonilo,
 (50) un grupo 8-azabiciclo[3.2.1]octilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos feniloxilo sustituidos o no
 sustituidos con halógeno,
 (51) un grupo indolinilcarbonilo,
 15 (52) un grupo tetrahydroquinolinilcarbonilo,
 (53) un grupo tetrahidropirido[3,4-b]indolilcarbonilo,
 (54) un grupo morfolinilalquilo C1-C6,
 (55) un grupo piperazinilalquilo C1-C6 que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6 en el grupo piperazinilo,
 (56) un grupo morfolinilcarbonilalquilo C1-C6,
 20 (57) un grupo piperazinilcarbonilalquilo C1-C6 que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6 en el grupo
 piperazinilo,
 (58) un grupo oxo,
 (59) un grupo aminoalcoxilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 en el grupo amino),
 (60) un grupo alcoxi C1-C6-alcoxilo C1-C6,
 25 (61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo,
 un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanofilo C1-C6 y un grupo alcoxicarbonilo C1-C6,
 (62) un grupo morfolinilo,
 (63) un grupo 1,3,8-triazaspiro[4.5]decanilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que
 consiste en un grupo oxo y un grupo fenilo,
 30 (64) un grupo tetrahidropiridilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos piridilo,
 (65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener un solo grupo tioxo y
 (66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decanilo.

3. El compuesto según la reivindicación 1 ó 2, en el que A es un grupo alquileo C1-C6.
 35
4. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto heterocíclico de la fórmula general (1) o una de sus
 sales según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, como ingrediente activo, y un vehículo farmacéuticamente
 aceptable.
- 40
5. Un compuesto heterocíclico de la fórmula (1) o una de sus sales según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3,
 para su uso como un fármaco
6. Un compuesto heterocíclico de la fórmula (1) o una de sus sales según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5,
 para su uso en un procedimiento para tratar o prevenir un trastorno del sistema nervioso central.
 45
7. Un compuesto para su uso según la reivindicación 6, en el que el trastorno del sistema nervioso central se
 selecciona del grupo que consiste en esquizofrenia, esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; trastorno emocional;
 trastorno psicótico; trastorno del estado de ánimo; trastorno bipolar de tipo I; trastorno bipolar de tipo II; depresión;
 depresión endógena; depresión principal; melancolía y depresión refractaria; trastorno distímico; trastorno ciclotímico;
 50 ataque de pánico; trastorno de pánico; agorafobia; fobia social; trastorno obsesivo-compulsivo; trastorno de estrés
 post-traumático, trastorno de ansiedad generalizada; trastorno de estrés agudo; histeria; trastorno de somatización;
 trastorno de conversión; trastorno de dolor; hipocondriasis; trastorno facticio; trastorno disociativo; disfunción sexual;
 trastorno del deseo sexual; trastorno de excitación sexual; disfunción eréctil; anorexia nerviosa; bulimia nerviosa;
 trastorno del sueño; trastorno de ajuste; alcoholismo; intoxicación por alcohol; toxicomanía; intoxicación por
 55 estimulantes; narcotismo; anhedonia; anhedonia iatrogénica; anhedonia por causa psíquica o mental; anhedonia
 asociada con depresión; anhedonia asociada con esquizofrenia; delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo
 asociado con la enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y otras enfermedades neurodegenerativas;
 deterioro cognitivo causado por la enfermedad de Alzheimer; enfermedad de Parkinson; enfermedad de Parkinson y enfermedades
 neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia
 60 refractaria, intratable o crónica; vómitos; mareo por movimiento; obesidad; migraña; dolor; retraso mental; trastorno de
 autismo (autismo); trastorno de Tourette; trastorno de tic; trastorno de déficit de atención/hiperactividad; trastorno de la
 conducta; y síndrome de Down.
8. Un procedimiento de producción de un compuesto heterocíclico representado por la fórmula (1):
 65



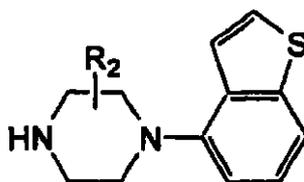
[en la que R_1 , R_2 y A son como se definen en la reivindicación 1], o una de sus sales, **caracterizado porque** comprende una reacción de un compuesto representado por la fórmula:

5



[en la que R^1 y A son como se definen anteriormente, y X_1 representa un átomo de halógeno o un grupo que produce una reacción de sustitución igual a la producida en un átomo de halógeno] o una de sus sales con un compuesto representado por la fórmula:

10



[en la que R_2 es como se define anteriormente] o una de sus sales.

15